



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

05-22466

EXPEDIENTE No.

1. TITULO

HETEROCICLILPirimidinas sustituidas

1. CLASIFICACION INTERNACIONAL

1. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

Monheim, República Federal de Alemania.

1. APODERADO

ENCILLO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén.

2. BOGOTA, D.C.,

Handwritten signature

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 05822466 00000000

Folios: 264

Fecha (M/D): 2003-03-10 17:40:18

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

ación

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL****1****SOLICITUD DE:**

Patente de Invención.



Patente de Modelo de Utilidad.



Capítulo I.



Capítulo II.

2**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de la República Federal de
Alemania
Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50,
40789 Monheim,
República Federal de Alemania
Domicilio: Monheim,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACION

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual _____

Número: _____

3**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: EMILIO FERRERO,
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 217 92 11
E-mail: clientes@camyp.com.
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACION

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual _____

Número: 438.019 T.P. 31.929**4****INVENTOR (ES)
(72)**

- | | |
|---|--|
| 1. Rüdiger FISCHER
Zu den Fussfällen 23,
50259 Pulheim,
República Federal de Alemania | 2. Bernd ALIG
Im Rothsleben 7,
53639 Königswinter,
República Federal de Alemania |
| 3. Thomas BRETSCHNEIDER
Talstr. 29b,
53797 Lohmar,
República Federal de Alemania | 4. Fritz MAURER
Brunnenstr. 11,
74348 Lauffen,
República Federal de Alemania |
| 5. Christoph ERDELEN
Unterbüschhof 15,
42799 Leichlingen,
República Federal de Alemania | 6. Jörg KONZE
Magazinstr. 61,
51147 Köln,
República Federal de Alemania |
| 7. Peter LÖSEL
Lohrstr. 90a,
51371 Leverkusen,
República Federal de Alemania | 8. Yukiyoshi WATANABE
Hanagaki 2-8-24,
Oyama, Tochigi 323,
Japón |

5**PCT (86)**Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/008881Fecha: 11 de agosto de 2003Publicación Internacional No. WO 2004/026858 A1Fecha: 01 de abril de 2004**6****Título (54)****HETEROCICLILPIRIMIDINAS SUSTITUIDAS**

7

Clasificación Internacional (51) C07D 401/04, 409/04, 417/04, 403/04, A01N 43/54

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐

DE

23 de agosto de 2002

102 38 725.7

9

Comprobante de pago No.: 05 - 16,943 Fecha: 07 de marzo de 2005

10

Anexos:



Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 443.000.00.



Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.



Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.



Poderes, si fuere el caso.



Documento de cesión del Inventor al solicitante o a su causante.



Declaraciones. De acuerdo con la Regla 4.17 (II) del PCT con relación a la autorización de la compañía solicitante a solicitar y obtener una patente por la relación laboral con los Inventores y un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud Internacional del 24 de Octubre de 2002 y de acuerdo con la regla 4.17 (III) del PCT con relación a la autorización del solicitante de reivindicar la prioridad de solicitud de patente anterior (No.10238725.7) por un acuerdo entre el solicitante original y el solicitante de la solicitud Internacional del 19 de mayo de 2003.



Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)



Traducción de la solicitud Internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)



Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.



Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.



De ser el caso, copia del contrato de acceso.



De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.



De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.



Arte final 12x12



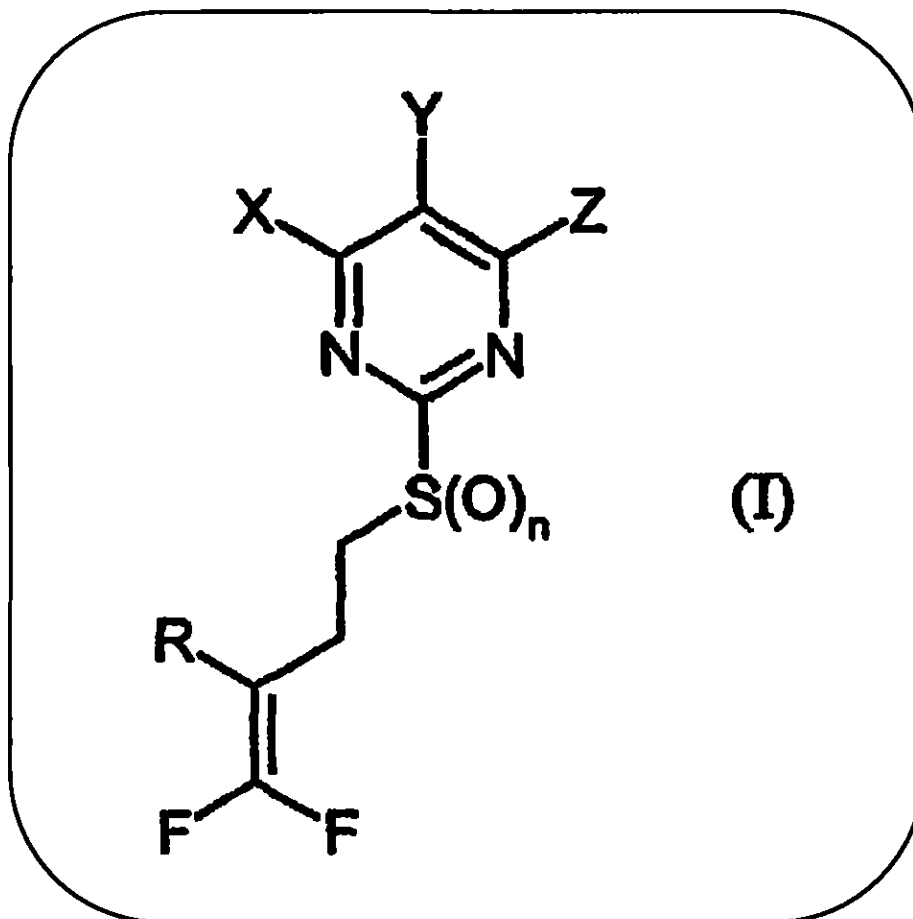
De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.



Otros: Traducción a español de las declaraciones contenidas en la Solicitud PCT con relación a la autorización de la compañía a solicitar y obtener una patente y a reivindicar una prioridad.

11

FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DLM

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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF- ATTORNEY

13549
10966

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

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

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 3555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in his absence, shall state their intention not to exercise representation through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointed alternates is to be definitely absent, the following alternate shall replace him. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

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

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

5
istrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
alco (1) arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes
atos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y
seños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas,
defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales,
enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de
origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio,
cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos;
b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor,
oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial,
nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la
protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles,
penales, administrativos o contencioso administrativos relacionados con
estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos
promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan
sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del
proceso, desistír, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de
agentes oficiosos.

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

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

en/in Leverkusen

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

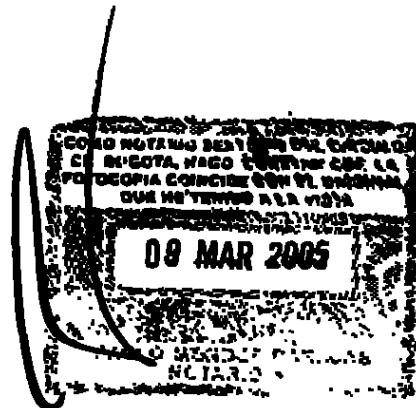
Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Ha. BL

ff



6

ATENTIFICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

ascribo Notario Certifica: Que la firma que antecede de

Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo

de Secretarias

de la compañía Bayer CropScience AG

sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a

las leyes de Alemania

que la dirección de dicha compañía es Alfred Nobel-Str.

50, 40789 Monheim, Alemania

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

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

Dado y firmado en Leverkusen

el 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

is authentic, that the signatory currently acts in the position of

secretaries

of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of

Germany

that the address is Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Monheim, Germany

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

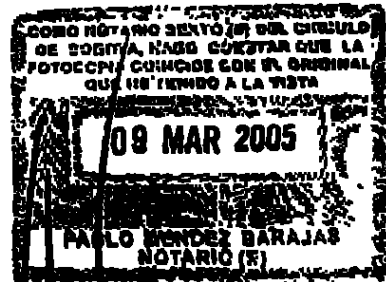
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



2

URNr. 242/2003

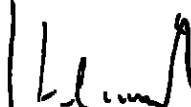
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

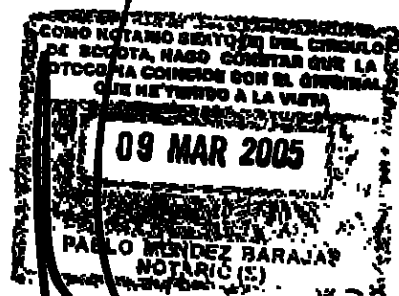
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

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

Leverkusen, den 12. Februar 2003

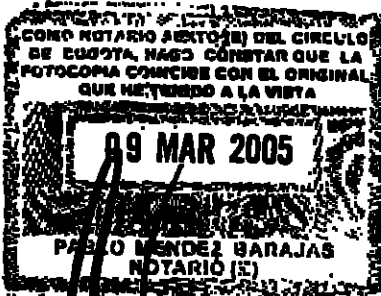

Notar



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. Ist unterschrieben von Dirk Heiderhoff
3. In seiner Eigenschaft als Notar _____
4. sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (der) Notars Dirk Heiderhoff
in Leverkusen
- Bestätigt 17. FEB. 2003
5. in Köln 6. am _____
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr. 482103
9. Stempel/Siegel: 10. Unterschrift: Carin Caliebe



GebS 100
Z. 10.-
Z. 10.-
Z. 13.-
Z. 528
Z. 68,08

Notar

8

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

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

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003

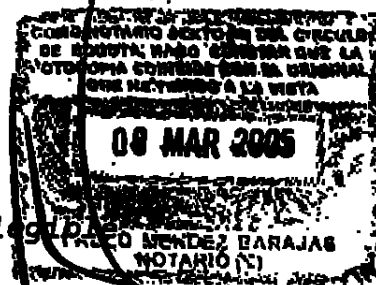
en Leverkusen

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

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

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

DIEGO F. VARGAS Z.

TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 19991

9

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

Firma Ilegible
Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

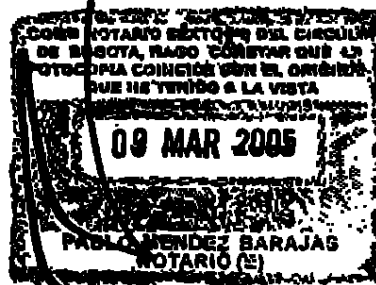
Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el 12 de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

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

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

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



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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HACE CONSTAR QUE LA(S) ANTERIORES FIR-
MA(S) PUESTA(S) POR

[Signature]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

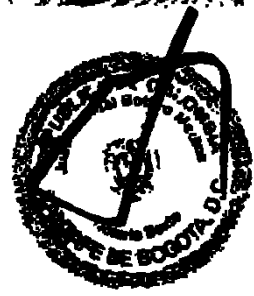
ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208992
[Signature]

NOTA: FIRMA PARA RECEBER EL
DOCUMENTO QUE SE EMPEÑA
LAS CUNTS QUE INDICADAS
18-9 MAR 2005
PABLO ALBERTO BARAJAS
NOTARIO (E)



D

TRADUCCION OFICIAL No. 9450

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

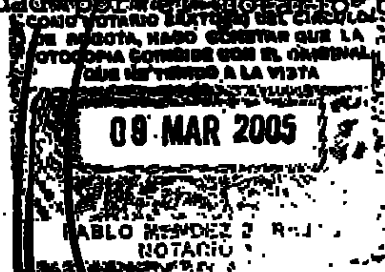
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO,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

Autenticación en español e inglés de las firmas antecedentes y certificación de existencia de la sociedad ~~permanente~~ de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUC/O F. OFICIAL
Luz Arriaga de Herber
Recebo en el día 12 de febrero de 2003

Protocolo notarial 242/2003

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

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

a quienes conozco en persona.

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

Leverkusen, 12 de febrero 2003

(Hilo y oblea notarial)

Fdo.: firma ilegible, Notario

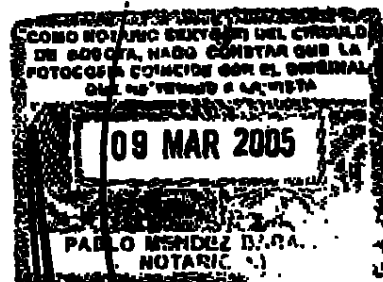
Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-



1122 APRIL 14 DE HERBER
TRACUION...
Resolución N ... JUSTICIA

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993
Copia para aparecer en el
documento de emperera
las funciones indicadas

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEF. E. LEGISLACIONES
BAGUATIA D.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE BOGOTA, HA CONSTATADO QUE ANTERIOR(ES) FIRMA(S) FUERON POR

Guillermo de la Herreria

IDENTIFICADOS CON C.C. No. (s)

ES(SON) AUTENTICADO(S)

SANTA FE DE BOGOTA

18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HA CONSTATADO QUE LA FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL QUE SE TIENE A LA VISTA

09 MAR 2005

ALO MENDEZ DIAZ JAS
NOTARIO (S)

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
1. April 2004 (01.04.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/026858 A1 not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 401/04, 409/04, 417/04, 403/04, A01N 43/54

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/008881

(22) Internationales Anmeldedatum:
11. August 2003 (11.08.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102 38 725.7 23. August 2002 (23.08.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-No-
bel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

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

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches 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 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): FISCHER, Rüdiger [DE/DE]; Zu den Fussfüßen 23, 50259 Pulheim (DE). ALIG, Bernd [DE/DE]; Im Rothsiepen 7, 53639 Königswinter (DE). BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Talstr. 29 b, 53797 Lohmar (DE). MAURER, Fritz [DE/DE]; Brahmsstr. 36, 40789 Monheim (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbläckerhof 15, 42799 Leichlingen (DE). KONZE, Jörg [DE/DE]; Magazinstr. 61, 51147 Köln (DE). LÖSEL, Peter [GB/DE]; Lohrstr. 90a, 51371 Leverkusen (DE). WATANABE, Yukioyoshi [JP/JP]; Hanagaki 2-8-24, Oyama, Tochigi 323 (JP).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

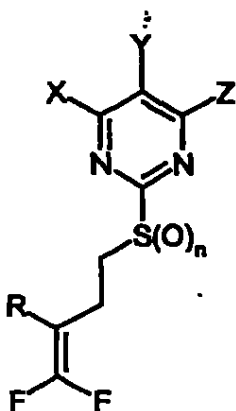
— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches 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 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

de A 36 304

(54) Title: SUBSTITUTED HETEROCYCLYL PYRIMIDINES

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE HETEROCYCLYL PYRIMIDINE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to substituted heterocyclylpyrimidines of formula (I) wherein n represents 0, 1 or 2, R represents hydrogen or fluorine, and X, Y and Z have the designation cited in the description. The invention also relates to a method for producing said substituted heterocyclylpyrimidines, and to the use of the same as pesticides.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte Heterocyclylpyrimidine der Formel (I), worin n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht, R für Wasserstoff oder Fluor steht, und X, Y und Z die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, Verfahren zu deren Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

WO 2004/026858 A1

14

WO 2004/026858 A1



- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

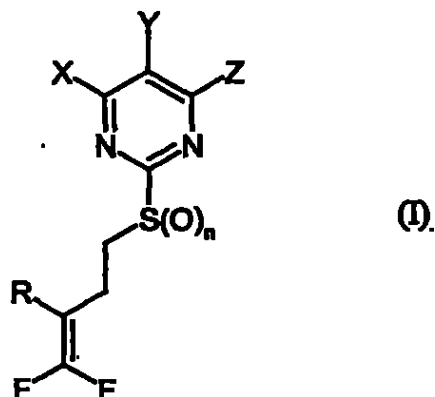
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Substituierte Heterocyclpyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Heterocyclpyrimidine, verschiedene Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte substituierte Pyrimidine zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen geeignet sind (vgl. EP 0 506 270 A1 / US 5,246,938 A, WO 94/06777 A1 / US 5,684,011 A, WO 99/52 874 A1). Diese bekannten substituierten Pyrimidine haben jedoch aufgrund verschiedener Nachteile keine Bedeutung als Schädlingsbekämpfungsmittel erlangt.

Es wurden nun neue substituierte Heterocyclpyrimidine der Formel (I)



gefunden, in welcher

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

R für Wasserstoff oder Fluor steht,

X, Y und Z unabhängig voneinander

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Halogen,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen,

für Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil,

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für eine Benzo-Gruppierung oder für Alkylen oder Alkenylen mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoffatome unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

und zumindest einer der Reste X, Y oder Z

für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen und mit bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine oder zwei Oxo-Gruppierungen (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 4 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls Cyano, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxy-carbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil; Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder entsprechende Isomerengemische in unterschied-

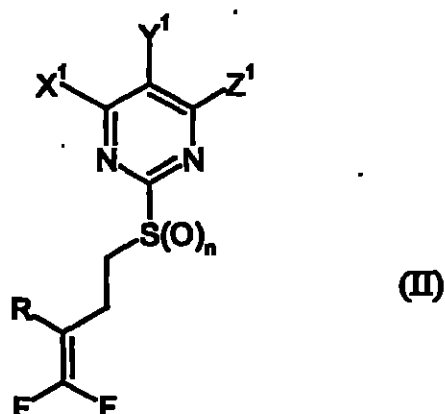
- 4 -

licher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomeren als auch die Isomengemische werden erfindungsgemäß beansprucht. Ebenso können Verbindungen der Formel (I) gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten in verschiedenen tautomeren Formen vorliegen. Die Tautomere sind ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind weiterhin alle möglichen N-Oxide, die durch Verbindungen der Formel (I) gebildet werden können sowie alle Salze von Verbindungen der Formel (I), z.B. mit Mineralsäuren wie der Salzsäure.

Weiter wurde gefunden, dass man die neuen substituierten Heterocyclpyrimidine der Formel (I) erhält, wenn man

(a) halogen-substituierte Pyrimidine der Formel (II),



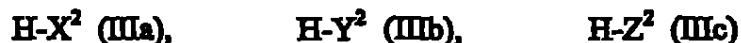
in welcher

n und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X¹, Y¹ und Z¹ die jeweils oben für die entsprechenden Reste X, Y und Z angegebenen Bedeutungen haben, jedoch in keinem Fall für eine Heterocycl-Gruppierung stehen,

und mindestens einer der Reste X¹, Y¹ oder Z¹ für Halogen steht,

mit Heterocyclen der Formel (IIIa), (IIIb) oder (IIIc)



in welcher

X^2 , Y^2 und Z^2 für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen und mit bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine Oxo-Gruppierung (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 4 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkinylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-

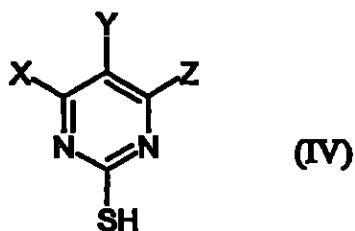
- 6 -

C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₂-Alkylendioxy oder C₁-C₂-Haloalkylendioxy substituiert sind,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

oder wenn man

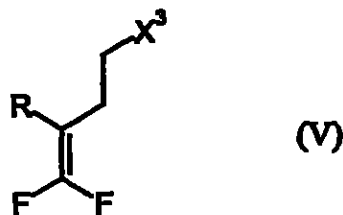
(b) Heterocyclpyrimidinthiole der Formel (IV),



in welcher

X, Y und Z, die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Fluoralkenylhalogeniden der Formel (V),



in welcher

R die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X³ für Halogen steht,

- 7 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

und gegebenenfalls die gemäß Verfahren (a) oder (b) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in andere Verbindungen der Formel (I) gemäß der obigen Definition umwandelt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen substituierten Heterocyclpyrimidine der Formel (I) sehr gute Wirksamkeit gegenüber tierischen Schädlingen, insbesondere gegen Insekten, Spinnentiere und Nematoden, ganz besonders gegen Nematoden aufweisen und sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwenden lassen.

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl oder Alkenyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy - jeweils geradkettig oder verzweigt.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein; wobei bei Mehrfachsubstitution die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend aufgeführten Formeln vorhandenen Reste sind im Folgenden angegeben.

n steht bevorzugt für die Zahlen 0 oder 2.

R steht bevorzugt für Wasserstoff.

R steht weiterhin bevorzugt für Fluor.

X, Y und Z stehen unabhängig voneinander bevorzugt

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Halogen,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkynyloxy oder Alkynyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen,

für Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio (wobei jeweils Halogen bevorzugt für Fluor oder Chlor steht) oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für eine Benzo-Gruppierung oder für Alkylen oder Alkenylen mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3

Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoffatome unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiert ist, und wobei

zumindest einer der Reste X, Y oder Z bevorzugt für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocycl-Gruppierung mit 4, 6, 9 oder 10 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine oder zwei Oxo-Gruppierungen (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkynyloxy oder Alkynyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio (wobei jeweils Halogen bevorzugt für Fluor oder Chlor steht), C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Methylendioxy oder Difluormethylendioxy substituiert sind.

n steht besonders bevorzugt für 0.

X, Y und Z stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Fluor, Chlor, Brom,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino, Di-i-propylamino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl,

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl,

für Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für Trimethylen, Tetramethylen, Propen-1,3-diyl oder Butadien-1,4-diyl stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoffatome unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiert ist, und wobei

zumindest einer der Reste X, Y oder Z besonders bevorzugt für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indazolyl, Tetrahydroindazolyl, Oxopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, 2,5-Dioxo-1-aza-cyclopentyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Imidazolyl, Triazolyl, Benzotriazolyl, Oxotriazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, 1,4-Dihydro-4-oxo-pyridin-1-yl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, Pyrazinyl, Pyrid-

azinyl, Pyrimidinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholinyl steht, welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Fluor; Chlor; Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino, Di-i-propylamino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlor-difluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-,

i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylendioxy oder Difluormethylendioxy substituiert sind.

X, Y und Z stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung aus der Reihe Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl, Triazolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Pyridinyl, Chinolinyl, Pyridazinyl oder Morpholinyl, welche gegebenenfalls bis zu 2, bevorzugt 1 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Fluor; Chlor; Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Phenyl,

wobei Y vorzugsweise für Wasserstoff steht, und einer der beiden Reste X oder Z für einen der genannten Heterocyclen steht, während der verbleibende der beiden Reste X oder Z wiederum für Wasserstoff steht.

Eine ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

n, R, X, Y und Z die vorstehend als besonders bevorzugt angegebene Bedeutung haben, wobei Y vorzugsweise für Wasserstoff steht,

und wenigstens einer der Reste

X oder Z für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indazolyl, Tetrahydroindazolyl, Oxopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, 2,5-Dioxo-1-aza-cyclopentyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Imidazolyl, Triazolyl, Benztriazolyl, Oxotriazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, 1,4-Dihydro-4-oxo-pyridin-1-yl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholinyl steht, welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Fluor; Chlor; Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino, Di-i-propylamino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylamino-

sulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylendioxy oder Difluormethylendioxy substituiert sind,

und wobei der gegebenenfalls verbleibende Rest X oder Z bevorzugt für Wasserstoff steht.

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe sind diejenigen Verbindungen der Formel (I), in welcher

n, R, X und Z die vorstehend als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutung haben, wobei X und Z vorzugsweise für Wasserstoff stehen, und

Y für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Oxopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Triazolyl, Benzotriazolyl, Oxotriazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiazolyl,

Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Chinoliny, Isochinoliny, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholiny, steht, welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Fluor, Chlor, Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino, Di-i-propylamino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-

Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl substituiert sind.

Verbindungen der Formel (I), in welchen R jeweils für Wasserstoff oder Fluor steht, stehen gleichberechtigt nebeneinander. Beide Verbindungsgruppen sind unabhängig voneinander Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

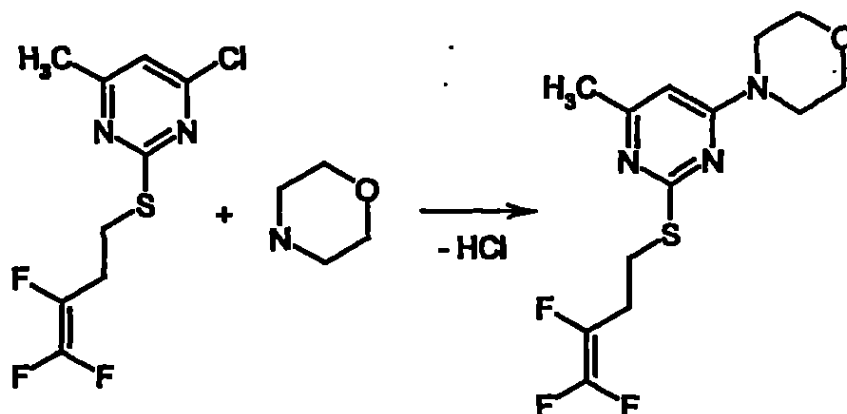
Erfindungsgemäß bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

Erfindungsgemäß besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

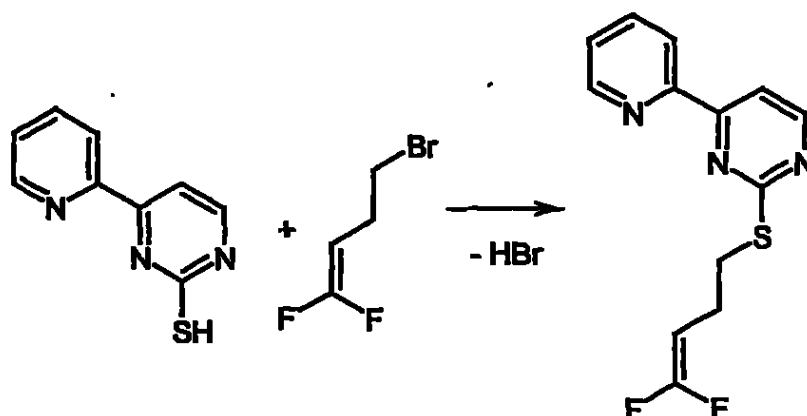
Erfindungsgemäß ganz besonders bevorzugt sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen eine Kombination der vorstehend als ganz besonders bevorzugt aufgeführten Bedeutungen vorliegt.

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

Verwendet man beispielsweise 4-Chlor-6-methyl-2-[(3,4,4-trifluor-3-butenyl)thio]-pyrimidin und Morpholin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Verwendet man beispielsweise 4-(Pyridin-2-yl)pyrimidin-2-thiol und 4-Brom-1,1-difluor-1-buten als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema skizziert werden:

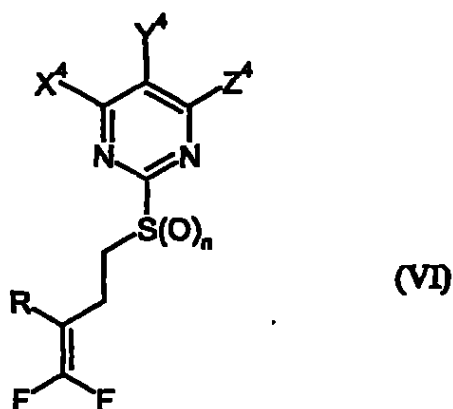


Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe zu verwendenden halogen-substituierten Pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben n und R bevorzugt bzw. besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt für n und R angegeben worden sind. X¹ hat bevorzugt die oben für X als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt angegebene Bedeutung; Y¹ hat bevorzugt die oben für Y als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders

bevorzugt angegebene Bedeutung und Z^1 hat bevorzugt die oben für Z als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt angegebene Bedeutung, wobei mindestens einer der Reste X^1 , Y^1 oder Z^1 für Halogen, vorzugsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Fluor, Chlor oder Brom steht und keiner dieser Reste für Heterocyclyl steht.

Die Ausgangsstoffe der allgemeinen Formel (II) sind weitgehend bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. insbesondere EP 506 270 A1 sowie WO 94/06 777 A1 und die Herstellungsbeispiele).

So erhält man die halogen-substituierten Pyrimidine der Formel (II), wenn man entsprechende Hydroxypyrimidine der allgemeinen Formel (VI),



in welcher

n und R die oben angegebene Bedeutung haben,

X^4 , Y^4 und Z^4 die jeweils oben für die entsprechenden Reste X, Y und Z angegebenen Bedeutungen haben, jedoch in keinem Fall für eine Heterocyclyl-Gruppierung stehen,

und mindestens einer der Reste X^4 , Y^4 oder Z^4 für Hydroxy steht,

mit einem „Halogenierungsmittel“, d.h. einer zur Einführung von Halogen-Substituenten an Stelle von Hydroxy-Gruppen in Heterocyclen geeigneten Chemikalie, wie z.B. Phosphorylchlorid („Phosphoroxychlorid“), Thionylchlorid oder Phosgen, bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C umgesetzt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die hierzu als Vorprodukte benötigten Hydroxypyrimidine der allgemeinen Formel (VI) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 506 270 A1 / US 5,246,938 A, WO 94/06777 A1 / US 5,684,011 A, Herstellungsbeispiele).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Heterocyclen sind durch die Formeln (IIIa), (IIIb) und (IIIc) allgemein definiert. In diesen Formeln haben X^2 bzw. Y^2 bzw. Z^2 bevorzugt diejenige Bedeutung, die oben für die Heterocyclyl-Gruppierung als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt angegeben worden ist.

Die Heterocyclen der Formeln (IIIa), (IIIb) und (IIIc) sind bekannte organische Chemikalien.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Heterocyclylpyrimidinthiole sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In der Formel (IV) haben X, Y und Z bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt für X, Y und Z angegeben worden sind.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Dokl. Bolg. Akad. Nauk 24 (1971), 247-250 – zitiert in Chem. Abstracts 75:5841; Aust. J. Chem. 33 (1980), 2291-2298;

Organic Preparations and Procedures International 29 (1997), 285-292; WO 98/27092; Tetrahedron Lett. 40 (1999), 4779-4782).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Fluoralkenylhalogenide sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In der Formel (V) hat R bevorzugt diejenige Bedeutung, die oben für R als bevorzugt bzw. als besonders bevorzugt angegeben worden ist; X^3 steht vorzugsweise für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, insbesondere für Chlor oder Brom.

Die Ausgangsstoffe der Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 334 796 A1, EP 660 827 A1, EP 712 395 A1, EP 749 433 A1, EP 850 211 A1).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel für die erfindungsgemäßen Verfahren kommen im Allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Natrium-, Kalium- oder Calciumacetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumamid, Natrium-, Kalium-, Cäsium- oder Calciumcarbonat, Natrium-, Kalium- oder Calciumhydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumhydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumhydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -ethanolat, -n- oder -i-propylnolat, -n-, -i-, -s- oder -t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-

Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), oder 1,8-Diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-en (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) werden vorzugsweise unter Verwendung eines oder mehrerer Verdünnungsmittel durchgeführt. Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) kommen vor allem inerte organische Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutylketon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Butyronitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) werden im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, die erfindungsgemäßen Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

- 23 -

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) werden die Ausgangsstoffe im Allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuss zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im Allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur geführt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

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

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

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

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

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera* *immaculata*.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

- 25 -

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

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

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

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

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

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

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch hervorragende Wirkung gegen Blattläuse, Käfer, Schmetterlingraupen, Spinnmilben und pflanzenschädigende Nematoden aus.

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

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

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

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

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

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

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabak-

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

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

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

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

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxyquinoline sulfate; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifeaphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobil; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Fumecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil); Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomyacin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine;

Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrole-2,5-dione; 2,3,5,6-Tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolecarboxamide; 2-Chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinecarboxamide; 3,4,5-Trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile; Actinovate; cis-1-(4-Chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate; Monopotassium carbonate; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamide; N-butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amine; Sodium tetrathiocarbonate;

sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Copper hydroxide; Copper naphthenate; Copper oxychloride; Copper sulfate; Cufraneb; Cuprous oxide; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

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

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomere, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541; Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* strain EG-2348, *Bacillus thuringiensis* strain GC-91, *Bacillus thuringiensis* strain NCTC-11821, Baculoviren, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxy-carboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, *Cydia pomonella*, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine,

DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439,

Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, *Entomophthora* spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrinfos,

46

Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenoethiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fempropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfiothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipromil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocyclothrinate, Flucycloxyuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzoxfos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosfiazate, Fubfenprox (Fluproxifen), Furathiocarb,

Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren,

Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene,

IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,

Japonilure,

Kadethrin, Kempolyederviren, Kinoprene,

Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,

Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800,

Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron,

- 33 -

OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl,

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,

S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,

Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

- 34 -

XMC, Xylcarb,

ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,

die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbammat (Tsumacide Z),

die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]-octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923),

sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

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

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

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

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

- 35 -

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

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

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

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

der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber

bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

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

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

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

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

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

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

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

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

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

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

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

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige

Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

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

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

Käfer wie *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Kyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachna*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*.

Hautflügler wie *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus angur*.

Termiten wie *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*.

Borstenschwänze wie *Lepisma saccharina*.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

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

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

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vor-

zugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

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

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

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

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung

Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

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

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

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

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

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

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid und Triflumuron,

sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluamid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamate, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octyl-isothiazolin-3-on, sein.

Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

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

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

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

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

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

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

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

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

Molluskizide wie Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb;

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

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

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

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

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

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte

Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam.

Zu diesen Schädlingen gehören:

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kalotermea* spp., *Reticulitermea* spp.

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

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

Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

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

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

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

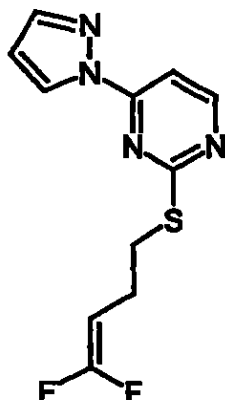
Aus der Ordnung der Anophura z.B. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

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

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

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

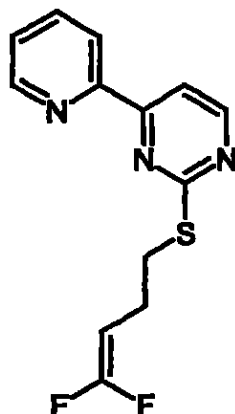
65

Herstellungsbeispiele:**Beispiel 1****(Verfahren (a))**

3,0 g (12,7 mmol) 4-Chlor-2-[(4,4-difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-pyrimidin werden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) mit 9,1 g (27,9 mmol) Cäsiumcarbonat und 0,86 g (12,7 mmol) Pyrazol in 60 ml Acetonitril gegeben und diese Mischung wird 30 Minuten bei Rückfluss gerührt. Der Ansatz wird abgekühlt, abgesaugt, der Rückstand mit Acetonitril gewaschen und das Lösungsmittel abdestilliert. Das Rohprodukt wird durch Chromatographie an Kieselgel mit Dichlormethan als Laufmittel weiter gereinigt.

Man erhält 2,55 g (75 % der Theorie) 2-[(4,4-Difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-4-(pyrazol-1-yl)-pyrimidin als gelbes Öl.

logP (pH 2.3): 3,3

Beispiel 2(Verfahren (b))

5,68 g (30 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 16,58 g (120 mmol) Kaliumcarbonat werden in 100 ml Acetonitril vorgelegt, 5,13 g (30 mmol) 4-Brom-1,1-difluor-but-1-en dazu gegeben und die Reaktionsmischung 16 Stunden bei 60°C gerührt. Anschließend wird unter vermindertem Druck eingeeengt, der Rückstand zwischen Wasser und Dichlormethan verteilt, die wässrige Phase noch zweimal mit Dichlormethan extrahiert, die vereinigten organischen Phasen mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert.

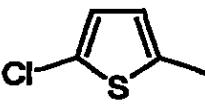
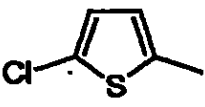
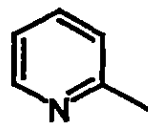
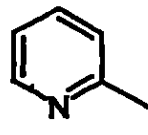
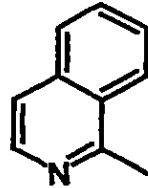
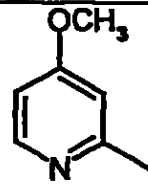
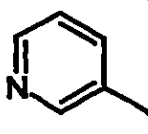
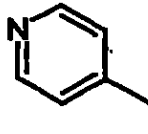
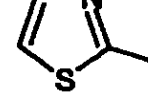
Man erhält 7,6 g (88 % der Theorie) 2-[(4,4-Difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-(4-(2-pyridinyl)-pyrimidin als Öl

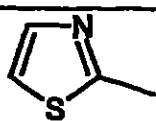
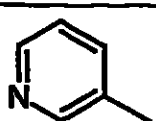
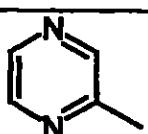
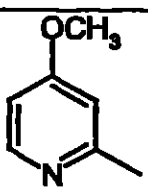
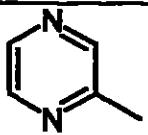
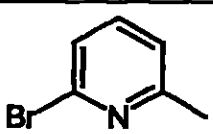
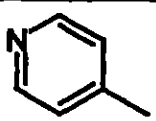
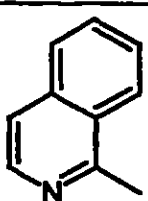
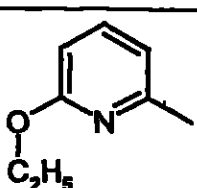
$^1\text{H-NMR}$ (CD_3CN): δ = 2.50 (m, 2H), 3.28 (t, 2H), 4.45 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.95 (m, 1H), 8.05 (m, 1H), 8.45 (m, 1H), 8.70 (m, 2H) ppm.

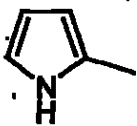
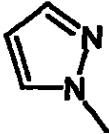
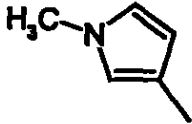
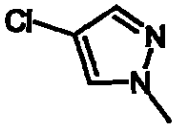
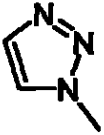
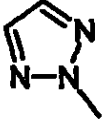
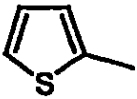
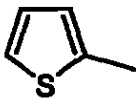
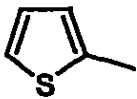
$\log P$ (pH 2,3) = 3,33

Analog zu den Beispielen 1 und 2 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

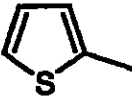
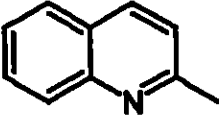
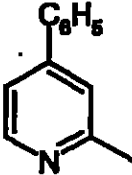
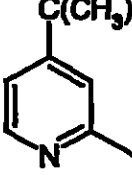
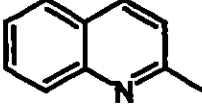
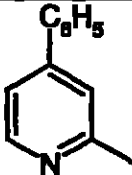
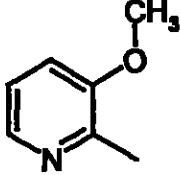
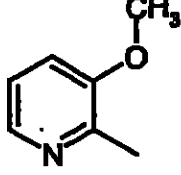
Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

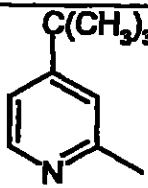
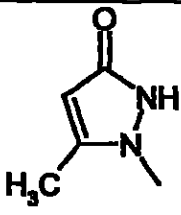
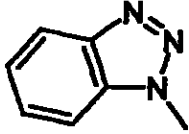
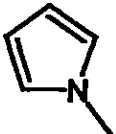
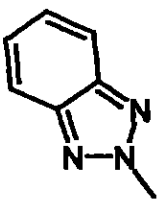
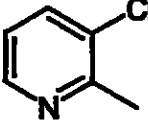
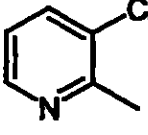
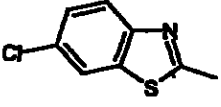
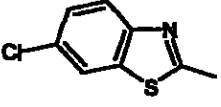
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
3	0	H		H	H	logP = 4,73 ^{a)}
4	0	F		H	H	logP = 4,70 ^{a)}
5	1	H		H	H	logP = 1,47 ^{a)}
6	2	H		H	H	logP = 2,08 ^{a)}
7	0	H		H	H	logP = 3,67 ^{a)}
8	0	H		H	H	logP = 2,41 ^{a)}
9	0	H		H	H	logP = 1,96 ^{a)}
10	0	H		H	H	logP = 1,72 ^{a)}
11	0	H		H	H	logP = 3,33 ^{a)}

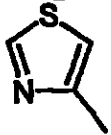
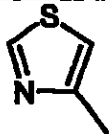
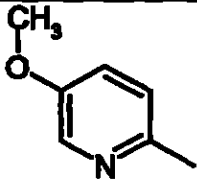
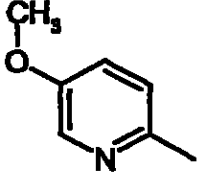
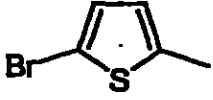
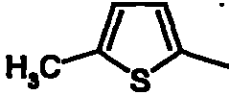
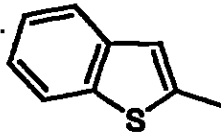
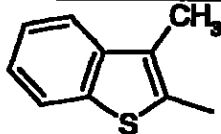
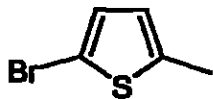
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
12	0	F		H	H	logP = 1,56 ^{a)}
13	0	F		H	H	logP = 2,05 ^{a)}
14	0	H		H	H	logP = 2,91 ^{a)}
15	0	F		H	H	logP = 2,54 ^{a)}
16	0	F		H	H	logP = 2,92 ^{a)}
17	0	H		H	H	logP = 4,51 ^{a)}
18	0	F		H	H	logP = 1,77 ^{a)}
19	0	F		H	H	logP = 3,69 ^{a)}
20	0	H		H	H	logP = 4,91 ^{a)}

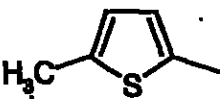
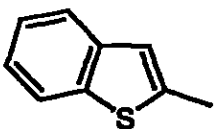
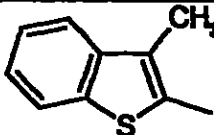
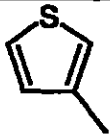
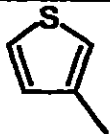
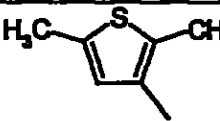
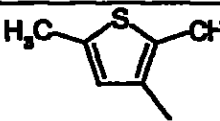
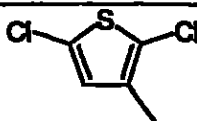
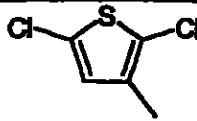
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
21	0	F		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ) 11,68 ppm (NH)
22	0	F		H	H	logP = 3,27 ^{a)}
23	0	F		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ) 3,68 ppm (N- CH ₃)
24	0	H		H	H	logP = 4,13 ^{a)}
25	0	H		H	H	logP = 2,62 ^{a)}
26	0	H		H	H	logP = 2,70 ^{a)}
27	0	H		H	H	logP = 3,83 ^{a)}
28	0	F		H	H	logP = 3,84 ^{a)}
29	1	F		H	H	

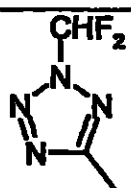
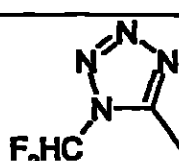
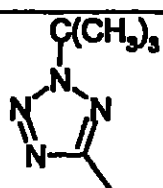
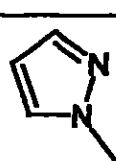
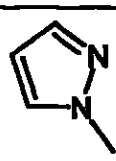
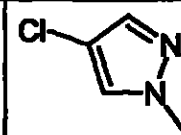
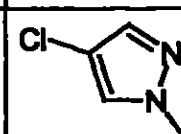
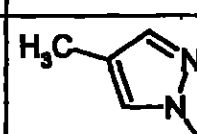
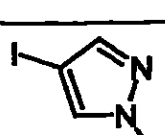
70

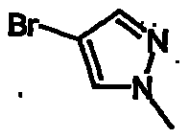
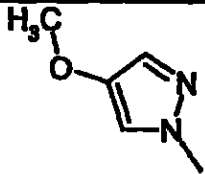
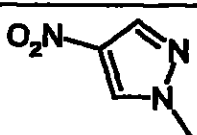
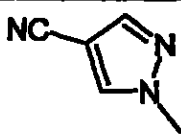
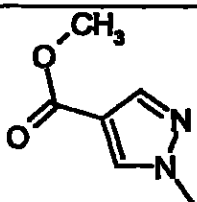
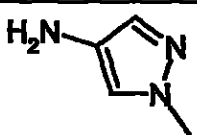
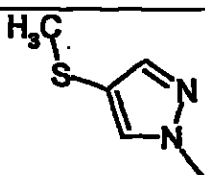
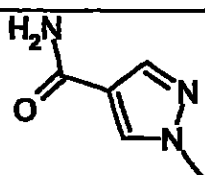
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
30	2	F		H	H	
31	0	H		H	H	logP = 4,81 ^{a)}
32	0	H		H	H	logP = 4,77 ^{a)}
33	0	H		H	H	logP = 4,80 ^{a)}
34	0	F		H	H	logP = 4,81 ^{a)}
35	0	F		H	H	logP = 4,76 ^{a)}
36	0	F		H	H	logP = 2,25 ^{a)}
37	0	H		H	H	logP = 2,14 ^{a)}

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
38	0	F		H	H	logP = 4,81 ^{a)}
39	0	H		H	H	logP = 2,55 ^{a)}
40	0	H		H	H	logP = 3,97 ^{a)}
41	0	F		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ) 2,65 ppm (m, 2H)
42	0	H		H	H	logP = 3,98 ^{a)}
43	0	H		H	H	logP = 3,32 ^{a)}
44	0	F		H	H	logP = 3,35 ^{a)}
45	0	H		H	H	logP = 5,57 ^{a)}
46	0	F		H	H	logP = 5,49 ^{a)}

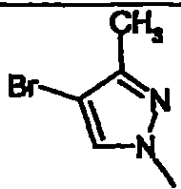
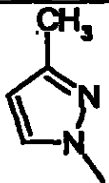
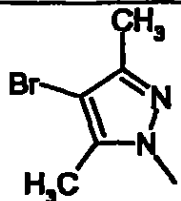
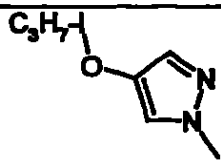
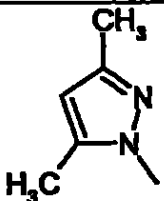
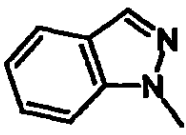
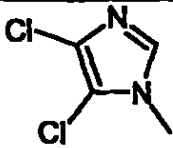
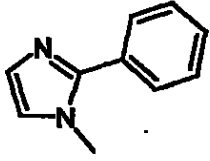
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
47	0	F		H	H	logP = 3,18 ^{a)}
48	0	H		H	H	logP = 3,14 ^{a)}
49	0	F		H	H	logP = 2,17 ^{a)}
50	0	H		H	H	logP = 2,12 ^{a)}
51	0	H		H	H	logP = 4,77 ^{a)}
52	0	H		H	H	logP = 4,30 ^{a)}
53	0	H		H	H	logP = 4,87 ^{a)}
54	0	H		H	H	logP = 5,25 ^{a)}
55	0	F		H	H	logP = 4,73 ^{a)}

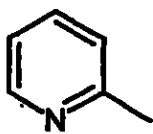
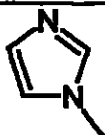
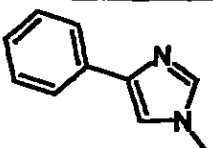
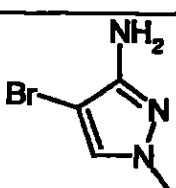
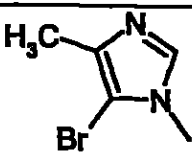
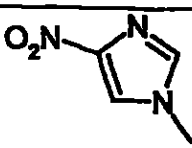
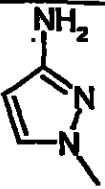
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
56	0	F		H	H	$\log P = 4,31^a)$
57	0	F		H	H	$\log P = 4,85^a)$
58	0	F		H	H	$\log P = 5,20^a)$
59	0	H		H	H	$\log P = 3,80^a)$
60	0	F		H	H	$\log P = 3,82^a)$
61	0	H		H	H	$\log P = 4,79^a)$
62	0	F		H	H	$\log P = 4,79^a)$
63	0	H		H	H	$\log P = 5,65^a)$
64	0	F		H	H	$\log P = 5,55^a)$

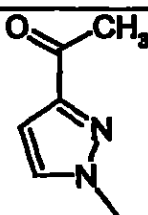
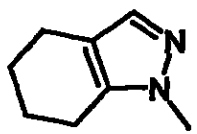
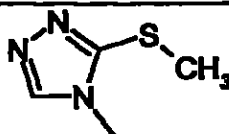
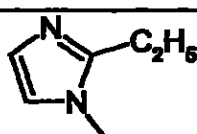
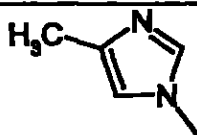
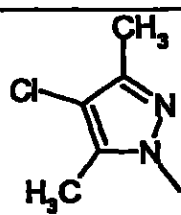
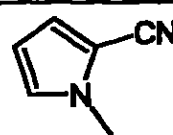
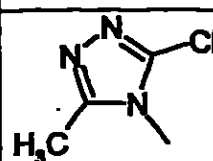
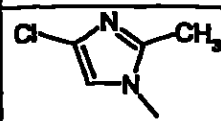
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
65	0	F	H		H	
66	0	F	H		H	
67	0	F	H		H	logP = 4,22 ^{a)}
68	2	H		H	H	logP = 2,01 ^{a)}
69	1	H		H	H	logP = 1,55 ^{a)}
70	2	H		H	H	logP = 2,60 ^{a)}
71	1	H		H	H	logP = 2,09 ^{a)}
72	0	H		H	H	
73	0	H		H	H	logP = 4,34 ^{a)}

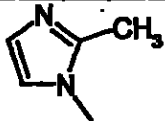
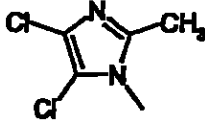
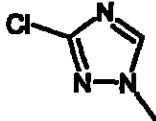
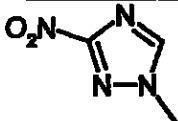
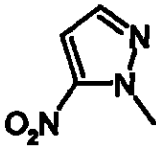
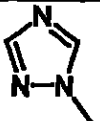
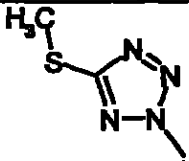
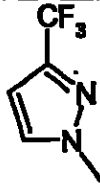
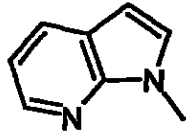
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
74	0	H		H	H	logP = 4,24 ^{a)}
75	0	H		H	H	logP = 3,47 ^{a)}
76	0	H		H	H	logP = 3,48 ^{a)}
77	0	H		H	H	logP = 3,22 ^{a)}
78	0	H		H	H	
79	0	H		H	H	
80	0	H		H	H	logP = 4,00 ^{a)}
81	0	H		H	H	logP = 1,98 ^{a)}

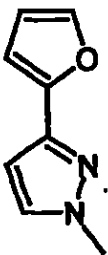
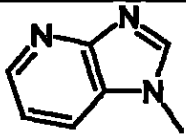
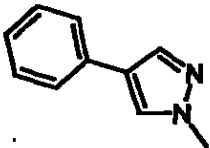
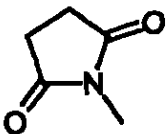
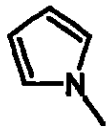
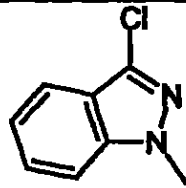
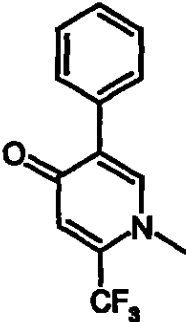
70

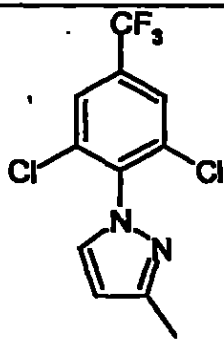
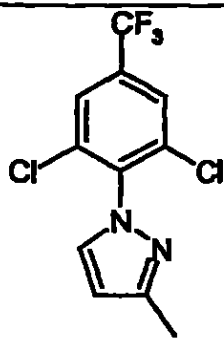
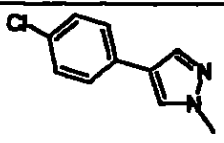
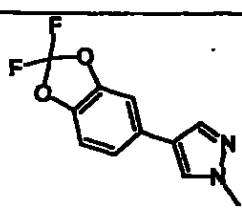
Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
82	0	H		H	H	logP = 4,76 ^{a)}
83	0	H		H	H	logP = 3,64 ^{a)}
84	0	H		H	H	logP = 5,25 ^{a)}
85	0	H		H	H	logP = 4,26 ^{a)}
86	0	H		H	H	logP = 3,95 ^{a)}
87	0	H		H	H	logP = 4,26 ^{a)}
88	0	H		H	H	logP = 3,57 ^{a)}
89	0	H		H	H	logP = 1,99 ^{a)}

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
90	0	H		H	H	logP = 3,14 ^{a)}
91	0	H		H	H	logP = 1,46 ^{a)}
92	0	H		H	H	logP = 3,45 ^{a)}
93	0	H		H	H	logP = 3,15 ^{a)}
94	0	H		H	H	logP = 5,69 ^{a)}
95	0	H		H	H	logP = 3,21 ^{a)}
96	0	H		H	H	logP = 2,63 ^{a)}
97	0	H		H	H	logP = 2,31 ^{a)}

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
98	0	H		H	H	logP = 3,47 ^{a)}
99	0	H		H	H	logP = 4,64 ^{a)}
100	0	H		H	H	logP = 3,39 ^{a)}
101	0	H		H	H	logP = 1,45 ^{a)}
102	0	H		H	H	logP = 1,48 ^{a)}
103	0	H		H	H	logP = 5,13 ^{a)}
104	0	H		H	H	logP = 3,23 ^{a)}
105	0	H		H	H	logP = 3,49 ^{a)}
106	0	H		H	H	logP = 2,99 ^{a)}

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
107	0	H		H	H	logP = 1,30 ^{a)}
108	0	H		H	H	logP = 3,59 ^{a)}
109	0	H		H	H	logP = 3,31 ^{a)}
110	0	H		H	H	logP = 2,95 ^{a)}
111	0	H		H	H	logP = 3,09 ^{a)}
112	0	H		H	H	logP = 2,44 ^{a)}
113	0	H		H	H	logP = 3,34 ^{a)}
114	0	H		H	H	logP = 4,41 ^{a)}
115	0	H		H	H	logP = 4,60 ^{a)}

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
116	0	H		H	H	$\log P = 4,22^a)$
117	0	H		H	H	$\log P = 2,22^a)$
118	0	H		H	H	$\log P = 4,71^a)$
119	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 8,80-8,81 ppm
120	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 3,21 ppm
121	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 3,33 ppm
122	0	H		H	H	$\log P = 4,49^a)$

Bsp.- Nr.	n	R	X	Y	Z	Physikal. Daten
123	0	H		H	H	logP = 5,21 ^{a)}
124	0	F		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 8,65-8,76 ppm
125	0	H		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 4,58-4,67 ppm
126	0	H		H	H	logP = 5,20 ^{a)}

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

(a) Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit ^{a)} markiert.

82

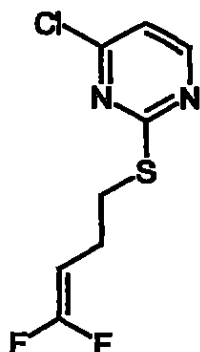
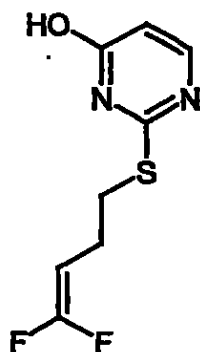
(b) Eluenten für die Bestimmung im neutralen Bereich: 0,01-molare wässrige Phosphatpuffer-Lösung, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril - entsprechende Messergebnisse sind in Tabelle 1 mit b) markiert.

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

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

03

- 69 -

Angangsstoffe der Formel (II):Beispiel (II-1)Stufe 1

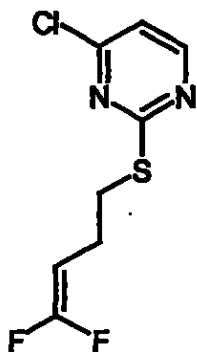
22,5 g (175 mmol) 4-Hydroxy-2-mercapto-pyrimidin werden in 150 ml Ethanol und 150 ml Wasser suspendiert und bei Raumtemperatur (ca. 20°C) wird eine Lösung von 7,0 g Natriumhydroxid in 20 ml Ethanol und 20 ml Wasser dazu gegeben. Anschließend werden tropfenweise 33,0 g (193 mmol) 4-Brom-1,1-difluor-1-buten dazu gegeben und die Mischung wird 30 Minuten bei 60°C gerührt. Nach Abkühlen wird der Ansatz weitere 3 Stunden bei 0°C gerührt und der ausgefallene Niederschlag abgesaugt. Die wässrige Phase wird mit t-Butylmethylether extrahiert, die organische Phase mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert. Man erhält einen gelben Feststoff (12,2 g = 32 % der Theorie als erste Fraktion des gewünschten Produktes). Die wässrige Mutterlange wird mit Kochsalz gesättigt und viermal mit je 100 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Natriumsulfat

- 70 -

getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert. Man erhält einen gelben Feststoff als zweite Fraktion des gewünschten Produktes. Die vereinigten Fraktionen werden aus t-Butyl-methylether umkristallisiert.

Gesamt-Ausbeute: 21.1 g (51 % der Theorie) 4-Hydroxy-2-[(4,4-difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-pyrimidin (Schmelzpunkt: 78°C).

Stufe 2



5,5 g (25,2 mmol) 4-Hydroxy-2-[(4,4-difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-pyrimidin (= 2-[(4,4-Difluor-3-butenyl)-sulfanyl]-4-pyrimidinol) werden bei Raumtemperatur (ca. 20°C) portionsweise zu 38,6 g (23,5 ml, 252 mmol) Phosphoroxychlorid gegeben und die Mischung wird 10 Minuten unter Rückfluss zum Sieden erhitzt. Anschließend wird der Ansatz zu 3/4 am Rotationsverdampfer eingedunstet, der ölige Rückstand in 50 ml Eiswasser getropft, unter Kühlung mit 2N-Natronlauge auf pH 5-6 eingestellt und mehrmals mit Dichlormethan extrahiert. Das Produkt wird nach Abdestillieren des organischen Lösungsmittels unter vermindertem Druck in Form eines gelben Öls erhalten.

Ausbeute: 5,5g (88 % der Theorie)

logP (pH 2.3): 3,3

Anwendungsbeispiele:Beispiel A**Aphis gossypii-Test**

Lösungsmittel:	7	Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator:	2	Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

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

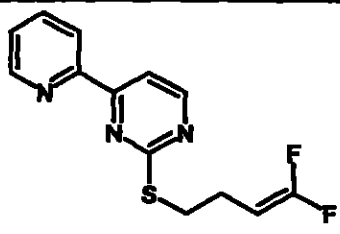
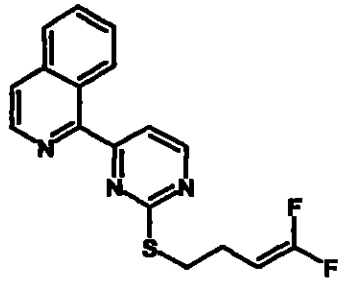
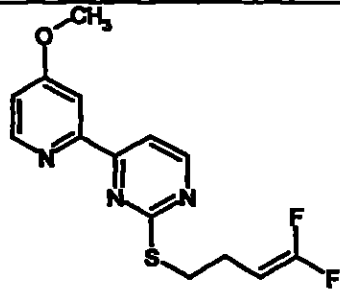
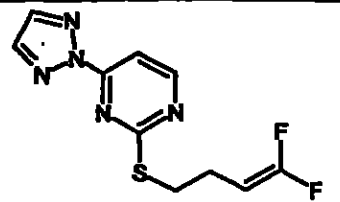
Baumwollblätter (*Gossypium hirsutum*), die stark von der Baumwollblattlaus (*Aphis gossypii*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

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

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

86

Tabelle A
pflanzenschädigende Insekten
Aphis gossypii-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
		
(2)	500	99
		
(7)	500	98
		
(8)	500	99
		
(26)	500	95

Beispiel B**Heliothis armigera-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

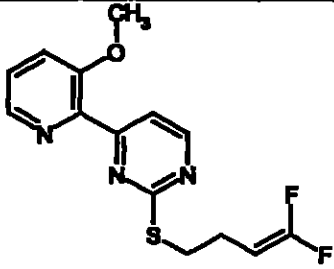
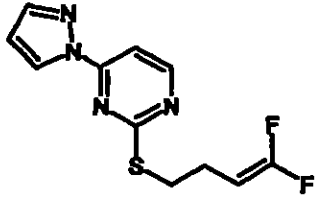
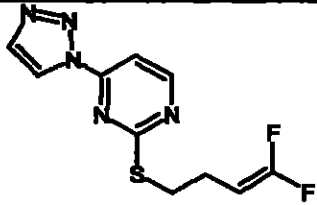
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Sojabtriebe (*Glycine max*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit *Heliothis armigera*-Raupen besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

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

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

Tabelle B
pflanzenschädigende Insekten
***Heliothis armigera*-Test**

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(37)	500	100
		
(1)	500	100
		
(25)	500	100

Beispiel C**Meloidogyne-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

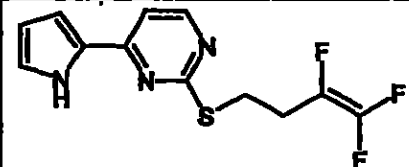
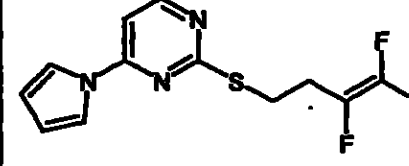
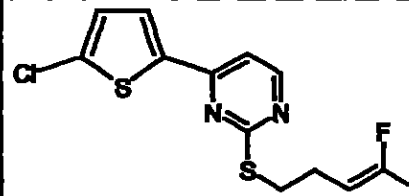
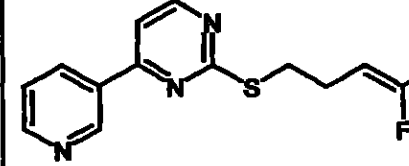
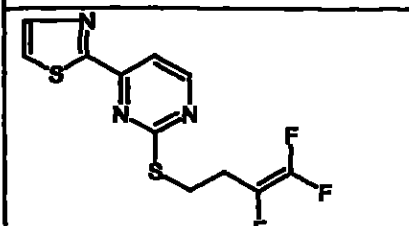
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

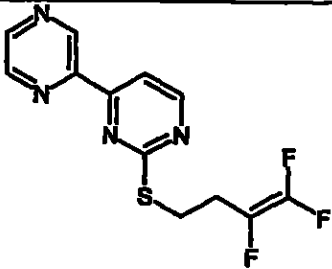
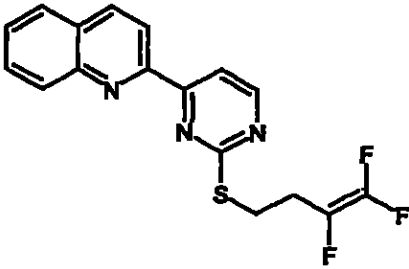
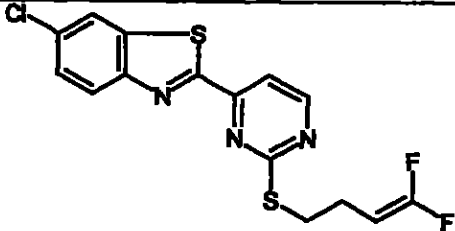
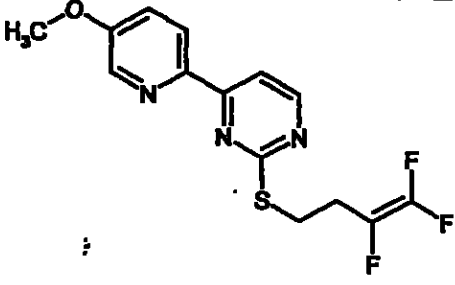
Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass keine Gallen gefunden wurden; 0 % bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

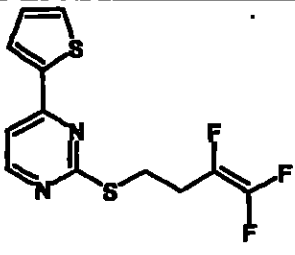
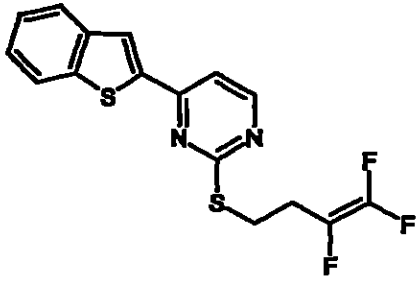
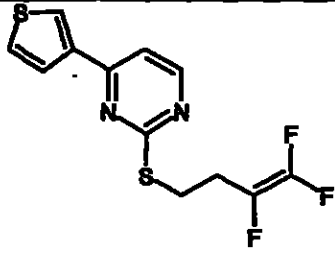
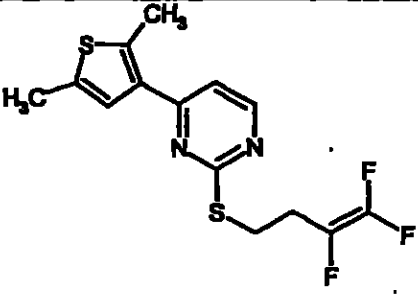
Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen unter anderem aus der Tabelle C hervor. Auch die Verbindungen mit der Beispiel-Nummer 82, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124 und 125 erzielen im oben beschriebenen Test bei einer Konzentration von 20 ppm eine 100 %ige Abtötung.

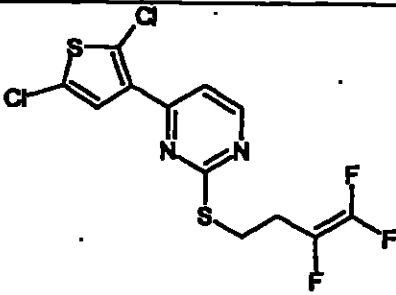
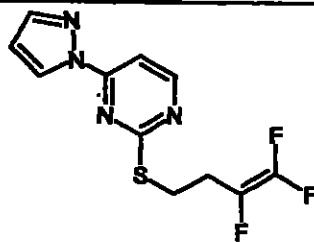
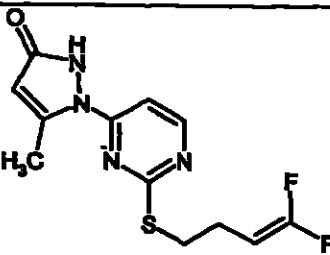
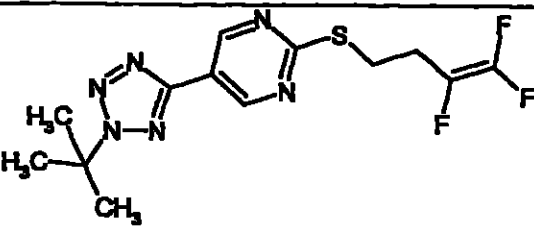
Tabelle C
pflanzenschädigende Nematoden
Meloidogyne-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
		
(21)	20	100
		
(41)	20	100
		
(3)	20	100
		
(9)	20	100
		
(12)	20	100

- 77 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
		
(16)	20	100
		
(34)	20	100
		
(45)	20	100
		
(49)	20	100

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14d
		
(28)	20	100
		
(57)	20	100
		
(60)	20	100
		
(62)	20	100

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 ^d
		
(64)	20	100
		
(22)	20	100
		
(39)	20	100
		
(67)	20	100

Beispiel D**Myzus-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

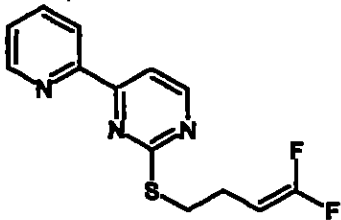
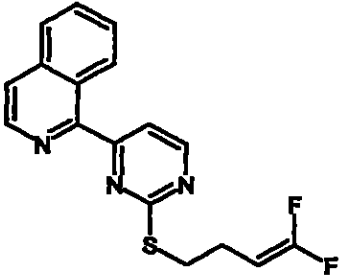
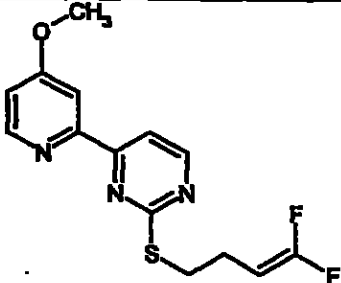
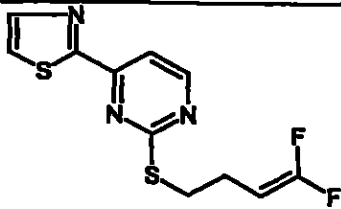
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (*Brassica oleracea*), die stark von der Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

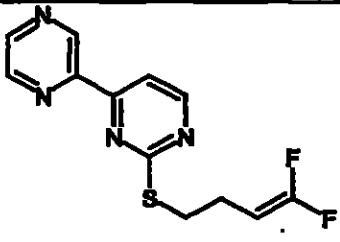
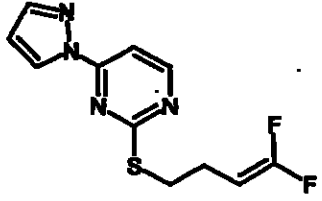
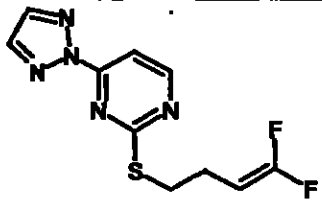
Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

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

Tabelle D
pflanzenschädigende Insekten
Myzus-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
		
(2)	500	100
		
(7)	500	100
		
(8)	500	95
		
(11)	500	95

96

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 6 ^d
		
(14)	500	95
		
(1)	500	99
		
(26)	500	99

Beispiel E**Phaedon-Larven-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

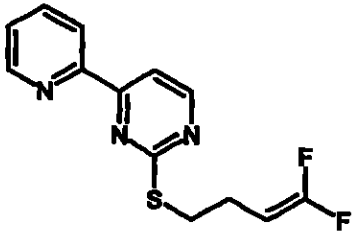
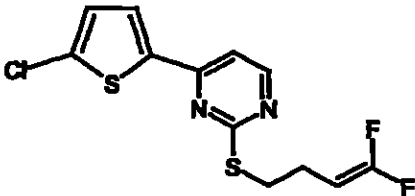
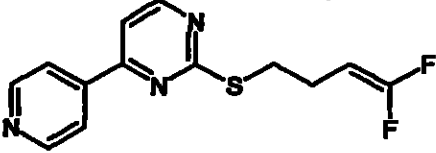
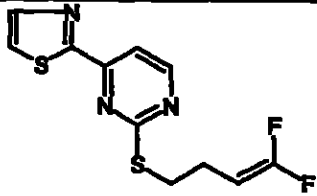
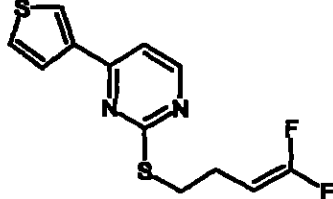
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

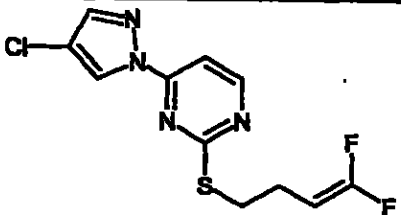
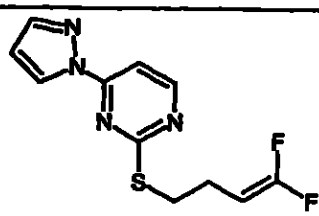
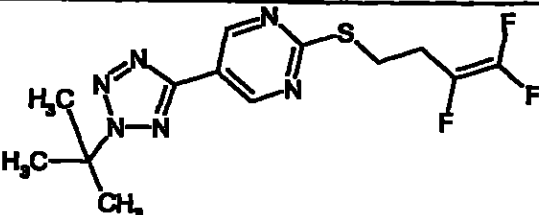
Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

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

Tabelle E
pflanzenschädigende Insekten
Phaedon-Larven-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(2)	500	100
		
(3)	500	100
		
(10)	500	100
		
(11)	500	95
		
(59)	500	100

- 85 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(24)	500	100
		
(1)	500	100
		
(67)	500	100

Beispiel F**Plutella-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

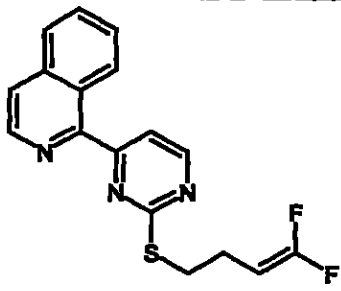
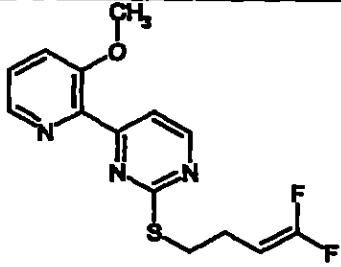
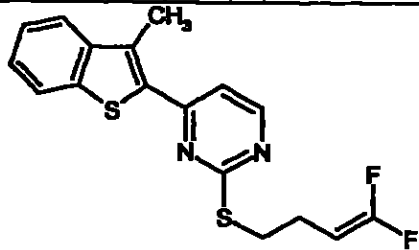
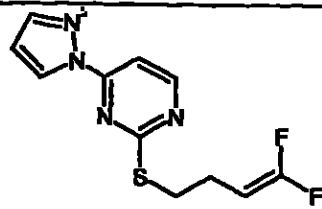
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

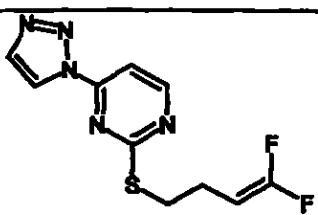
Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (*Plutella xylostella*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

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

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

Tabelle F
pflanzenschädigende Insekten
Plutella-Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(7)	500	100
		
(37)	500	100
		
(54)	500	100
		
(1)	500	100

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
 <chem>F/C=C/SC1=NC=CC=C1N2C=CC=CN2</chem>		
(25)	500	100

Beispiel G**Spodoptera frugiperda-Test**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

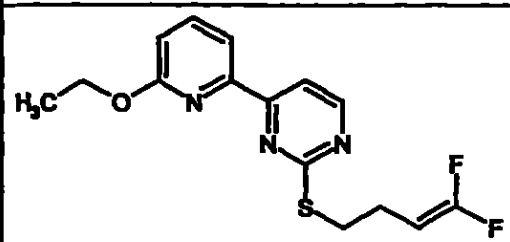
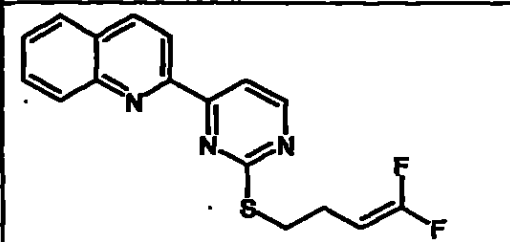
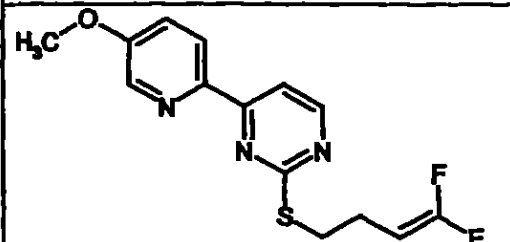
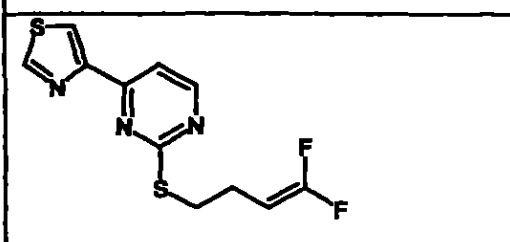
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

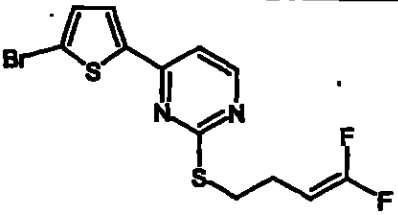
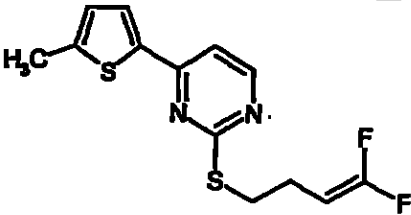
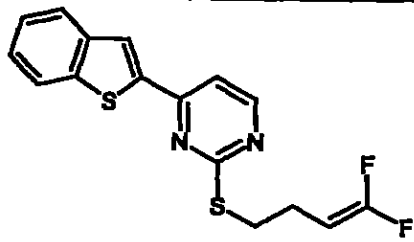
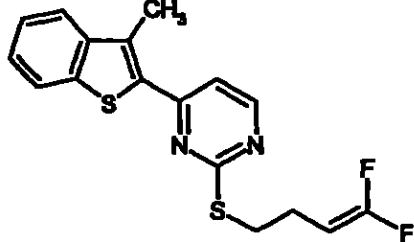
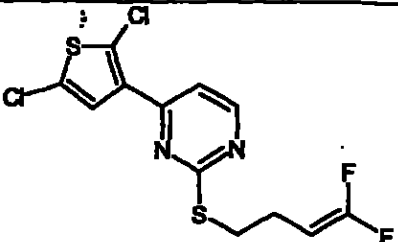
Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

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

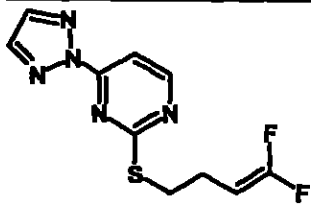
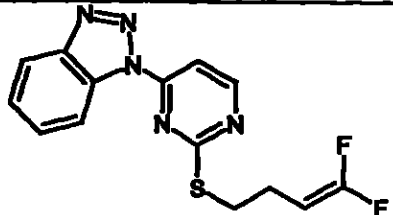
Tabelle G
pflanzenschädigende Insekten
Spodoptera frugiperda –Test

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(20)	500	100
		
(31)	500	100
		
(50)	500	100
		
(48)	500	100

105

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(51)	500	100
		
(52)	500	100
		
(53)	500	100
		
(54)	500	100
		
(63)	500	100

106

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(26)	500	100
		
(40)	500	100

Beispiel H**Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)**

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 2 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykoether

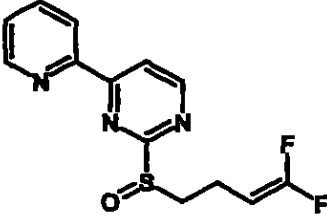
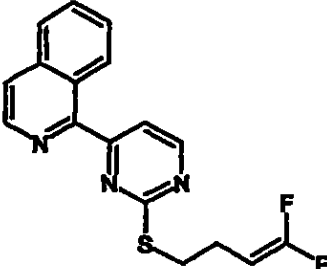
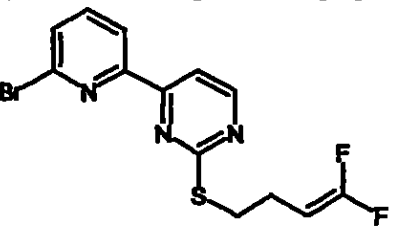
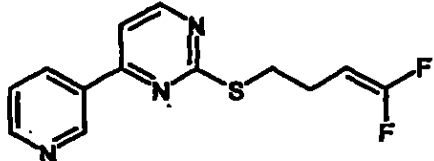
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Bohnenpflanzen (*Phaseolus vulgaris*), die stark von allen Stadien der Gemeinen Spinnmilbe (*Tetranychus urticae*) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration getaucht.

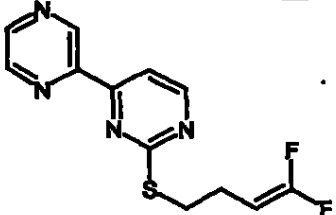
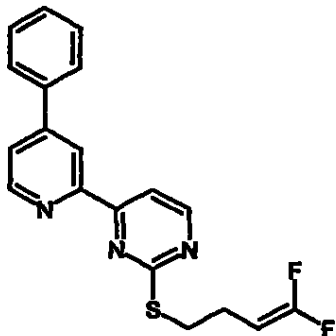
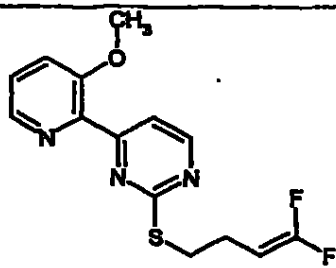
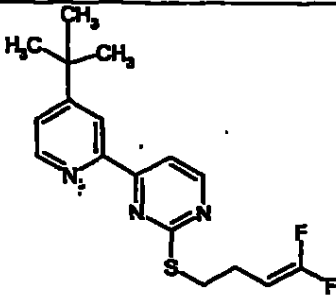
Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Spinnmilben abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Spinnmilben abgetötet wurden.

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

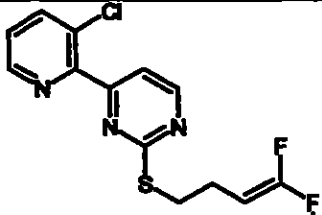
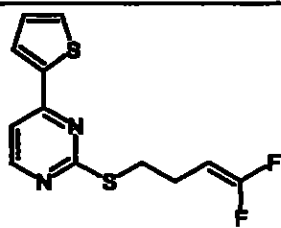
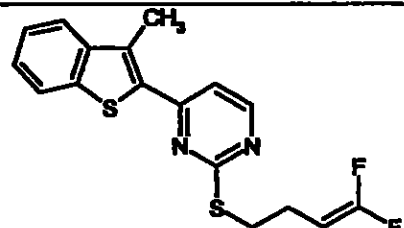
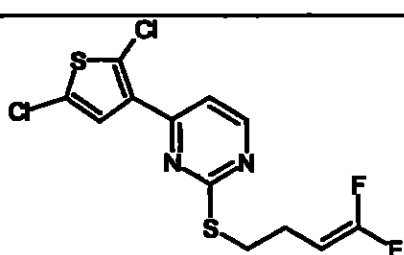
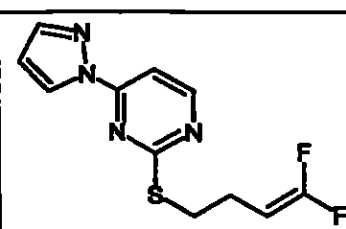
Tabelle H
pflanzenschädigende Milben
Tetranychus-Test (OP-resistent/Tauchbehandlung)

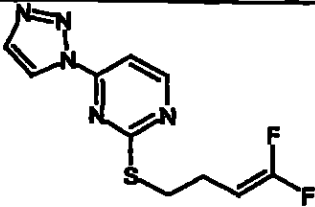
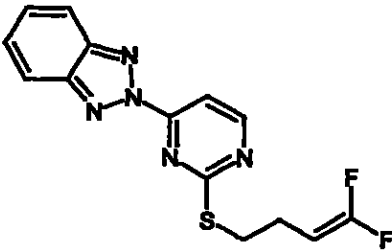
Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(5)	100	100
		
(7)	100	100
		
(17)	100	100
		
(9)	100	100

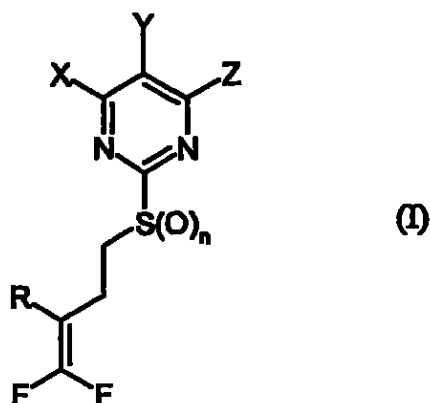
- 95 -

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(14)	100	100
		
(32)	100	100
		
(37)	100	100
		
(33)	100	100

110

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(43)	100	99
		
(27)	100	100
		
(54)	100	100
		
(63)	100	100
		
(1)	100	100

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7d
		
(25)	100	100
		
(42)	100	99

Patentansprüche**1. Verbindungen der Formel (I)**

worin

n für die Zahlen 0, 1 oder 2 steht,

R für Wasserstoff oder Fluor steht,

X, Y und Z unabhängig voneinander

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Halogen,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

- 99 -

für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen,

für Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil,

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für eine Benzo-Gruppierung oder für Alkylen oder Alkenylen mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoffatome unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiert ist,

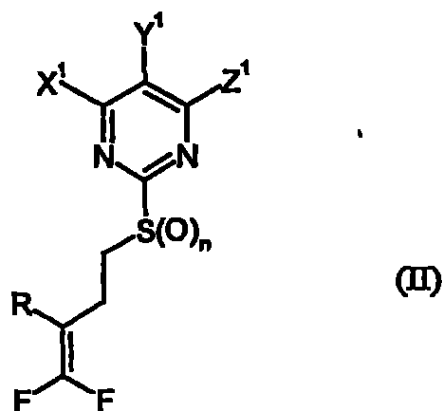
und zumindest einer der Reste X, Y oder Z

für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen und mit bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine oder zwei Oxo-Gruppierungen (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 4 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls Cyano, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxy-carbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenylgruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil; Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind.

2. Verfahren zum Herstellen von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

- (a) Verbindungen der Formel (II),



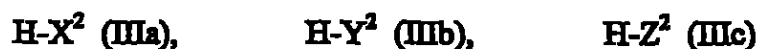
worin

n und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X¹, Y¹ und Z¹ die jeweils in Anspruch 1 für die entsprechenden Reste X, Y und Z angegebenen Bedeutungen haben, jedoch in keinem Fall für eine Heterocyclyl-Gruppierung stehen,

und mindestens einer der Reste X¹, Y¹ oder Z¹ für Halogen steht,

mit Heterocyclen der Formel (IIIa), (IIIb) oder (IIIc)



worin

X², Y² und Z² für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung mit bis zu 10 Kohlenstoffatomen und mit bis zu 5 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine Oxo-Gruppierung (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 4 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

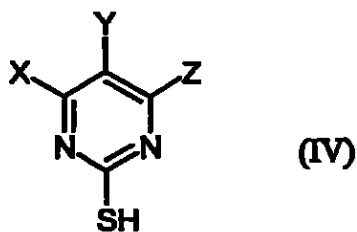
Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Halogen oder C₁-C₆-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkyl-carbonyl, Alkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxycarbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1

bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxy-carbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkynylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenyl-gruppe und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₂-Alkylendioxy oder C₁-C₂-Haloalkylendioxy substituiert sind,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel umgesetzt,

oder wenn man

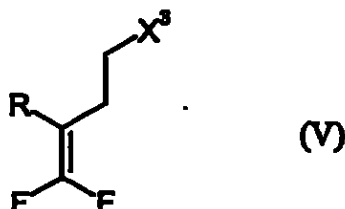
(b) Verbindungen der Formel (IV),



worin

X, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Verbindungen der Formel (V),



worin

R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

X³ für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Reaktionshilfsmittel und
gegebenenfalls in Gegenwart eines oder mehrerer Verdünnungsmittel
umsetzt,

und gegebenenfalls die gemäß Verfahren (a) oder (b) erhaltenen Verbindungen der Formel (I) auf übliche Weise in andere Verbindungen der Formel (I) gemäß der obigen Definition umwandelt.

3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

n für die Zahlen 0 oder 2 steht,

R für Wasserstoff oder Fluor steht und

X, Y und Z unabhängig voneinander

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Halogen,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkyl-carbonyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen,

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkinylgruppen,

für Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenyl-gruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, oder

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio (wobei jeweils Halogen bevorzugt für Fluor oder Chlor steht) oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für eine Benzo-Gruppierung oder für Alkylen oder Alkenylen mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoffatome unterbrochen sein kann und der dadurch

gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom oder Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen substituiert ist, und wobei

zumindest einer der Reste X, Y oder Z für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung mit 4, 6, 9 oder 10 Kohlenstoffatomen und bis zu 4 Stickstoffatomen und/oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom steht, welche gegebenenfalls zusätzlich eine oder zwei Oxo-Gruppierungen (C=O), eine Thioxo-Gruppierung (C=S), eine -SO-Gruppierung oder eine -SO₂-Gruppierung enthält, und welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Halogen; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkyl-carbonyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyloxy, Alkylamino, Alkylaminocarbonyl, Alkoxy-carbonylamino, Alkylsulfonylamino, Dialkylamino, Dialkylaminocarbonyl oder Dialkylaminosulfonyl mit jeweils 1 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen; jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl, Alkinyloxy oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl- oder Alkinylgruppen; Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Cycloalkylalkyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in der Cycloalkyl- oder Cycloalkenyl-gruppe und gegebenenfalls 1 bis 3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio (wobei jeweils

Halogen bevorzugt für Fluor oder Chlor steht), C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl, Methylendioxy oder Difluormethylendioxy substituiert sind.

4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

n für 0 steht und

X, Y und Z unabhängig voneinander

für Wasserstoff, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Hydroxy, Cyanato, Thiocyanato, Fluor, Chlor, Brom,

für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propylamino, Di-i-propyl-amino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl,

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxy-carbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyl-oxy, Butinyloxy, Propinyloxy-carbonyl oder Butinyloxy-carbonyl,

für Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclo-pentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, oder

für Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluor-methyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluor-methoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethyl-thio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethyl-thio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxy-carbonyl substituiert sind, oder

gemeinsam für Trimethylen, Tetramethylen, Propen-1,3-diyl oder Butadien-1,4-diyl stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Stickstoffatome oder 1 bis 2 (nicht direkt benachbarte) Sauerstoff-atome unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl substituiert ist, und wobei

zumindest einer der Reste X, Y oder Z für eine gesättigte oder unge-sättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocycl-Gruppierung

122

aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzo-
thienyl, Pyrrolyl, Indazolyl, Tetrahydroindazolyl, Oxopyrrolyl, Pyrro-
linyl, Pyrrolidinyll, 2,5-Dioxo-1-aza-cyclopentyl, Pyrazolyl, Pyrazol-
inyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Imidazolyl, Tri-
azolyl, Benztriazolyl, Oxotriazolinyll, Tetrazolyl, Oxazolyl, Benzox-
azolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadi-
azolyl, Pyridinyl, 1,4-Dihydro-4-oxo-pyridin-1-yl, Chinolinyl, Iso-
chinolinyl, Piperidinyll, Oxopiperidinyll, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyri-
midinyll, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholinyl steht, welche gege-
benenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung ent-
hält:

Nitro; Amino; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl;
Hydroxy; Fluor; Chlor; Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls durch
Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy sub-
stituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl,
Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-
Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl,
n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methyl-
thio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methyl-
sulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl,
Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethyl-
sulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino,
n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylamino-
carbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-,
s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxy-
carbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-
Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n-
oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Di-
methylamino; Diethylamino, Di-n-propyl-amino, Di-i-propyl-amino,
Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylamino-

sulfonyl oder Diethylaminosulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylendioxy oder Difluormethylendioxy, substituiert sind.

5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

n, R, X, Y und Z die in Anspruch 1 als besonders bevorzugt angegebene Bedeutung haben, wobei Y vorzugsweise für Wasserstoff steht,

und wenigstens einer der Reste

X oder Z für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocyclyl-Gruppierung aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indazolyl, Tetra-

hydroindazolyl, Oxopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, 2,5-Dioxo-1-aza-cyclopentyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Imidazolyl, Triazolyl, Benztriazolyl, Oxotriazolyl, Tetrazolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, 1,4-Dihydro-4-oxo-pyridin-1-yl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholinyl steht, welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Fluor; Chlor; Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyryl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propyl-amino, Di-i-propyl-amino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy,

Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl substituiert sind,

und wobei der gegebenenfalls verbleibende Rest X oder Z für Wasserstoff steht.

6. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

n, R, X und Z die in Anspruch 1 als besonders bevorzugt angegebenen Bedeutung haben, wobei X und Z vorzugsweise für Wasserstoff stehen, und

Y für eine gesättigte oder ungesättigte, monocyclische oder bicyclische Heterocycl-Gruppierung aus der Reihe Furyl, Benzofuryl, Tetrahydrofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Oxopyrrolyl, Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, Pyrazolyl, Pyrazolinyl, Oxopyrazolinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclopentyl, Triazolyl, Benzotriazolyl, Oxotriazolyl, Tetrazolyl,

Oxazolyl, Benzoxazolyl, Thiazolyl, Benzthiazolyl, Oxadiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Piperidinyl, Oxopiperidinyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl, Pyrimidinyl, 2-Oxo-1,3-diazacyclohexyl, Morpholinyl steht, welche gegebenenfalls bis zu 3 Substituenten aus der folgenden Aufzählung enthält:

Nitro; Cyano; Carboxy; Carbamoyl; Thiocarbamoyl; Hydroxy; Fluor, Chlor, Brom; Iod; jeweils gegebenenfalls Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Acetyl, Propionyl, n- oder i-Butyroyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n- oder i-Propylsulfonyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, n- oder i-Propylaminocarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butylaminocarbonyl, Methoxycarbonylamino, Ethoxycarbonylamino, n- oder i-Propoxycarbonylamino, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonylamino, Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n- oder i-Propylsulfonylamino, n-, i-, s- oder t-Butylsulfonylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Di-n-propyl-amino, Di-i-propyl-amino, Dimethylaminocarbonyl, Diethylaminocarbonyl, Dimethylaminosulfonyl oder Diethylaminosulfonyl; jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiertes Ethenyl, Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl,

127

Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl, Phenyl, Benzyl, Phenoxy, Phenylthio, Pyridyl, Furyl oder Thienyl, welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butoxycarbonyl substituiert sind.

7. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch den Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.
8. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.
9. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder Mittel gemäß Anspruch 7 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
10. Verfahren zum Herstellen von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Publication No
PCT/EP 03/08881

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D401/04 C07D409/04 C07D417/04 C07D403/04 A01N43/54

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

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

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

CHEM ABS Data, PAJ, EPO-Internal

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 506 270 A (I.C.I.) 30 September 1992 (1992-09-30) cited in the application claims; examples 42,43; table 1	1-3,7-10
A	WO 94 06777 A (ZENECA) 31 March 1994 (1994-03-31) cited in the application claims; example 4; table 1	1-3,7-10

☐ 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 January 2004

Date of mailing of the international search report

03/02/2004

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) 340-3018

Authorized officer

Francois, J

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationale Patentstellen

PCT/EP 03/08881

129

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D401/04 C07D409/04 C07D417/04 C07D403/04 A01N43/54

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Researchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die researchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data, PAJ, EPO-Internal

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 506 270 A (I.C.I.) 30. September 1992 (1992-09-30) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiele 42,43; Tabelle 1	1-3,7-10
A	WO 94 06777 A (ZENECA) 31. März 1994 (1994-03-31) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche; Beispiel 4; Tabelle 1	1-3,7-10



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie eingeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

9. Januar 2004

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts

03/02/2004

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentkanal 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Francois, J

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

PCT/EP2003/008881



Applicant's or agent's file reference LEA36304-WO	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP2003/008881	International filing date (day/month/year) 11 August 2003 (11.08.2003)	Priority date (day/month/year) 23 August 2002 (23.08.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 401/04, 409/04, 417/04, 403/04, A01N 43/54		
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG		

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

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

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

These annexes consist of a total of sheets.

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

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

Date of submission of the demand 16 January 2004 (16.01.2004)	Date of completion of this report 07 April 2004 (07.04.2004)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**International application No. PCT/EP2003/008881

I. Basis of the report

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

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

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

132

PCT-ANTRAG

LEA36304-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 20.05.2003 02:58:16 PM

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen.	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.92 (aktualisiert 01.04.2003)
0-5	Antragsersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LEA36304-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	SUBSTITUIERTE HETEROCYCLYL PYRIMIDINE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AG
II-5	Anschrift:	Alfred-Nobel-Str. 50 D-40789 Monheim Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	FISCHER, Rüdiger
III-1-5	Anschrift:	Zu den Fußfällen 23 D-50259 Pulheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ALIG, Bernd
III-2-5	Anschrift:	Im Rothsiefen 7 D-53639 Königswinter Deutschland
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BRETSCHNEIDER, Thomas
III-3-5	Anschrift:	Talstr. 29 b D-53797 Lohmar Deutschland
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	MAURER, Fritz
III-4-5	Anschrift:	Brahmstr. 36 Brunnenstr.11 D-40789 Monheim 74348 Lauffen Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ERDELEN, Christoph
III-5-5	Anschrift:	Unterbüscherhof 15 D-42799 Leichlingen Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KONZE, Jörg
III-6-5	Anschrift:	Magazinstr. 61 D-51147 Köln Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	LÖSEL, Peter
III-7-5	Anschrift:	Lohrstr. 90a D-51371 Leverkusen Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	GB
III-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-8	Anmelder und/oder Erfinder	
III-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-8-2	Anmelder für	Nur US
III-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	WATANABE, Yuki Yoshi
III-8-5	Anschrift:	Hanagaki 2-8-24 Oyama, Tochigi 323 Japan
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	JP
III-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	JP
IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter; oder besondere Zustellanschrift Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als:	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AG
IV-1-2	Anschrift:	Law and Patents Patents and Licensing D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 67271
IV-1-4	Telefaxnr.	0214 30 53482

135

V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: GH GM KE LS MW MZ SD SL SZ TZ UG ZM ZW und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat des Harare-Protokolls und Vertragsstaat des PCT ist EA: AM AZ BY KG KZ MD RU TJ TM und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist EP: AT BE BG CH&LI CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IT LU MC NL PT RO SE SI SK TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GQ GW ML MR NE SN TD TG und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat der OAPI und Vertragsstaat des PCT ist
V-2	Nationales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AE AG AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BY BZ CA CH&LI CN CO CR CU CZ DE DK DM DZ EC EE ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX MZ NI NO NZ OM PH PL PT RO RU SC SD SE SG SK SL TJ TM TN TR TT TZ UA UG US UZ VC VN YU ZA ZM ZW
V-3	Nationales Patent (Staaten, die dem PCT nach Veröffentlichung dieser PCT-EASY-Version beigetreten sind.)	und alle weiteren Staaten, die am Anmeldetag dem PCT angehören.
V-5	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 und V-3 vorgenommenen Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.8 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der nachstehend unter Punkt V-6 angegebenen Staaten. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt.	
V-6	Staaten, die von der Erklärung über vorsorgliche Bestimmungen ausgenommen werden	KEINE

VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	23 August 2002 (23.08.2002)	
VI-1-2	Nummer	10238725.7	
VI-1-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VIII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VIII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	1	
VIII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	1	
VIII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VIII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit	-	

137

VIII-2-1	Erklärung: Berechtigung, ein Patent zu beantragen und zu erhalten Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regeln 4.17 Ziffer ii und 51bis.1 Absatz a Ziffer ii), für den Fall, daß eine Erklärung nach Regel 4.17 Ziffer iv nicht einschlägig ist: Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AG ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, ein Patent zu beantragen und zu erhalten:
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, FISCHER, Rüdiger
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, ALIG, Bernd
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, BRETSCHNEIDER, Thomas
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, MAURER, Fritz
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, ERDELEN, Christoph
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, KONZE, Jörg
VIII-2-1 (ii)		Bayer AG ist berechtigt, als Arbeitgeber des Erfinders, LÖSEL, Peter
VIII-2-1 (iii)		auf Grund einer Vereinbarung zwischen WATANABE, Yuki Yoshi und Nihon Bayer Agrochem K.K. vom 30 April 2002 (30.04.2002)
VIII-2-1 (vii)		auf Grund sonstiger Übertragung der Berechtigung von Nihon Bayer Agrochem K.K. auf Bayer Aktiengesellschaft im Wege der (des) Vertrag vom 01 Dezember 2000 (01.12.2000)
VIII-2-1 (vii)		auf Grund sonstiger Übertragung der Berechtigung von Bayer Aktiengesellschaft auf BAYER CROPSCIENCE AG im Wege der (des) Übertragungserklärung vom 24 Oktober 2002 (24.10.2002)
VIII-2-1 (ix)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten (mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika)

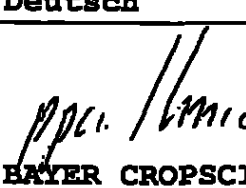
VIII-3-1	Erklärung: Berechtigung, Priorität zu beanspruchen Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, eine Priorität zu beanspruchen, in Fällen, in denen der Anmelder nicht der Anmelder der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht wird, ist oder in Fällen, in denen sich der Name des Anmelders seit dem Einreichen der früheren Anmeldung geändert hat (Regeln 4.17 Ziffer III und 51bis.1 Absatz a Ziffer iii): Name:	in bezug auf diese internationale Anmeldung BAYER CROPSCIENCE AG ist kraft des nachfolgend Aufgeführten berechtigt, die Priorität der früheren Anmeldung Nr. 10238725.7 zu beanspruchen:
VIII-3-1 (iii)		auf Grund einer Vereinbarung zwischen Bayer AG und Bayer CropScience AG vom 19 Mai 2003 (19.05.2003)
VIII-3-1 (ix)	Diese Erklärung wird abgegeben im Hinblick auf:	alle Bestimmungsstaaten

139

PCT-ANTRAG

LEA36304-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 20.05.2003 02:58:16 PM

IX	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	9	-
IX-2	Beschreibung	97	-
IX-3	Ansprüche	16	-
IX-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	123	
	Beigelegte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht	✓	-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
IX-17	PCT-EASY-Diskette	-	Diskette
IX-19	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
IX-20	Sprache der Int. Anmeldung	Deutsch	
X-1	Unterschrift des Anmelders, des Anwalts oder des Gemeinsamen Vertreters	 	
X-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AG	

ppa. Dr. Krieg i.V. Dr. Hornung
VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

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

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	
------	---	--

1/2

140

PCT (ANHANG - BLATT FÜR DIE
GEBÜHRENBERECHNUNG)

LEA38304-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 20.05.2003 02:58:16 PM

12-20-2	Ermächtigung, Fehlbeträge oder Überzahlungen des vorstehenden angegebenen Gesamtbetrages der Gebühren meinem laufenden Konto zu belasten bzw. gutzuschreiben..	✓
12-21	Nummer des laufenden Kontos	28 000 001
12-22	Datum	20 Mai 2003 (20.05.2003)
12-23	Name und Unterschrift	BAYER CROPSCIENCE AG <i>ppa. Hm</i> <i>i.V. Hornung</i>

PRÜFPROTOKOLL UND BEMERKUNGEN

13-2-2	Prüfergebnisse Staaten	Gelb! Weitere nationale Bestimmung: benutzen Sie aktualisierte Wartungstabellen anstatt dieses Feldes.
13-2-3	Prüfergebnisse Namen	Grün? Anmelder 1.: Telefonnr. nicht angegeben Grün? Anmelder 1.:Telefaxnr. nicht angegeben
13-2-6	Prüfergebnisse Erklärungen	Grün? Manuell eingetragene Daten. Überprüfen Sie bitte den Inhalt. Grün? Manuell eingetragene Daten. Überprüfen Sie bitte den Inhalt.
13-2-7	Prüfergebnisse Inhalt	Grün? Die internationale Anmeldung enthält keine Zeichnung(en). Bitte überprüfen.
13-2-8	Prüfergebnisse Gebühren	Grün? Bitte bestätigen, daß das Gebührenverzeichnis in der zur Zeit geltenden Fassung benutzt wurde
13-2-9	Prüfergebnisse Zahlung	Grün? Bitte überprüfen Sie, daß bei dem gewählten Anmeldeamt ein gültiges laufendes Konto auf Ihren Namen besteht

In

141

**PCT (ANHANG - BLATT FÜR DIE
GEBÜHRENBERECHNUNG)**

LEA36304-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 20.05.2003 02:58:16 PM

13-2-1 0	Prüfergebnisse Anmerken	Grün? Der Name der unterzeichnenden Person oder/und ihre Eigenschaft nicht angegeben. Bitte berücksichtigen Sie, daß einige Anmeldeämter fordern, daß diese Information zusammen mit der Unterschrift vorgeführt wird.
-------------	----------------------------	--

Traducción

TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES
PCT
INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

142

Referencia del expediente del agente o solicitante LE A 36404-WO	PARA ACTUACIONES ADICIONALES	Ver notificación de Transmisión del Reporte de Examen Preliminar (Formato PCT/IPEA416)
Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/008881	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 11/08/2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 23/08/2002
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC C07D 401/04, 409/04, 417/04, 403/04, A01N 43/54		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AG		

1.	Este informe de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Administración encargada del Examen Preliminar Internacional y se envía al solicitante en concordancia con el artículo 36.
2.	Este INFORME consta de una total de <u> 2 </u> hojas, incluyendo la portada ☐ Este informe también se acompaña de ANEXOS, esto es documentos de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos que han sido corregidos y que son la base de este informe y/o documentos que contienen rectificaciones realizadas ante esta Administración (Ver Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones Administrativas según el PCT) Estos anexos constan de un total de <u> </u> hojas.
3.	Este informe contiene indicaciones relativas a los siguientes aspectos: I ☒ Fundamentos del Informe II ☐ Prioridad III ☐ No se establece concepto relativo a la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial IV ☐ Carencia de unidad de la invención V ☒ Declaración razonada según el artículo 35(2), en relación con la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citaciones y explicaciones que soportan dicha declaración VI ☐ Ciertos documentos citados VII ☐ Ciertos defectos de la solicitud internacional VIII ☐ Ciertas observaciones respecto a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la demanda 16/01/2004	Fecha de terminación de este reporte 07/04/2004
Nombre y dirección de correo de la autoridad encargada del examen preliminar Facsimile No.	Funcionario Autorizado Teléfono No.

I. Base del Informe

La base de este informe de examen preliminar internacional es la solicitud como se presentó originalmente.

V. Declaración motivada según la Regla 66.2(a)(ii) en cuanto a la novedad, el nivel inventivo y la aplicación

A la luz de los documentos citados en el informe de búsqueda internacional, se considera, que la invención, tal y como define en las reivindicaciones cumple con los criterios mencionados en el artículo 33(1) del PCT, es decir, parece ser novedosa y comprender un nivel inventivo.

Original (para PRESENTAR) – impreso el 20.05.2003 02:58:16 PM

VIII-2-1	Declaración: Autorización para solicitar y obtener una patente Declaración con relación a la autorización del solicitante, de solicitar y obtener en el momento de la fecha de solicitud internacional una patente (reglas 4.17 ítem ii y 51bis. 1 párrafo a ítem ii), para el caso, que una declaración de acuerdo con la regla 4.17 ítem iv no sea pertinente: Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AG esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para solicitar y obtener una patente:
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, FISCHER, Rüdiger
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, ALIG, Bernd
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, BRETSCHNEIDER, Thomas
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, MAURER, Fritz
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, ERDELEN, Christoph
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, KONZE, Jörg
VIII-2-1 (ii)		BAYER AG está autorizado como empleador del inventor, LÖSEL, Peter
VIII-2-1 (iii)		con base en un acuerdo entre WATANABE, Yuki Yoshi y Nihon Bayer Agrochem K.K. del 30 de abril de 2002 (30.04.2002)
VIII-2-1 (vii)		con base en transferencias adicionales del derecho de Nihon Bayer Agrochem K.K. a Bayer Aktiengesellschaft sobre el acuerdo del 01. de diciembre de 2000 (01/12/2000)
VIII-2-1 (vii)		con base en transferencias adicionales del derecho de Bayer Aktiengesellschaft a Bayer CropScience AG sobre la declaración de transferencia del 24 de octubre de 2002 (24/10/2002)
VIII-2-1 (ix)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados (a excepción de los Estados Unidos de América)

VIII-3-1	Declaración: Autorización, para reivindicar prioridad Declaración con relación a la autorización del solicitante, de reivindicar una prioridad, en el momento de la fecha de solicitud internacional, en los casos en los que el solicitante ya no sea el solicitante de la solicitud anterior, de la cual se reivindica prioridad, o en los casos, en los que el nombre del solicitante se haya modificado desde la presentación de la solicitud anterior (reglas 4.17 ítem III y 51bis. 1 párrafo a ítem III): Nombre:	con relación a esta solicitud internacional BAYER CROPSCIENCE AG esta en poder de lo citado a continuación, autorizado para reivindicar prioridad de la solicitud anterior No. 10238725.7:
VIII-3-1 (iii)		con base en un acuerdo entre BAYER AG y BAYER CROPSCIENCE AG del 19 de mayo de 2003 (19/05/2003)
VIII-3-1 (ix)	Esta declaración se emite en vista de:	todos los estados designados

HETEROCICLILPIRIMIDINAS SUBSTITUIDAS

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas heterociclilpirimidinas substituidas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como agentes pesticidas.

5

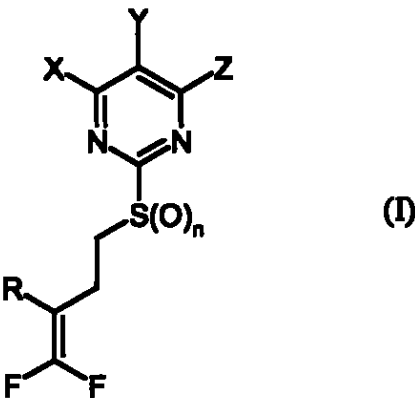
Antecedentes de la invención

Se sabe que determinadas pirimidinas substituidas son adecuadas para la lucha contra las pestes animales (véanse las publicaciones EP 0 506 270 A1 / US 5,246,938 A, WO 94/06777 A1 / US 5,684,011 A, WO 99/52 874 A1). Sin embargo, estas pirimidinas substituidas, conocidas, no han adquirido un significado como agentes para la lucha

10

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado, ahora, nuevas hetericiclilpirimmidinas substituidas de la fórmula (I)



15

en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

R significa hidrógeno o flúor,

X, Y y Z independientemente entre sí

20

significan hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, hidroxí, cianato, tiocianato, halógeno,

-2-

- significan alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcoxicarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquildaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significan respectivamente, alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos, en caso dado, por halógeno,
- significan cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo,
- significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o conjuntamente significan un agrupamiento benzo o significan alquilenos o alquenilenos con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono, inclusive, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente contiguos) y estando substituido, a su vez, el anillo, formado de este modo, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono,

y, al menos, uno de los restos X, Y o Z

significa un agrupamiento heterocíclico saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, con hasta 10 átomos de carbono, inclusive, y con hasta 5 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además uno o dos agrupamientos oxo ($C=O$), un agrupamiento tioxo ($C=S$), un agrupamiento $SO-$ o un agrupamiento SO_2- , y que contiene, en caso dado, hasta 4 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:

nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcóxicarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono; alquénilo, alquéniloxi, alquéniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquénilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno; cicloalquilo, cicloalquénilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquénilo y, en caso dado, con 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo; fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o por alcóxi-carbonilo con 1 a 4

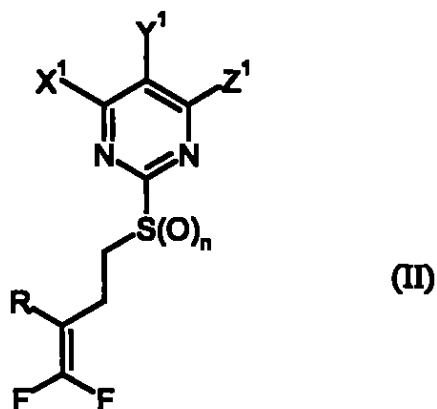
átomos de carbono.

Los compuestos de la fórmula general (I) pueden presentarse, en caso dado, en función del tipo y del número de los sustituyentes, como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticos o bien como regioisómeros o como mezclas de isómeros correspondientes con una composición variable. Tanto los isómeros puros como también las mezclas de isómeros quedan reivindicados según la invención. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I), pueden presentarse, en caso dado, en función del tipo y del número de los sustituyentes, como diversas formas tautómeras. Los tautómeros constituye, igualmente, un objeto de la presente invención.

El objeto de la invención está constituido, además, por todos los N-óxidos posibles, que puedan ser formados por los compuestos de la fórmula (I), así como todas las sales de los compuestos de la fórmula (I), por ejemplo con ácidos minerales tal como el ácido clorhídrico.

Además, se ha encontrado, que se obtienen las nuevas heterociclipirimidinas sustituidas de la fórmula (I), si

(a) se hacen reaccionar pirimidinas halógeno-sustituidas de la fórmula (II),



en la que

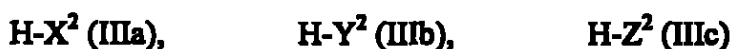
n y R tienen los significados anteriormente indicados,

X¹, Y¹ y Z¹ tienen los significados indicados respectivamente más

arriba para los restos correspondientes X, Y y Z, pero, sin embargo, no significan, en ningún caso un agrupamiento heterocíclico,

y al menos uno de los restos X^1 , Y^1 o Z^1 significa halógeno,

5 con heterociclos de la fórmula (IIIa), (IIIb) o (IIIc)



en las que

10 X^2 , Y^2 y Z^2 significan un agrupamiento heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico con hasta 10 átomos, inclusive, de carbono y con hasta 5 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además un agrupamiento oxo ($C=O$), un agrupamiento tioxo ($C=S$), un agrupamiento $SO-$ o un agrupamiento

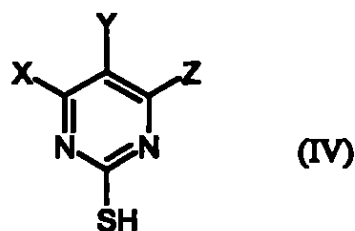
15 SO_2- , y que contiene, en caso dado, hasta 4 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:

nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo,

20 alcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono; alquénilo, alquéniloxi, alquéniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con,

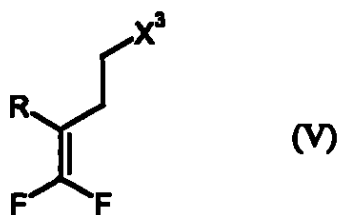
25 respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquénilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno; cicloalquilo,

- cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro,
- 5 por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con 1 a 4
- 10 átomos de carbono, por alquilendioxi con 1 a 4 átomos de carbono o por haloalquilendioxi con 1 a 2 átomos de carbono,
- en caso dado, en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,
- o si
- 15 (b) se hacen reaccionar heterociclipirimidintioles de la fórmula (IV),



- en la que
- X, Y y Z tienen los significados anteriormente indicados,
- 20 con halogenuros de flúoralquenilo de la fórmula (V),

-7-



en la que

R tiene los significados anteriormente indicados y

X³ significa halógeno,

5 en caso dado, en presencia de una o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

y, en caso dado, los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a) o (b) se transforman, de manera usual, en otros compuestos de la fórmula (I) según la definición anterior.

10 Finalmente se ha encontrado, que las nuevas heterociclipirimidinas substituidas de la fórmula (I) presentan una actividad muy buena contra las pestes animales, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos, de una manera muy especial contra nematodos y que pueden emplearse tanto en la protección de las plantas como también en la protección de los materiales para la lucha contra las pestes animales.

15 En las definiciones, las cadenas carbonadas, tales como alquilo o alquenilo – incluso en combinación con heteroátomos, tal como en alcoxi- son, respectivamente, lineales o ramificadas.

A continuación se han dado los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos presentes en las fórmulas anteriores y que se indicarán más adelante.

20 Preferentemente,

n significa los números 0 o 2.

Preferentemente,

R significa hidrógeno.

Preferentemente,

R significa, además, flúor.

Preferentemente,

X, Y y Z significan independientemente entre sí

hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, hidroxí, cianato, tiocianato, halógeno,

significan alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcóxicarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

significan alquenilo, alqueniloxi, alquenilóxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquinilóxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo,

significan cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, o

significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono (significando halógeno, respectivamente, de manera preferente flúor o cloro) o por alcoxi-

- carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o conjuntamente significan un agrupamiento benzo o significan alquileo o alquenileo con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono, inclusive, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o por 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente contiguos) y estando substituido el anillo, formado de este modo, en caso dado, por flúor, por cloro, por bromo o por alquilo con 1 hasta 3 átomos de carbono, y significando al menos uno de los restos X, Y o Z preferentemente un agrupamiento heterociclilo saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, con 4, 6, 9 o 10 átomos de carbono y hasta 4 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además, uno o dos agrupamientos oxo (C=O), un agrupamiento tioxo (C=S), un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂-, y que contiene, en caso dado, hasta 3 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:
- nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxycarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxycarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno; cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 3

- átomos de carbono en la parte alquilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono (significando halógeno, respectivamente, de manera preferente flúor o cloro), por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, por metilendioxi o por difluórmtilendioxi.
- 5
- De forma especialmente preferente,
- 10
- n significa 0.
- De forma especialmente preferente,
- X, Y y Z significan independientemente entre sí
- hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, hidroxí, cianato, tiocianato, flúor, cloro, bromo,
- 15
- significan respectivamente, metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirole, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n- o i-propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino,
- 20
- 25

- dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo, substituidos en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi
- 5 significan respectivamente, etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo, substituidos en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo,
- 10 significan ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, o
- significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o
- 15 i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmtilo, por diclorometilo, por trifluórmtilo, por triclorometilo, por clorodifluórmtilo, por fluórdiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por clorodifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por clorodifluórmtiltio, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, o
- 20 conjuntamente significan trimetileno, tetrametileno, propen-1,3-diilo o butadien-1,4-diilo, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o por 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente contiguos) y el anillo, formado de este modo, está substituido, en caso dado, por
- 25 flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, y significando

al menos uno de los restos X, Y o Z de forma especialmente preferente un agrupamiento heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo, tetrahydrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indazolilo, tetrahydroindazolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo,
5 2,5-dioxo-1-aza-ciclopentilo, pirazolilo, pirazolinilo, oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, imidazolilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-piridin-1-ilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo,
10 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que están substituidos, en caso dado, con hasta 3 substituyentes, inclusive, elegidos de la siguiente enumeración:
nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; flúor; cloro; bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi,
15 metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfínilo, etilsulfínilo, n- o i-propilsulfínilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino,
20 metilaminocarbonilo, tilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, toxicarbonilamino, n- o i-propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino,
25 dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por

flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo, o butiniloxicarbonilo, substituidos respectivamente, en caso
5 dado, por flúor, por cloro o por bromo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro,
10 por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmtilo, por diclorometilo, por trifluórmtilo, por triclorometilo, por clorodifluórmtilo, por fluórdiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por clorodifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por clorodifluórmtiltio, por
15 metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, por metilendioxi o por difluórmtilendioxi.

De forma muy especialmente preferente,

X, Y y Z significan independientemente entre sí hidrógeno o significan un
20 agrupamiento heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por tienilo, benzotienilo, pirrolilo, pirazolilo, triazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridinilo, quinolinilo, piridazinilo o morfolinilo, que contienen, en caso dado, hasta 2, inclusive, preferentemente 1 substituyente de la siguiente enumeración:

25 nitro; amino; ciano; carbamoilo; tiocarbamoilo; flúor; cloro; bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metoxicarbonilo,

etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi; fenilo substituido respectivamente, en caso dado, por flúor o por cloro,

- 5 significando Y, preferentemente, hidrógeno, y uno de los dos restos X o Z significa uno de los heterociclos citados, mientras que el resto remanente de los dos restos, X o Z, significa, a su vez, hidrógeno.

Un grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

- 10 n, R, X, Y y Z tienen los significados anteriormente indicados como muy especialmente preferentes, significando Y, preferentemente, hidrógeno,

y al menos uno de los restos

X o Z significa un agrupamiento heterociclilo, saturado o insaturado, monocíclico o

- 15 bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo, tetrahydrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indazolilo, tetrahydroindazolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, 2,5-dioxo-1-aza-ciclopentilo, pirazolilo, pirazolinilo, oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, imidazolilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, 1,4-dihidro-4-
20 oxo-piridin-1-ilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que contiene, en caso dado, hasta 3 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:

- 25 nitro; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; flúor; cloro; bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo,

etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, metilamino, etilamino, 5 n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n- o i-propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino, 10 dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, 15 buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo; ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, 20 furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmétilo, por diclorometilo, por trifluórmétilo, por triclorometilo, por clorodifluórmétilo, por fluórdiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmétoxi, por trifluórmétoxi, por 25 clorodifluórmétoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-

butiltio, por difluórmethyltio, por trifluórmethyltio, por clorodifluórmethyltio, por metoxycarbonilo, por etoxycarbonilo, por n- o i-propoxycarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxycarbonilo, por metilendioxi o por difluórmethylendioxi,

y significando, en caso dado, el resto remanente, X o Z, de manera preferente hidrógeno.

5

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

n, R, X y Z tiene los significados anteriormente indicados como especialmente preferentes, significando X y Z, preferentemente, hidrógeno, y

- 10 Y significa un agrupamiento heterociclilo, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo, tetrahydrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que contiene, en caso dado, hasta 3 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:
- 15 nitro; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxi; flúor; cloro; bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butirolilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxycarbonilo, methyltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metilaminocarbonilo,
- 20
- 25

etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxycarbonilamino, etoxycarbonilamino, n- o i-propoxycarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxycarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino, 5 dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, 10 buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo; ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, 15 furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmtilo, por diclorometilo, por trifluórmtilo, por triclorometilo, por clorodifluórmtilo, por fluórdiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por 20 clorodifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por clorodifluórmtiltio, por metoxycarbonilo, por etoxycarbonilo, por n- o i-propoxycarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxycarbonilo.

25 Los compuestos de la fórmula (I), en los que R significa, respectivamente hidrógeno o flúor, son equivalentes entre sí. Ambos grupos de compuestos constituyen,

independientemente entre sí, el objeto de la presente invención.

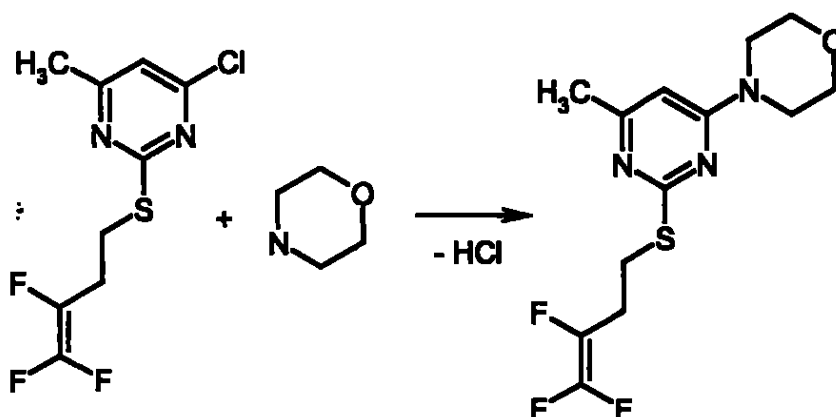
Según la invención son preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados anteriormente indicados como preferentes.

5 Según la invención son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados anteriormente indicados como especialmente preferentes.

Según la invención son muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los que se presenta una combinación de los significados anteriormente
10 indicados como muy especialmente preferentes.

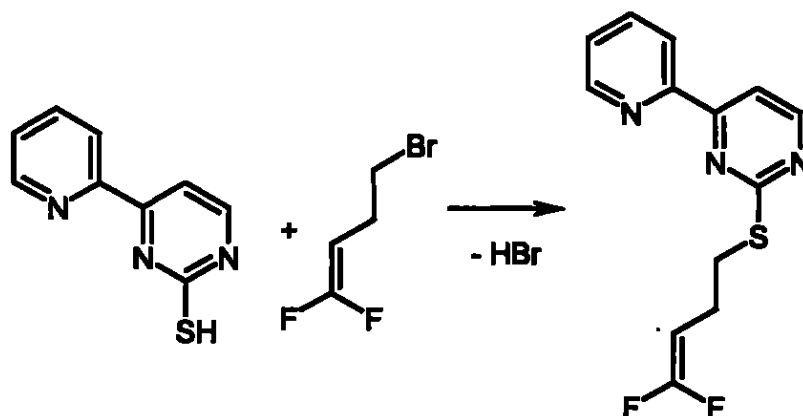
Las definiciones o bien las explicaciones de los restos indicadas anteriormente de manera general o citadas en los intervalos preferentes pueden combinarse, sin embargo, arbitrariamente también entre sí, es decir entre los respectivos intervalos y los intervalos preferentes. Estas son validas para los productos finales así como, de manera
15 correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios.

Si se emplean, por ejemplo la 4-cloro-6-metil-2-[(3,4,4-trifluor-3-butenil)tio]-pirimidina y morfolina como productos de partida, podrá esquematizarse el desarrollo del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Si se emplean, por ejemplo el 4-(piridin-2-il)-pirimidin-2-tiol y el 4-bromo-1,1-difluor-1-buteno como productos de partida, podrá esquematizarse el procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:

5

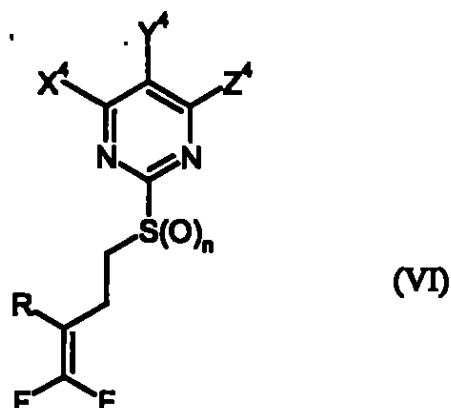


Las pirimidinas halógeno-substituidas, a ser empleadas como productos de partida para la realización del procedimiento (a), según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (II). En la fórmula (II), n y R tienen los significados preferentes o bien especialmente preferentes, que ya han sido dados como preferentes, como especialmente preferentes para n y R en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Preferentemente X^1 tiene preferentemente el significado anteriormente indicado para X como preferente, como especialmente preferente o como muy especialmente preferente; Y^1 tiene preferentemente los significados que han sido anteriormente indicados para Y como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes y Z^1 tiene preferentemente los significados que han sido indicados anteriormente para Z como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes, significando al menos una de los restos X^1 , Y^1 o Z^1 halógeno, preferentemente flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo y ninguno de estos restos significa heterociclilo.

Los productos de partida, de la fórmula general (II) son ampliamente conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véase, especialmente, la

publicación EP 506 270 A1 así como la WO 94/06 777 A1 y los ejemplos de obtención).

De este modo, se obtienen las pirimidinas halógeno-substituidas de la fórmula (II), si se hacen reaccionar las hidroxipirimidinas correspondientes de la fórmula (VI),



5 en la que

n y R tienen el significado anteriormente indicado,

X', Y' y Z' tienen, respectivamente, los significados indicados anteriormente para los restos X, Y y Z correspondientes, pero, sin embargo, en ningún caso significan un grupo heterociclilo,

10 y, al menos, uno de los restos X', Y' y Z' significa hidroxilo,

con un "agente de halogenación", es decir un producto químico adecuado para la introducción de halógeno-substituyentes en lugar de grupos hidroxilo en los heterociclos, tal como, por ejemplo, cloruro de tionilo, o fosgeno, a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C (véanse los ejemplos de obtención).

15 Las hidroxipirimidinas de la fórmula general (VI), necesarias en este caso como productos de partida, son conocidas y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las publicaciones EP 506 270 A1 / US 5,246,938 A, WO 94/06777 A1 / US 5,684,011 A, ejemplos de obtención).

20 Los heterociclos, a ser empleados, además, como productos de partida en el procedimiento (a), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidos, en general, por medio de las fórmulas (IIIa), (IIIb) y (IIIc).

En estas fórmulas, X^2 o bien Y^2 o bien Z^2 tienen, preferentemente, el significado que ya ha sido anteriormente indicado para el grupo heterociclilo como preferente, como especialmente preferente o como muy especialmente preferente.

Los heterociclos de las fórmulas (IIIa), (IIIb) y (IIIc) son productos químicos
5 orgánicos conocidos.

Los heterociclipirimidintioles, a ser empleados como productos de partida en la realización del procedimiento (b) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (IV). En la fórmula (IV), X, Y y Z tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente
10 preferentes o como muy especialmente preferentes para X, Y y Z en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I).

Los productos de partida de la fórmula (IV) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse las publicaciones Dokl. Bolg. Akad. Nauk 24 (1971), 247-250 – citada en Chem. Abstracts 75:5841; Aust. J. Chem. 33 (1980), 2291-
15 2298; Organic Preparations and Procedures International 29 (1997), 285-292; WO 98/27092; Tetrahedron Lett. 40 (1999), 4779-4782).

Los halogenruos de flúoralquenilo, a ser empleados, además, como productos de partida en el procedimiento (b), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), están definidos, en general, por medio de la fórmula (V). En la fórmula
20 (V), R tiene preferentemente el significado que ya ha sido anteriormente indicado para R como preferente o bien como especialmente preferente; X^3 significa, preferentemente, flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente significa cloro o bromo.

Los productos de partida de la fórmula (V) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las publicaciones EP 334 796 A1, EP 660
25 827 A1, EP 712 395 A1, EP 749 433 A1, EP 850 211 A1).

Los procedimientos (a) y (b), según la invención, para la obtención de los

compuestos de la fórmula general (I) se llevan a cabo preferentemente con empleo de uno o varios agentes auxiliares de la reacción. Como agentes auxiliares de la reacción para los procedimientos según la invención entran en consideración, en general, las bases o los aceptores de ácido inorgánicos u orgánicos usuales. A éstos pertenecen, preferentemente, acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos tales como, por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, de potasio, de cesio o de calcio, bicarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio; además también compuestos orgánicos básicos nitrogenados, tales como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, diciticlohexilamina, etil-diciticlohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN) o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-undec-7-eno (DBU).

Los procedimientos (a) y (b), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se llevan a cabo preferentemente con empleo de uno o varios diluyente. Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (b), según la invención, entran en consideración ante todo disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, especialmente, hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como por ejemplo bencina, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, diclorobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter,

dioxano, tetrahidrofurano o etilenglicoldimetil- o -dietiléter; cetonas, tales como acetona, butanona o metil-isobutil-cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo o butironitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metil-formanilida, N-metil-pirrolidona o hexametilfósforotriamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido, alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o i-propanol, etilenglicolmonometiléter, etilenglicolmonoetiléter, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o agua pura.

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a) y (b), según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 150°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

Los procedimientos (a) y (b), según la invención, se llevan a cabo en general a presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo los procedimientos según la invención bajo presión elevada o a presión mas reducida -en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Para la realización de los procedimientos (a) y (b), según la invención, se emplean los productos de partida, en general, en cantidades aproximadamente equimolares. No obstante es posible también emplear uno de los componentes en un exceso mayor. La reacción se lleva a cabo, en general, en un diluyente adecuado, en caso dado en presencia de un agente auxiliar de la reacción y la mezcla de la reacción se agita, en general, durante varias horas a la temperatura deseada. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

Los productos activos son adecuados, con una buena compatibilidad para con las plantas y una toxicidad favorable para los animales de sangre caliente, para la lucha contra las plagas animales, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos, que se presentan en agricultura, en silvicultura, para la protección de productos almacenados y

de los materiales así como en el sector de la higiene. Preferentemente pueden emplearse como agentes protectores de las plantas. Éstos son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o algunos de los estadios del desarrollo individuales. A las plagas anteriormente citadas pertenecen:

- 5 Del orden de los isópodos por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.
 - Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.
 - Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp..
 - Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.
- 10 Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.
 - Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.
 - Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.
 - Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*,
- 15 *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*,
 - Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.
 - Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp..
 - Del orden de los fírraptos, por ejemplo *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..
- 20 Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Fankliniella accidentalis*.
 - Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp..
 - Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*,
- 25 *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera*

vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephrotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp..

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

- Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Anobium punctatum, Rhizophorthera dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus,
- 20 Gibbium psyllodes, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

- Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp.,
- 25 Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp.,

Drosophila melanogaster, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella* frit, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*,
 5 *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp..

Del orden de los sifonópteros, por ejemplo, *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

De la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophys ribis*,
 10 *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hylomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Brevipalpus* spp..

A los nematodos parasitantes de las plantas pertenecen, por ejemplo, *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp.,
 15 *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp..

Los compuestos de la fórmula (I), según la invención, se caracterizan, especialmente, por un efecto excelente contra los piojos de las hojas, contra los escarabajos,
 20 contra las orugas de las mariposas, contra los ácaros de la araña roja y contra los nematodos dañinos para las plantas.

Los compuestos según la invención pueden emplearse, en caso dado, en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación, también como herbicidas y microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos y bactericidas. En caso dado
 25 pueden emplearse también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo de forma directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos activos según la invención pueden transformarse en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos inyectables, suspensiones, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como microencapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante mezclado de los productos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos,

es decir disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

5 Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración preferentemente: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalinas, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las 10 fracciones de petróleo, los alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona o ciclohexanona, o los disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración:

15 por ejemplo sales de amonio y harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatoméas y los minerales sintéticos molturados, tal como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y silicatos; como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo los minerales naturales quebrados y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, así como los granulados sintéticos de harinas inorgánicas y 20 orgánicas y granulados de material orgánico, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o espumantes entran en consideración: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxietilenados de los ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de los alcoholes grasos, 25 por ejemplo, el alquilarilpoliglicoléter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en

consideración: por ejemplo, las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de látex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales
5 tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como
10 sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

Los productos activos según la invención pueden emplearse como tales o en sus formulaciones también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o
15 insecticidas conocidos, para ampliar de este modo, por ejemplo, el espectro de actividad o eliminar los desarrollos de resistencia. En muchos casos se obtienen efectos sinérgicos, es decir que la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales.

Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los
20 compuestos siguientes:

Fungicidas:

2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph; Amidoflúmet; Ampropylfos; Ampropylfos-potasio; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl;
25 Benzamacril; Benzamacril-isobutilo; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine; polisulfuro de

- calcio; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen;
- 5 Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid;
- 10 Fenitropan; Fenoxanil; Fenciclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; hexachlorobenceno; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil;
- 15 Imibenconazole; Iminoctadine triacetato; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-metilo; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrin; Meprotil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil;
- 20 Myclobutanil; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropilo; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; ácido Oxolinico; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodio; Propiconazole; Propineb; Proquinazid;
- 25 Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifeno; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole;

- Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-metilo; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole;
- 5 Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanoamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetraclo-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metilo-N-fenil-5-tiazol o carboxamida; 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida; 3,4,5-
- 10 tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo; Actinovate; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; metil 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato; carbonato monopotásico; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina; tetratiocarbonato de sodio;
- 15 así como sales de cobre y preparaciones de cobre, tales como mezclas Bordeaux; hidróxidos de cobre; naftenatos de cobre; oxiclорuros de cobre; sulfatos de cobre; Cufraneb; óxidos de cobre; Mancopper; oxina de cobre.

Bactericidas:

- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin,
- 20 Octhilinon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

- Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin,
- 25 Allethrin 1R-isomero, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflunet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-metilo,

- Azinphos-etilo, Azocyclotin,
- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis cepa EG-2348, Bacillus thuringiensis cepa GC-91, Bacillus thuringiensis cepa NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb,
- 5 Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-ciclopentilo-isómero, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-etilo, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-metilo), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben,
- 10 Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-metilo, Chlorpyrifos (-etilo), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-
- 15 Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (isómero 1R-trans), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Diafenthiuron,
- 20 Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilariate, Enamectin, Enamectin-benzoato, Empenthrin (isómero 1R), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos,
- 25 Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxido, Fenfluthrin, Fenitrothion,

- Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocyclothrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos,
- 5 Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene,
- 10 IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocab, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, virus nucleopoliédricos, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,
- 15 Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodio, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800,
- 20 Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-metilo,
- 25 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-metilo, Parathion (-etilo), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (isómero 1R-trans), Phenthoate, Phorate, Phosalone,

- Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxido, Pirimicarb, Pirimiphos-metilo, Pirimiphos-etilo, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion,
- 5 Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spiroclufen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,
- 10 Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (isómero 1R), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrifos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodio, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin,
- 15 Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302,
- 20 XMC, Xylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, el compuesto 3-metil-fenil-propilcarbarnato (Tsumacide Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente 3-endo-isómero (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (véase la publicación WO-96/37494, WO-98/25923),
- 25 así como preparados, que contienen extractos vegetales de acción insecticida,

nematodos, hongos o virus.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento protectores o bien productos semiquímicos.

5 Los productos activos, según la invención, pueden presentarse además, cuando se utilizan como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con sinérgicos. Los sinérgicos son los compuestos mediante los cuales se aumenta el efecto de los productos activos, sin que el sinérgico agregado tenga que ser activo en sí mismo.

10 Los productos activos, según la invención, pueden presentarse además, cuando se emplean como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con inhibidores, que impidan una degradación del producto activo tras aplicación en el medio ambiente de las plantas, sobre la superficie de las partes de las plantas o en tejidos vegetales.

15 El contenido en producto activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio puede variar dentro de amplios límites. La concentración de producto activo de las formas de aplicación puede encontrarse entre 0,0000001 hasta 95 % en peso de producto activo preferentemente entre 0,0001 y 1 % en peso.

20 La aplicación se lleva a cabo de una manera adaptada a las formas de aplicación.

En el empleo contra las plagas de la higiene y de los productos almacenados se caracterizan los productos activos por un efecto residual excelente sobre madera y arcilla así como por la buena estabilidad a los álcalis sobre soportes encalados.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención
25 todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos

de cultivo biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en caso dado en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada

De forma especialmente preferente se tratan plantas, según la invención, de las variedades de plantas usuales en el mercado o que se encuentran en utilización. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("características"), que se han cultivado tanto por medio de cultivo convencional, como por mutagénesis o por técnicas recombinantes de DNA. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, periodo de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los, productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas, preferentemente, según la invención, pertenecen todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería

genética, que proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uva), debiéndose señalar especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("características") se señalará especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor resistencia de las plantas frente a los hongos, las bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los

genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características") deseadas pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan bajo las marcas registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas) pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que se comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas ("características").

Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la invención con los compuestos de la fórmula general I o bien de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto.

Los productos activos según la invención no solamente son activos contra las pestes

de las plantas, de la higiene y de los productos almacenados, sino también en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos de los animales (ectoparásitos) tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros migratorios, moscas (chupadoras y picadoras), larvas parasitantes de moscas, piojos, liendres del cabello, liendres de las
5 plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

Del orden de los malofagidos y de los subordenes amblicerinos así como isqunocerinos, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp.,
10 *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

Del orden de los dípteros y de los subórdenes nematocerinos así como braquicerinos, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula*
15 spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypodema* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp..

Del orden de los sifonapteridos, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp.,
20 *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..

Del orden de los heteropteridos, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..

Del orden de los blataridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Supella* spp..

25 De las subclase de los ácaros (Acarida) y del orden de los meta- así como mesoestigmatos, por ejemplo *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp.,

Amblyomma spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Railletia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..

Del orden de los actinédidos (Prostigmata) y acarídidos (Astigmata), por ejemplo

5 *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..

10 Los productos activos según la invención, de la fórmula (I), son adecuados también para la lucha contra los artrópodos, que atacan a los animales útiles en agricultura tales como, por ejemplo, vacas, corderos, cabras, caballos, chanchos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, demás animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de salón, peces de acuario así como a los denominados

15 animales de ensayo, tales como, por ejemplo, hámster, conejillos de Indias, ratas y ratones. Mediante la lucha contra estos artrópodos se evitaban casos de fallecimiento y reducciones de la productividad (en leche, carne, lana, pieles, huevos, miel, etc), de manera que, mediante el empleo de los productos activos según la invención, es posible un mantenimiento de los animales mas económico y mas sencillo.

20 La aplicación de los productos activos según la invención se lleva a cabo en el sector de la veterinaria de forma conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas, grageas, granulados, pastas, bolis, por medio del procedimiento a través de la comida "feed-through", de supositorios, mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular,

25 subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantados, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dermal en forma, por ejemplo de inmersión o de baño (Dippen),

pulverizado (Spray), regado superficial (Pour-on y Spot-on), de lavado, de empolvado así como con ayuda de cuerpos moldeados que contengan el producto activo tales como collarines, marcas para las orejas, marcas para el rabo, bandas para las extremidades, cabestros, dispositivos de marcado, etc.

5 Cuando se emplean para ganado doméstico, aves, animales domésticos etc. pueden emplearse los productos activos de la fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes capaces de extenderse), que contengan los productos activos en cantidades de 1 a 80 % en peso, directamente o tras dilución de 100 hasta 10.000 veces o pueden emplearse a modo de baño químico.

10 Además se ha encontrado que los productos activos según la invención muestran un elevado efecto insecticida contra insectos, que destruyen los materiales industriales.

De manera ejemplificativa y preferente - sin embargo sin carácter limitativo - pueden citarse los insectos siguientes:

15 Escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpine*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*; *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*.

20 Himenópteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*,² *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*.

25 Tisanuros, tal como *Lepisma saccharina*.

Por materiales industriales se entenderán en el contexto presente materiales no-

vivos, tales como, preferentemente, materiales sintéticos, pegamentos, colas, papel y cartón, cuero, madera y productos de elaboración de la madera y pinturas.

De una manera muy especial, los materiales a ser protegidos contra el ataque de los insectos están constituidos por madera y productos de elaboración de la madera.

5 Por madera y productos de elaboración de la madera, que pueden ser protegidos por medio de los agentes según la invención o de las mezclas que los contengan, deberá entenderse, por ejemplo:

madera para la construcción, vigas de madera, traviesas para ferrocarril, piezas para puentes, costillas para barcas, vehículos de madera, cajas, paletas, contenedores, postes
10 telefónicos, revestimientos de madera, ventanas y puertas de madera, contrachapado de madera, placas de contrachapado, trabajos de carpintería o artículos de madera, que encuentran aplicación, de una manera muy general, en el hogar o en la industria de la construcción.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de concentrados
15 o de formulaciones usuales en general tales como polvos, granulados, soluciones, suspensiones, emulsiones o pastas.

Las formulaciones citadas pueden prepararse en forma en sí conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos con al menos un disolvente o bien diluyente, emulsionante, dispersantes y/o aglutinante o agente de fijación, repelente del agua, en caso
20 dado secantes y estabilizantes contra los UV y, en caso dado, colorantes y pigmentos así como otros agentes auxiliares de elaboración.

Los agentes o concentrados insecticidas, a ser empleados para la protección de la madera y de los materiales de madera, contienen el producto activo según la invención en una concentración de 0,0001 hasta 95 % en peso, especialmente de 0,001 hasta 60 % en
25 peso.

Las cantidades de los agentes o bien de los concentrados empleados dependen del

tipo y del origen de los insectos y del medio. Las cantidades de aplicación óptimas pueden determinarse respectivamente por medio de series de ensayos previamente a la aplicación. En general sin embargo es suficiente con emplear de 0,0001 hasta 20 % en peso, preferentemente de 0,001 hasta 10 % en peso del producto activo, referido al material a ser protegido.

Como disolvente y/o diluyente sirve un disolvente o una mezcla de disolventes órgano-químicos y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos, oleaginosos o tipo oleaginoso, difícilmente volátiles y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos polares y/o agua y, en caso dado un emulsionante y/o humectante.

Como disolventes órgano-químicos se emplearán, preferentemente, disolventes oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente situado por encima de 45°C. A modo de tales disolventes difícilmente volátiles, insolubles en agua, oleaginosos o de tipo oleaginoso, se emplearán aceites minerales correspondientes o sus fracciones aromáticas o mezclas de disolventes que contengan aceites minerales, preferentemente bencina para ensayos, petróleo y/o alquilbenceno.

Ventajosamente se emplearán aceites minerales con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, bencina para ensayos con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, aceite para husillos con un intervalo de ebullición de 250 hasta 350°C, petróleo o bien hidrocarburos aromáticos con un intervalo de ebullición de 160 hasta 280°C, aceite de terpentina y similares.

En una forma de realización preferente se emplearán hidrocarburos alifáticos líquidos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 210°C o mezcla de elevado punto de ebullición de hidrocarburos aromáticos y alifáticos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 220°C y/o aceite para husillos y/o monocloronaftalina, preferentemente α -monocloronaftalina.

Los disolventes orgánicos, difícilmente volátiles, oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y con un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, pueden substituirse parcialmente por disolventes órgano-químicos ligeros o de volatilidad media, con la condición de que la
5 mezcla de disolventes presente un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, y que la mezcla insecticida-fungicida sea soluble o emulsionable en esta mezcla de disolventes.

Según una forma de realización preferente se substituirá una parte del disolvente o de la mezcla de disolventes órgano-químicos o un disolvente o mezcla de disolventes
10 órgano-químicos alifáticos, polares. Preferentemente se emplearán disolventes órgano-químicos alifáticos que contengan grupos hidroxilo y/o éster y/o éter, tales como, por ejemplo, glicoléter, ésteres o similares.

Como aglutinantes órgano-químicos se emplearán en el ámbito de la presente invención las resinas sintéticas y/o los aceites secantes de fraguado, en si conocidos, diluibles con agua y/o solubles o dispersables o bien emulsionables en los disolventes
15 órgano-químicos empleados, especialmente aglutinantes constituidos por o que contengan resina acrílica, una resina vinílica, por ejemplo acetato de polivinilo, resina de poliéster, resina de policondensación o de poliadición, resina de poliuretano, resina alquídica o bien resina alquídica modificada, resina fenólica, resina hidrocarbonada tal como resina de
20 indeno-cumarona, resina de silicona, aceites secantes vegetales y/o secantes y/o aglutinantes secantes físicos a base de una resina natural y/o sintética.

La resina sintética, empleada como aglutinante, puede emplearse en forma de una emulsión, dispersión o solución. Como aglutinantes pueden emplearse también betún o sustancias bituminosas hasta un 10 % en peso. De manera complementaria pueden
25 emplearse colorantes, pigmentos agentes repelentes del agua, correctores del olor e inhibidores o agentes protectores contra la corrosión en si conocidos, y similares.

Es preferente emplear en el medio o en el concentrado, según la invención, como aglutinante órgano-químico al menos una resina alquídica o bien una resina alquídica modificada y/o un aceite vegetal secante. Preferentemente se emplearán según la invención resinas alquídicas con un contenido en aceite mayor que el 45 % en peso, preferentemente del 50 hasta el 68 % en peso.

El aglutinante citado puede substituirse parcial o totalmente por un agente(mezcla) de fijación o por una plastificante(mezcla). Estos aditivos deben evitar una volatilización de los productos activos así como una cristalización o bien una precipitación. Preferentemente substituyen a un 0,01 hasta un 30 % del aglutinante (referido al 100 % del aglutinante empleado).

Los plastificantes son de la clase química de los ésteres del ácido ftálico tales como ftalato de dibutilo, de dioctilo o de bencilbutilo, ésteres del ácido fosfórico, tal como el fosfato de tributilo, ésteres del ácido adípico, tal como el adipato de di-(2-etilhexilo), estearatos tales como estearato de butilo o estearato de amilo, oleatos tal como oleato de butilo, éteres de glicerina o glicoléteres de elevado peso molecular, ésteres de glicerina así como ésteres del ácido p-toluenosulfónico.

Los agentes de fijación están basados químicamente en polivinilalquiléteres tal como el polivinilmetiléter o en cetonas tales como benzofenona, etilenbenzofenona.

Como disolvente o bien diluyente entra en consideración especialmente el agua, en caso dado en mezcla con uno o varios de los disolventes o bien diluyentes, emulsionante y dispersantes órgano-químicos anteriormente citados.

Se consigue una protección especialmente efectiva de la madera mediante los procedimientos de impregnación a escala industrial, por ejemplo procedimientos al vacío, al vacío doble o a presión.

Los agentes listos para su aplicación pueden contener en caso dado otros insecticidas y, en caso dado uno o varios fungicidas.

Como componentes adicionales de la mezcla entran en consideración preferentemente los insecticidas y fungicidas citados en la WO 94/29 268. Los compuestos citados en este documento constituyen, expresamente, parte integrante de la presente solicitud.

- 5 Como componentes de mezcla muy especialmente preferentes entran en consideración insecticidas, tales como Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid, y Triflumuron, así como fungicidas tales como Epoxiconazole, Hexaconazole, Azaconazole, 10 Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluanid, carbamato de 3-yodo-2-propinil-butilo, N-octil-isotiazolin-3-ona y 4,5-dicloro-N-octilisotiazolin-3-ona.

- Al mismo tiempo pueden emplearse los productos activos según la invención para la protección contra la proliferación de organismos sobre objetos, especialmente 15 sobre los cuerpos de buques, tamicos, redes, construcciones, instalaciones portuarias e instalaciones de señalización, que entran en contacto con agua de mar o con agua salobre.

- La proliferación de organismos debida a Oligochaeten sesiles, tales como tubicideos calcáreos así como debido a los bivalvos y especies del grupo de los 20 lepadomorfos (bellotas de mar), tal como diversos tipos de Lepas y Scalpellum o debido a tipos del grupo de los balanomorfos (percebes), tales como especies de Balanus, o Pollicipes, aumentan la resistencia al rozamiento de los barcos y conduce, como consecuencia de un mayor consumo de energía y además debido a las frecuentes estancias en dique seco, a un claro aumento de los costes de explotación.

- 25 Además de la proliferación de organismos debida a las algas, por ejemplo Ectocarpus sp. y Ceramium sp., tiene un significado especial en particular la

proliferación de organismos debida a grupos sesiles de entomostráceos, que se agrupan bajo el nombre de Cirripedia (crustáceos cirrípedos).

Se ha encontrado ahora, sorprendentemente, que los productos activos según la invención presentan un efecto antiincrustante (antiproliferación de organismos)

5 excelente

Mediante el empleo de los productos activos según la invención puede desistirse al empleo de metales pesados tales como por ejemplo en los sulfuros de bis(trialquilestaño), laurato de tri-*n*-butilestaño, cloruro de tri-*n*-butilestaño, óxido cuproso (I), cloruro de trietilestaño, tri-*n*-butil-(2-fenil-4-clorofenoxi)-estaño, óxido de 10 tributilestaño, disulfuro de molibdeno, óxido de antimonio, butil-titanato polímero, cloruro de fenil-(bispiridin)-bismuto, fluoruro de tri-*n*-butilestaño, etilenbistiocarbamato de manganeso, dimetilditiocarbamato de cinc, etilenbistiocarbamato de cinc, sales de cinc y de cobre del 2-piridintiol-1-óxido, etilenbistiocarbamato de bisdimetilditiocarbamoilcinc, óxido de cinc, etilen-bisditiocarbamato cuproso (I), 15 tiocianato de cobre, naftenato de cobre y halogenuros de tributilestaño o puede reducirse decisivamente la concentración de estos compuestos.

Las pinturas antiincrustantes listas para su aplicación contienen, en caso dado, además, otros productos activos, preferentemente alguicidas, fungicidas, herbicidas, molusquicidas o bien con otros productos activos antiincrustantes.

20 Como componentes de la combinación para los agentes antiincrustantes según la invención son adecuados, preferentemente:

Alguicidas tales como 2-*terc.*-butilamino-4-ciclopropilamino-6-metiltio-1,3,5-triazina,² Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine y Terbutryn;

25 Fungicidas tales como S,S-dióxido de la ciclohexilamida del ácido benzo[*b*]-tiofenocarboxílico, Dichlofluanid, Fluorfolpet, butilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo,

Tolylfluanid y azoles tales como Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propioconazole y Tebuconazole;

Molusquicidas tales como Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb y Trimethacarb;.

- 5 o agentes antiincrustantes tradicionales tales como 4,5-dicloro-2-octil-4-isotiazolin-3-ona, diyodometilparatrisulfona, 2-(N,N-dimetiltiocarbamoilitio)-5-nitrotiazilo, sales de potasio, de cobre, de sodio y de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, piridin-trifenilborano, tetrabutildiestannoxano, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, 2,4,5,6-tetraclorisoftalonitrilo, disulfuro de tetrametiltiouram y 2,4,6-triclorofenilmaleinimida.

- 10 Los agentes antiincrustantes empleados contienen los productos activos según la invención en una concentración de 0,001 hasta 50 % en peso, especialmente de 0,01 hasta 20 % en peso.

- Los agentes antiincrustantes según la invención contienen además usualmente los componentes frecuentes, pero sin limitarse a los mismos, tales como por ejemplo los que se han descrito en Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732 y Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, 1973.

Las pinturas antiincrustantes contienen, además de los productos activos alguicidas, fungicidas, molusquicidas e insecticidas según la invención, especialmente aglutinantes.

- 20 Ejemplos de aglutinantes reconocidos son cloruro de polivinilo en un sistema disolvente, caucho clorado en un sistema disolvente, resinas acrílicas en un sistema disolvente especialmente en un sistema acuoso, sistemas de copolímeros de cloruro de vinilo/acétato de vinilo en forma de dispersiones acuosas o en forma de sistemas en disolventes orgánicos, cauchos de butadieno/estireno/acrilonitrilo, aceites desecantes
25 tales como aceite de linaza, ésteres resínicos o ésteres resínicos modificados en combinación con alquitranes o betunes, asfalto así como epoxi-compuestos, pequeñas

cantidades de clorocaucho, polipropileno clorado y resinas vinílicas.

En caso dado las pinturas contienen también pigmentos inorgánicos, pigmentos orgánicos o colorantes, que preferentemente sean insolubles en el agua marina. Además las pinturas pueden contener materiales tales como colofonio para posibilitar una liberación controlada de los productos activos. Las pinturas pueden contener además plastificantes, agentes modificantes que influyan sobre las propiedades reológicas así como otros componentes tradicionales. También en sistemas antiincrustantes de autopulido puede incorporarse los compuestos según la invención o las mezclas anteriormente citadas.

Los productos activos según la invención son adecuados para combatir las plagas animales, especialmente los insectos, arácnidos y ácaros, que se presentan en los recintos cerrados, tales como, por ejemplo, viviendas, instalaciones fabriles, oficinas, cabinas de vehículos automóviles y similares. Estas pueden emplearse para combatir estas plagas en productos insecticidas para el hogar. Estas son activas contra tipos sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo. .

A estas plagas pertenecen:

del orden de los escorpionideos, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia asp.*, *Dermanysus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Del orden de los araneos, por ejemplo *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Del orden de los opiliones, por ejemplo *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplopodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp..

Del orden de los cigentomos, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma* *sacharina*, *Lepismodes* *inquilinus*.

5 Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta* *orientalis*, *Blatella* *germanica*, *Blatella* *asahinai*, *Leucophaea* *maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* *australasiae*, *Periplaneta* *americana*, *Periplaneta* *brunnea*, *Periplaneta* *fuliginosa*, *Supella* *longipalpa*.

Del orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta* *domesticus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula* *auricularia*.

10 Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.

Del orden de los psocopteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus* *oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha* *dominica*, *Sitophilus* *granarius*, *Sitophilus* *oryzae*, *Sitophilus* *zeamais*, *Stegobium* *paniceum*.

15 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* *aegypti*, *Aedes* *albopictus*, *Aedes* *taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora* *erythrocephala*, *Chysozona* *pluvialis*, *Culex* *quinquefasciatus*, *Culex* *pipiens*, *Culex* *tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia* *canicularis*, *Musca* *domestica*, *Phlebotomus* spp, *Sarcophaga* *caritaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys* *calcitrans*, *Tipula* *paludosa*.

20 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achoria* *grisella*, *Galleria* *mollonella*, *Plodia* *interpunctella*, *Tinea* *cloacella*, *Tinea* *pellionella*, *Tineola* *bisselliella*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides* *canis*, *Ctenocephalides* *felis*, *Pulex* *irritans*, *Tunga* *penetrans*, *Xenopsylla* *cheopis*.

25 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus* *herculeanus*, *Lasius* *fuliginosus*, *Lasius* *niger*, *Lasius* *umbratus*, *Monomorium* *pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium* *caespitum*.

Del orden de los anopluros, por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

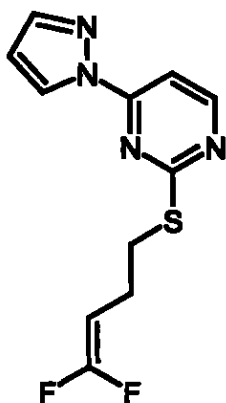
Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- 5 La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se lleva a cabo sola o en combinación con otros productos activos adecuados tales como ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento o productos activos de otras clases conocidas de insecticidas,

- 10 La aplicación se lleva a cabo en aerosoles, agentes para pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores por bombeo y por pulverizado, dispositivos automáticos de nebulizado, nebulizadores, generadores de espuma, geles, productos para evaporadores con plaquetas para los evaporadores de celulosa o de material sintético, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados mediante ventilador, sistemas evaporadores sin consumo de energía o bien pasivos,
- 15 papeles contra las polillas, bolsitas contra las polillas y geles contra las polillas, en forma de granulados o de polvo, en cebos esparcibles o en estaciones para cebos.

Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1



20

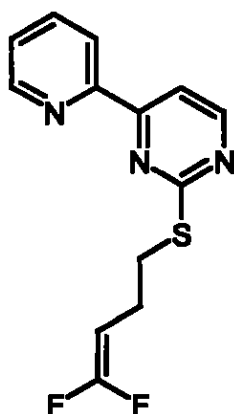
(procedimiento (a))

Se añaden 3,0 g (12,7 mmol) de 4-cloro-2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-pirimidina, a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) con 9,1 g (27,9 mmol) de carbonato de cesio y 0,86 g (12,7 mmol) de pirazol en 60 ml de acetonitrilo y esta mezcla se agita durante 30 minutos a reflujo. La carga se refrigera, se separa mediante
5 filtración por succión, el residuo se lava con acetonitrilo y el disolvente se elimina por destilación. El producto en bruto se purifica adicionalmente por cromatografía sobre gel de sílice con diclorometano como eluyente.

Se obtienen 2,55 g (75 % de la teoría) de la 2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-4-(pirazol-1-il)-pirimidina en forma de aceite amarillo.

10 logP (pH 2,3): 3,3

Ejemplo 2



(procedimiento (b))

Se disponen 5,68 g (30 mmol) de 4-(2-piridinil)-2-pirimidintiol y 16,58 g (120
15 mmol) de carbonato de potasio en 100 ml de acetonitrilo, se añaden 5,13 g (30 mmol) de 4-bromo-1,1-difluor-but-1-eno y la mezcla de la reacción se agita durante 16 horas a 60°C. A continuación se concentra por evaporación bajo presión reducida, el residuo se distribuye entre agua y diclorometano, la fase acuosa se extrae otras dos veces con diclorometano, las fases orgánicas, reunidas, se secan con sulfato de sodio y se filtran. El
20 disolvente se elimina, cuidadosamente, del filtrado por destilación bajo presión reducida.

Se obtienen 7,6 g (88 % de la teoría) de la 2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-(4-

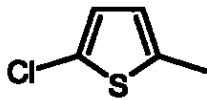
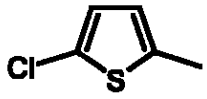
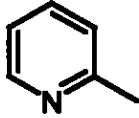
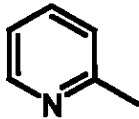
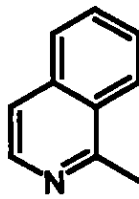
(2-piridinil)-pirimidina en forma de aceite.

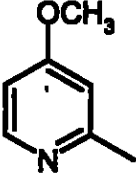
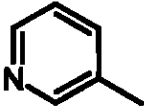
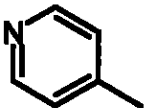
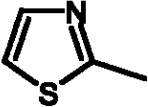
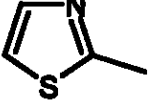
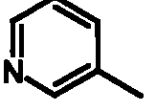
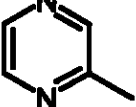
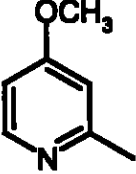
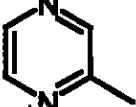
¹H-NMR (CD₃CN): d = 2,50 (m, 2H), 3,28 (t, 2H), 4,45 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,95 (m,1H), 8,05 (m,1H), 8,45 (m,1H), 8,70 (m,2H) ppm.

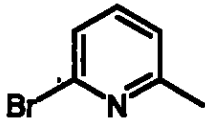
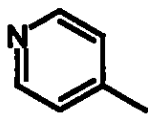
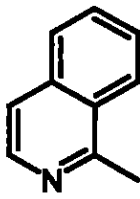
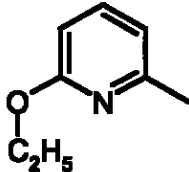
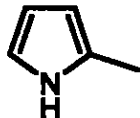
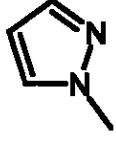
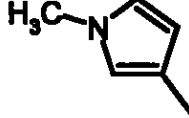
5 logP (pH 2,3) = 3,33

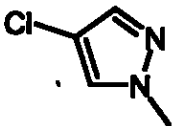
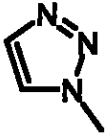
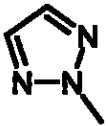
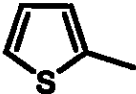
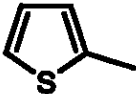
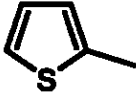
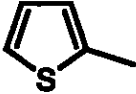
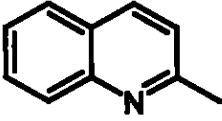
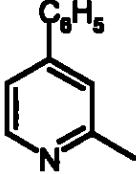
De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2 así como de acuerdo con la descripción general de los procedimientos de obtención según la invención, pueden prepararse, por ejemplo, también los compuestos de la fórmula (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

10 Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I)

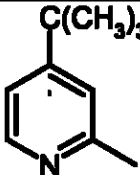
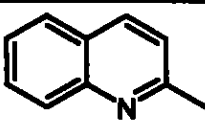
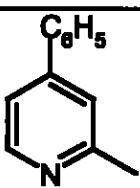
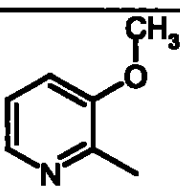
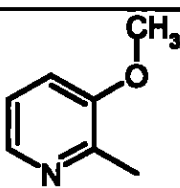
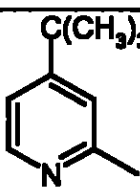
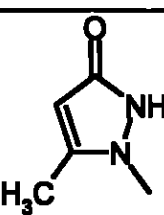
Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
3	0	H		H	H	logP = 4,73 ^{a)}
4	0	F		H	H	logP = 4,70 ^{a)}
5	1	H		H	H	logP = 1,47 ^{a)}
6	2	H		H	H	logP = 2,08 ^{a)}
7	0	H		H	H	logP = 3,67 ^{a)}

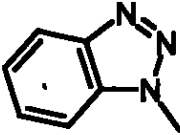
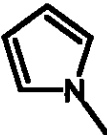
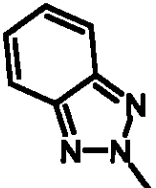
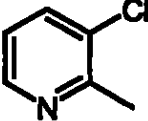
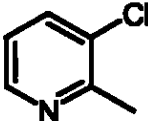
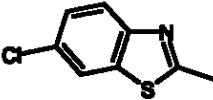
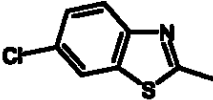
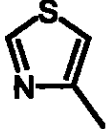
Ejem.						Datos físicos
Nr.	n	R	X	Y	Z	
8	0	H		H	H	$\log P = 2,41^a)$
9	0	H		H	H	$\log P = 1,96^a)$
10	0	H		H	H	$\log P = 1,72^a)$
11	0	H		H	H	$\log P = 3,33^a)$
12	0	F		H	H	$\log P = 1,56^a)$
13	0	F		H	H	$\log P = 2,05^a)$
14	0	H		H	H	$\log P = 2,91^a)$
15	0	F		H	H	$\log P = 2,54^a)$
16	0	F		H	H	$\log P = 2,92^a)$

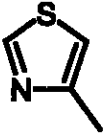
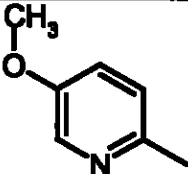
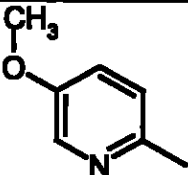
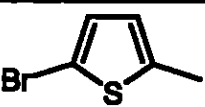
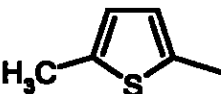
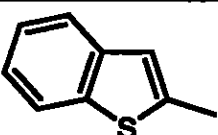
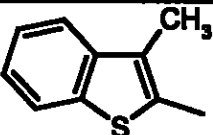
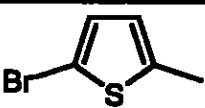
Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
17	0	H		H	H	$\log P = 4,51^a)$
18	0	F		H	H	$\log P = 1,77^a)$
19	0	F		H	H	$\log P = 3,69^a)$
20	0	H		H	H	$\log P = 4,91^a)$
21	0	F		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D ₆ , δ) 11,68 ppm (NH)
22	0	F		H	H	$\log P = 3,27^a)$
23	0 :	F		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D ₆ , δ) 3,68 ppm (N-CH ₃)

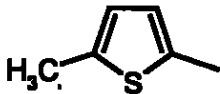
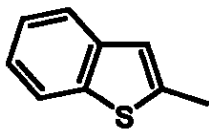
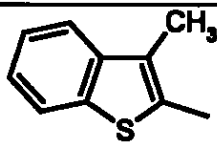
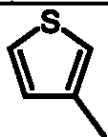
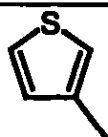
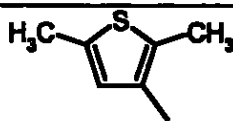
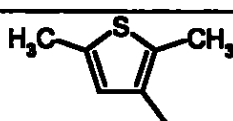
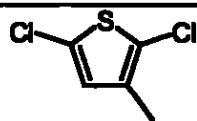
Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
24	0	H		H	H	$\log P = 4,13^a)$
25	0	H		H	H	$\log P = 2,62^a)$
26	0	H		H	H	$\log P = 2,70^a)$
27	0	H		H	H	$\log P = 3,83^a)$
28	0	F		H	H	$\log P = 3,84^a)$
29	1	F		H	H	
30	2	F		H	H	
31	0	H		H	H	$\log P = 4,81^a)$
32	0	H		H	H	$\log P = 4,77^a)$

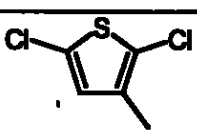
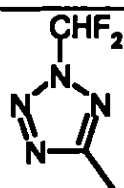
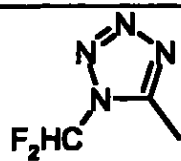
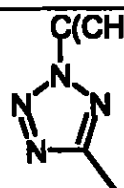
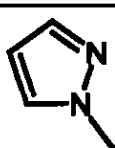
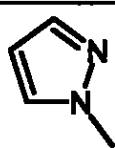
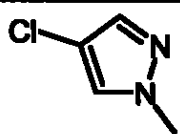
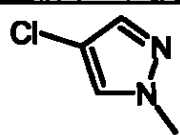
202

Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
33	0	H	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 	H	H	$\log P = 4,80^a)$
34	0	F		H	H	$\log P = 4,81^a)$
35	0	F	C_6H_5 	H	H	$\log P = 4,76^a)$
36	0	F		H	H	$\log P = 2,25^a)$
37	0	H		H	H	$\log P = 2,14^a)$
38	0	F	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 	H	H	$\log P = 4,81^a)$
39	0	H		H	H	$\log P = 2,55^a)$

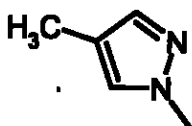
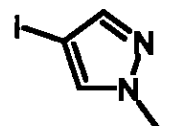
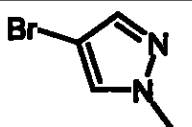
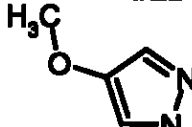
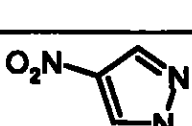
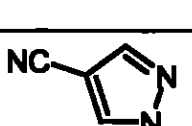
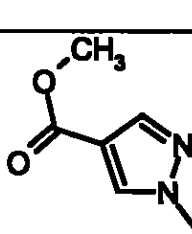
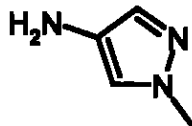
Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
40	0	H		H	H	$\log P = 3,97^a)$
41	0	F		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ) 2,65 ppm (m, 2H)
42	0	H		H	H	$\log P = 3,98^a)$
43	0	H		H	H	$\log P = 3,32^a)$
44	0	F		H	H	$\log P = 3,35^a)$
45	0	H		H	H	$\log P = 5,57^a)$
46	0	F		H	H	$\log P = 5,49^a)$
47	0	F		H	H	$\log P = 3,18^a)$

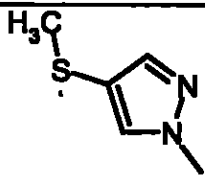
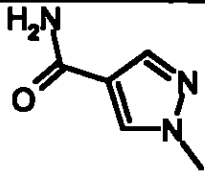
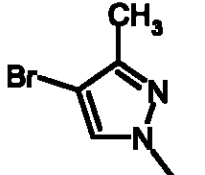
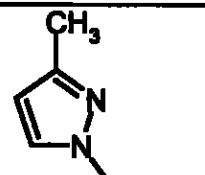
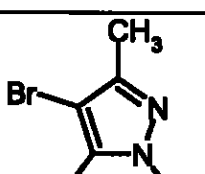
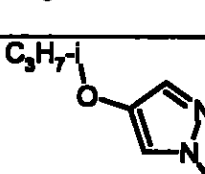
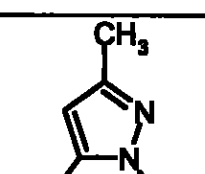
Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
48	0	H		H	H	$\log P = 3,14^a)$
49	0	F		H	H	$\log P = 2,17^a)$
50	0	H		H	H	$\log P = 2,12^a)$
51	0	H		H	H	$\log P = 4,77^a)$
52	0	H		H	H	$\log P = 4,30^a)$
53	0	H		H	H	$\log P = 4,87^a)$
54	0	H		H	H	$\log P = 5,25^a)$
55	0	F		H	H	$\log P = 4,73^a)$

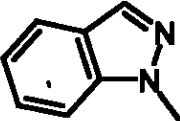
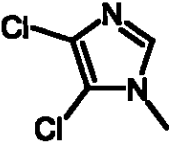
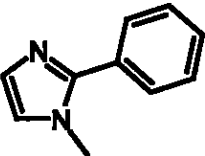
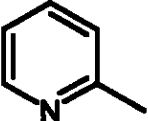
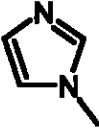
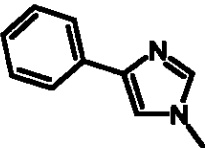
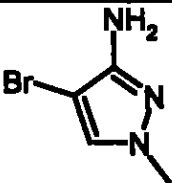
Ejem.						Datos físicos
Nr.	n	R	X	Y	Z	
56	0	F		H	H	$\log P = 4,31^a)$
57	0	F		H	H	$\log P = 4,85^a)$
58	0	F		H	H	$\log P = 5,20^a)$
59	0	H		H	H	$\log P = 3,80^a)$
60	0	F		H	H	$\log P = 3,82^a)$
61	0	H		H	H	$\log P = 4,79^a)$
62	0	F		H	H	$\log P = 4,79^a)$
63	0	H		H	H	$\log P = 5,65^a)$

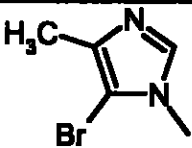
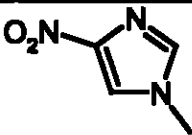
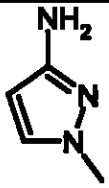
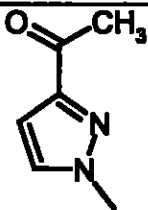
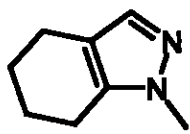
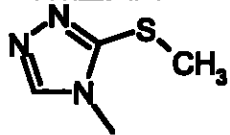
Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
64	0	F		H	H	logP = 5,55 ^{a)}
65	0	F	H		H	
66	0	F	H		H	
67	0	F	H		H	logP = 4,22 ^{a)}
68	2	H		H	H	logP = 2,01 ^{a)}
69	1	H		H	H	logP = 1,55 ^{a)}
70	2	H		H	H	logP = 2,60 ^{a)}
71	1	H		H	H	logP = 2,09 ^{a)}

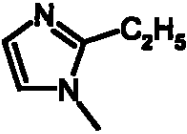
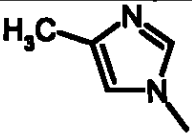
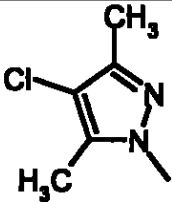
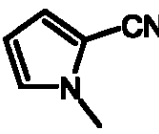
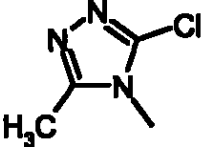
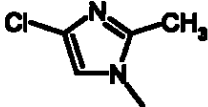
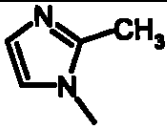
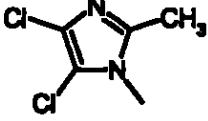
207

Ejem.						Datos físicos
Nr.	n	R	X	Y	Z	
72	0	H		H	H	
73	0	H		H	H	logP = 4,34 ^{a)}
74	0	H		H	H	logP = 4,24 ^{a)}
75	0	H		H	H	logP = 3,47 ^{a)}
76	0	H		H	H	logP = 3,48 ^{a)}
77	0	H		H	H	logP = 3,22 ^{a)}
78	0	H		H	H	
79	0	H		H	H	

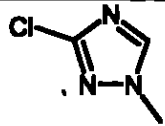
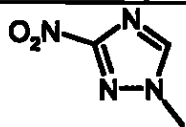
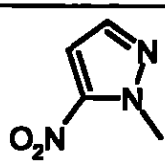
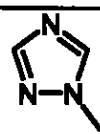
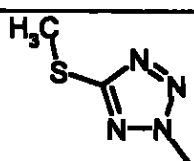
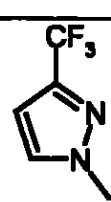
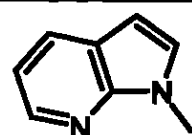
Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
80	0	H		H	H	logP = 4,00 ^{a)}
81	0	H		H	H	logP = 1,98 ^{a)}
82	0	H		H	H	logP = 4,76 ^{a)}
83	0	H		H	H	logP = 3,64 ^{a)}
84	0	H		H	H	logP = 5,25 ^{a)}
85	0	H		H	H	logP = 4,26 ^{a)}
86	0	H		H	H	logP = 3,95 ^{a)}

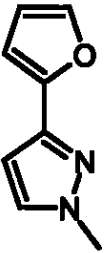
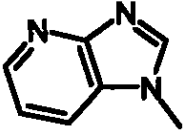
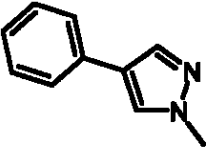
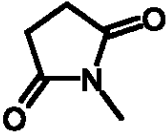
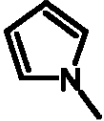
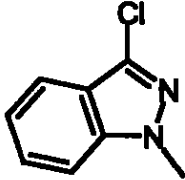
Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
87	0	H		H	H	$\log P = 4,26^a)$
88	0	H		H	H	$\log P = 3,57^a)$
89	0	H		H	H	$\log P = 1,99^a)$
90	0	H		H	H	$\log P = 3,14^a)$
91	0	H		H	H	$\log P = 1,46^a)$
92	0	H		H	H	$\log P = 3,45^a)$
93	0	H		H	H	$\log P = 3,15^a)$

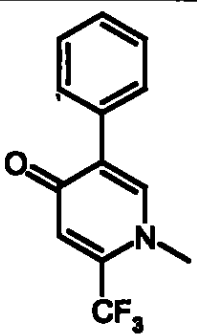
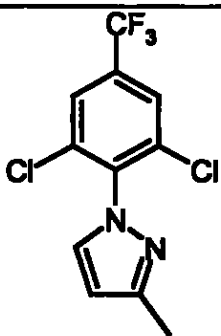
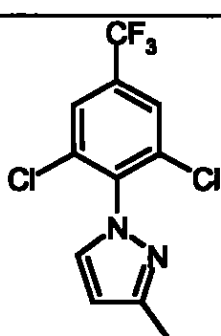
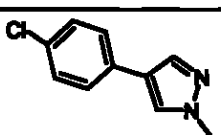
Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
94	0	H		H	H	$\log P = 5,69^a)$
95	0	H		H	H	$\log P = 3,21^a)$
96	0	H		H	H	$\log P = 2,63^a)$
97	0	H		H	H	$\log P = 2,31^a)$
98	0	H		H	H	$\log P = 3,47^a)$
99	0	H		H	H	$\log P = 4,64^a)$
100	0	H		H	H	$\log P = 3,39^a)$

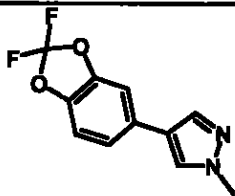
Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
101	0	H		H	H	$\log P = 1,45^a)$
102	0	H		H	H	$\log P = 1,48^a)$
103	0	H		H	H	$\log P = 5,13^a)$
104	0	H		H	H	$\log P = 3,23^a)$
105	0	H		H	H	$\log P = 3,49^a)$
106	0	H		H	H	$\log P = 2,99^a)$
107	0	H		H	H	$\log P = 1,30^a)$
108	0	H		H	H	$\log P = 3,59^a)$

2/2

Ejem.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
Nr.						
109	0	H		H	H	$\log P = 3,31^a)$
110	0	H		H	H	$\log P = 2,95^a)$
111	0	H		H	H	$\log P = 3,09^a)$
112	0	H		H	H	$\log P = 2,44^a)$
113	0	H		H	H	$\log P = 3,34^a)$
114	0	H		H	H	$\log P = 4,41^a)$
115	0	H		H	H	$\log P = 4,60^a)$

Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
116	0	H		H	H	$\log P = 4,22^a)$
117	0	H		H	H	$\log P = 2,22^a)$
118	0	H		H	H	$\log P = 4,71^a)$
119	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 8,80-8,81 ppm
120	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 3,21 ppm
121	0	H		H	H	$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6 , δ): 3,33 ppm

Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
122	0	H		H	H	logP = 4,49 ^{a)}
123	0	H		H	H	logP = 5,21 ^{a)}
124	0	F		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 8,65-8,76 ppm
125	0	H		H	H	¹ H-NMR (DMSO-D ₆ , δ): 4,58-4,67 ppm

Ejem. Nr.	n	R	X	Y	Z	Datos físicos
126	0	H		H	H	logP = 5,20 ^{a)}

La determinación de los valores logP, indicados en las tablas, se llevó a cabo según la directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

(a) Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: 0,1% de ácido fosfórico, acetonitrilo, gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo hasta 90% de acetonitrilo – los resultados correspondientes de la medición están marcados en la tabla 1 con ^{a)}.

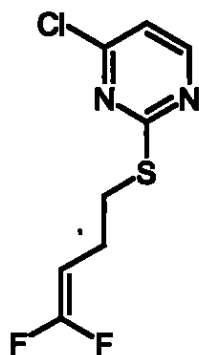
(b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa, tampón, de ácido fosfórico 0,01 molar, acetonitrilo, gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo hasta 90% de acetonitrilo – los resultados correspondientes de la medición están marcados en la tabla 1 con ^{b)}.

El calibrado se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

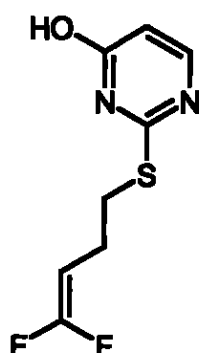
Los valores lambda máximos se determinaron por medio de los espectros UV desde 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Productos de partida d ela fórmula (II):

Ejemplo (II-1)



Etapas 1



- 5 Se suspenden 22,5 g (175 mmol) de 4-hidroxi-2-mercapto-pirimidina en 150 ml de etanol y 150 ml de agua y se añade, a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C) una solución de 7,0 g de hidróxido de sodio en 20 ml de etanol y 20 ml de agua. A continuación se añaden, gota a gota, 33,0 g (193 mmol) de 4-bromo-1,1-difluor-1-buteno y la mezcla se agita durante 30 minutos a 60°C. Tras refrigeración se agita la carga
- 10 durante otras 3 horas a 0°C y el precipitado formado se separa mediante filtración por succión. Esta fase acuosa se extrae con t-butilmetiléter, la fase orgánica se seca con sulfato de bario y se filtra. El disolvente se elimina del filtrado cuidadosamente por destilación bajo presión reducida. Se obtiene un producto sólido amarillo (12,2 g = 32 % de la teoría como primera fracción del producto deseado). La lejía madre, acuosas, se
- 15 satura con sal común y se extrae cuatro veces con 100 ml, cada vez, de acetato de etilo. Las fases orgánicas, reunidas, se secan con sulfato de sodio y se filtran. El disolvente se elimina del filtrado cuidadosamente por destilación bajo presión reducida. Se obtiene un producto sólido amarillo como segunda fracción del producto deseado. Las fracciones,

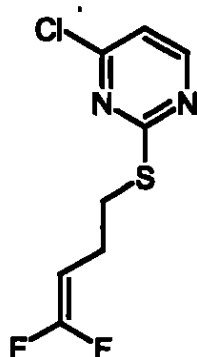
27

-72-

reunidas, se recrystalizan en t-butil-metiléter.

Rendimiento total: 21,1 g (51 % de la teoría) de la 4-hidroxi-2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-pirimidina (punto de fusión: 78°C).

Etapas 2



5

Se añaden 5,5 g (25,2 mmol) de la 4-hidroxi-2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-pirimidina (= 2-[(4,4-difluor-3-butenil)-sulfanil]-4-pirimidinol) a temperatura ambiente (aproximadamente 20°C), en porciones, a 38,6 g (23,5 ml, 252 mmol) de oxocloruro de fósforo y la mezcla se calienta a ebullición durante 10 minutos bajo reflujo. A continuación se concentra por evaporación la carga hasta 3/4 en el evaporador rotativo, el residuo oleaginoso se añade, gota a gota, en 50 ml de agua helada, se ajusta, bajo refrigeración, con lejía de hidróxido de sodio 2N, a pH 5-6 y se extrae varias veces con diclorometano. El producto se obtiene en forma de un aceite amarillo, tras eliminación por destilación del disolvente orgánico.

10

15

Rendimiento: 5,5g (88 % de la teoría)

logP (pH 2,3): 3,3

;

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo con *Aphis gossypii*

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida.

5 Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

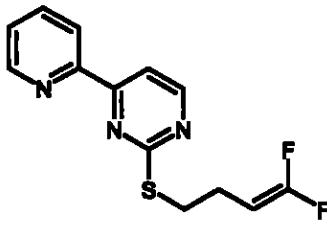
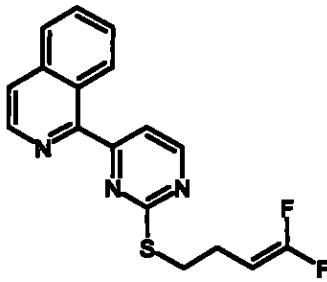
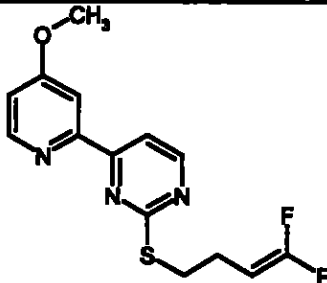
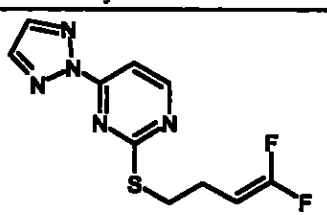
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

10 Se tratan hojas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están fuertemente atacadas por el piojo de la hoja del algodón (*Aphis gossypii*), mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseada se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todos los piojos de la hoja; 0 % significa que no se destruyó ningún piojo de la hoja.

15 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla A.

Tabla A
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con *Aphis gossypii*

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 6 ^d
		
(2)	500	99
		
(7)	500	98
		
(8)	500	99
		

(26)	500	95
------	-----	----

Ejemplo B**Ensayo con *Heliothis armigera***

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

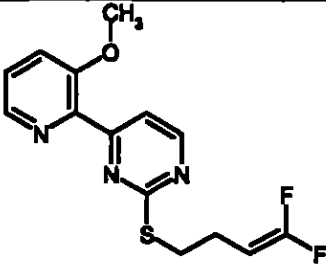
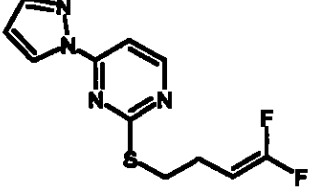
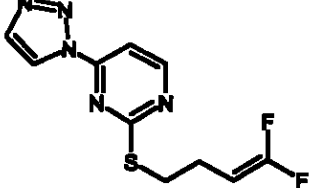
- 10 Se tratan tallos de judía (*Glycine max*), mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas de *Heliothis armigera*, en tanto en cuanto las hojas estén aún húmedas.

Al cabo del tiempo deseada se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

- 15 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla B.

222

Tabla B
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con *Heliothis armigera*

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7 ^d
		
(37)	500	100
		
(1)	500	100
		
(25)	500	100

Ejemplo C**Ensayo con *Meloidogyne***

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

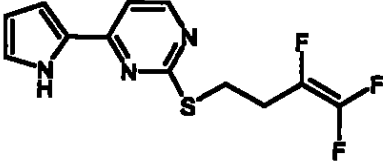
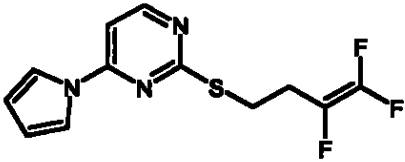
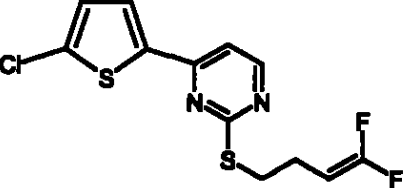
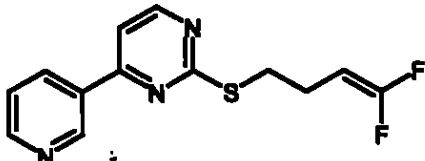
- 10 Se rellenan recipientes con arena, solución del producto activo, suspensión de huevo-larvas de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantitas se desarrollan. En las raíces se desarrollan vesículas.

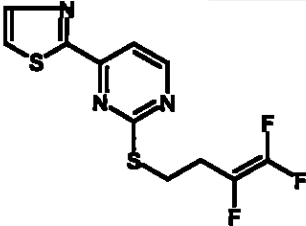
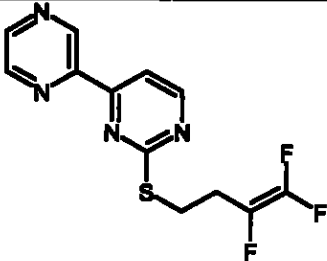
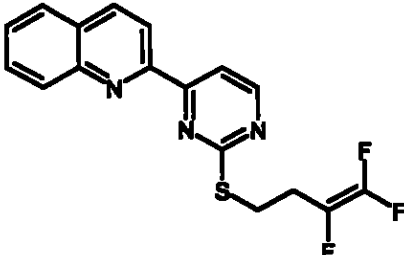
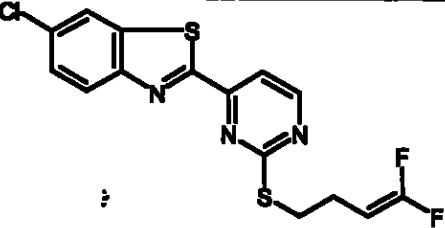
Al cabo del tiempo deseado se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

- 15 Al cabo del tiempo deseado se determina, en %, el efecto nematocida por medio de la formación de vesículas. En este caso 100 % significa que no se ha encontrado ninguna vesícula; 0 % significa que el número de vesículas en las plantas tratadas corresponde al de los controles que no han sido tratados.

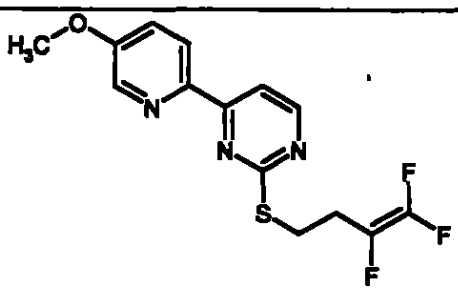
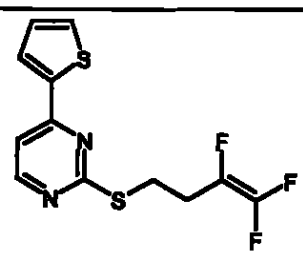
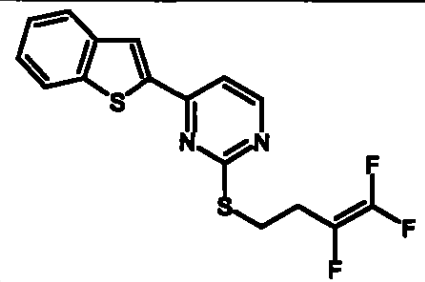
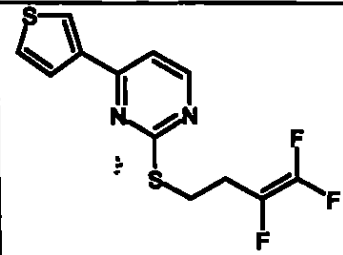
- 20 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla C. También los compuestos con el número de ejemplo 82, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124 y 125 alcanzan en el ensayo anteriormente descrito, a una concentración de 20 ppm, una destrucción del 100 %.

Tabla C
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con Meloidogyne

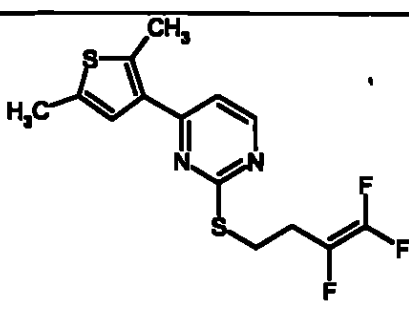
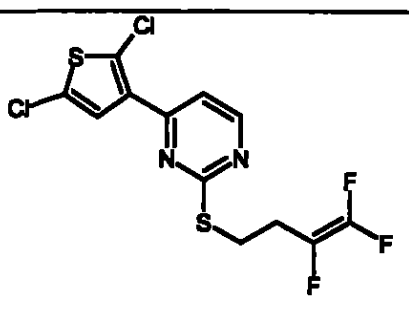
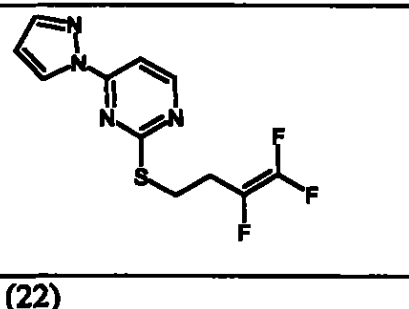
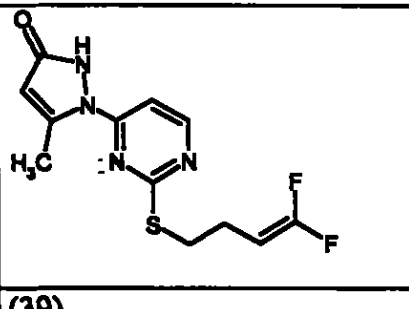
Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14d
		
(21)	20	100
		
(41)	20	100
		
(3)	20	100
		
(9)	20	100

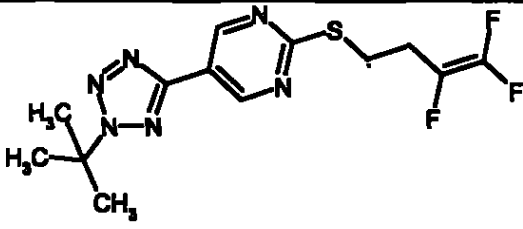
Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14 ^d
		
(12)	20	100
		
(16)	20	100
		
(34)	20	100
		
(45)	20	100

226

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14d
		
(49)	20	100
		
(28)	20	100
		
(57)	20	100
		
(60)	20	100

27

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14d
		
(62)	20	100
		
(64)	20	100
		
(22)	20	100
		
(39)	20	100

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14d
 <chem>CC1(C)N2C=NC(C1)=N2c3ccnc(SCC(F)(F)F)c3</chem>		
(67)	20	100

Ejemplo D**Ensayo con Myzus**

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

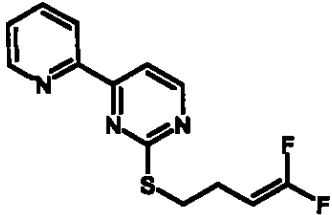
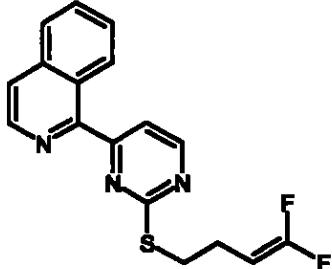
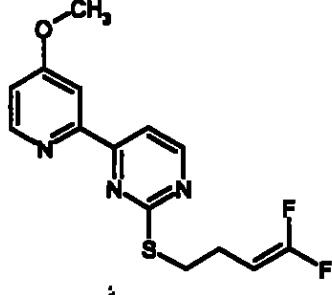
- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

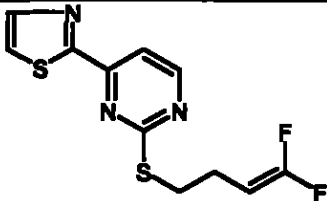
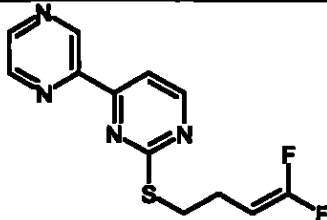
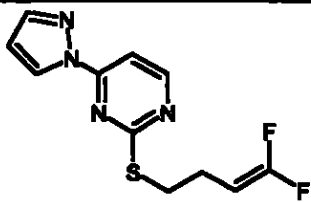
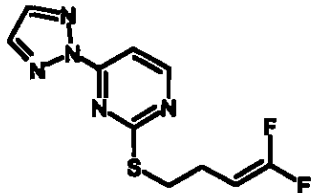
- 10 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*), que están fuertemente atacadas por el piojo de la hoja del duraznero (*Myzus persicae*), mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseada se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todos los piojos de la hoja; 0 % significa que no se destruyó ningún piojo de la hoja.

- 15 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla D.

Tabla D
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con Myzus

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 6 ^d
		
(2)	500	100
		
(7)	500	100
		
(8)	500	95

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 6 ^d
		
(11)	500	95
		
(14)	500	95
		
(1)	500	99
		
(26)	500	99

Ejemplo E

Ensayo con larvas de *Phaedon*

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

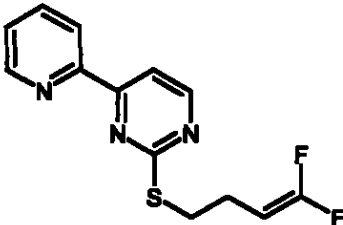
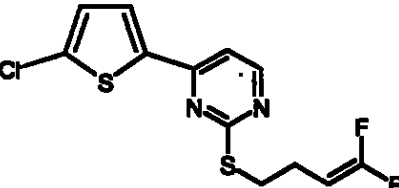
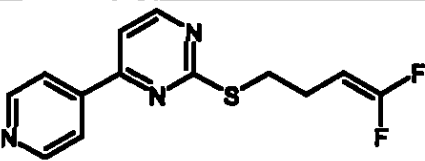
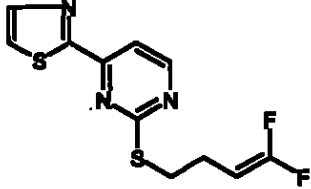
5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

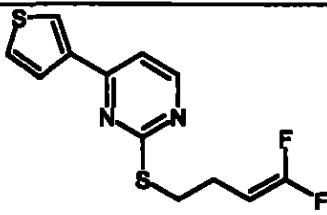
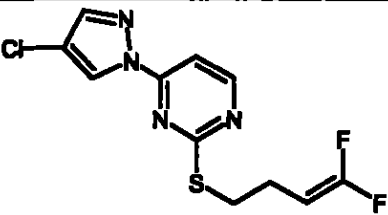
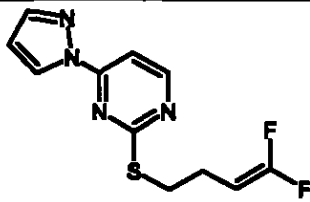
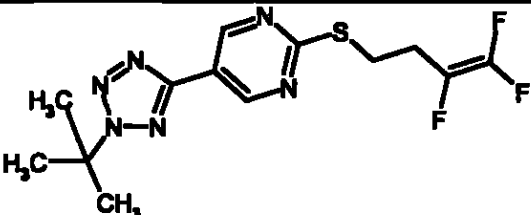
10 Se tratan por inmersión hojas de col (*Brassica oleracea*) en la preparación de producto activo de la concentración deseada y se cubren con larvas del escarabajo de la hoja del rábano rusticano picante (*Phaedon cochleariae*), mientras las hojas estén aún húmedas.

15 Al cabo del tiempo deseado se determina en % el grado de muertes. En este caso 100 % significa que todas las larvas del escarabajo fueron destruidas, 0 % significa que no fue destruida ninguna larva del escarabajo.

Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla E.

Tabla E
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con larvas de Phaeton

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grada de destrucción en % al cabo de 7d
		
(2)	500	100
		
(3)	500	100
		
(10)	500	100
		
(11)	500	95

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grada de destrucción en % al cabo de 7d
		
(59)	500	100
		
(24)	500	100
		
(1)	500	100
		
(67)	500	100

Ejemplo F.**Ensayo con *Plutella***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

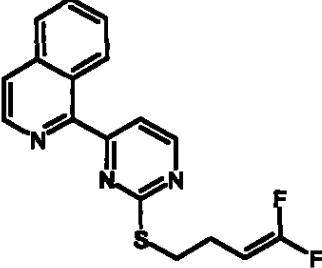
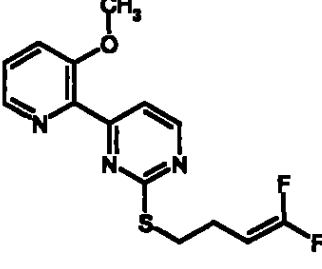
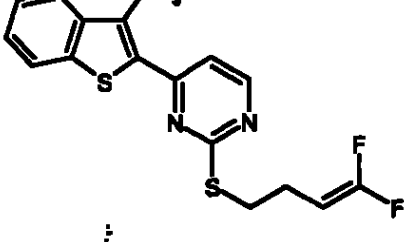
- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

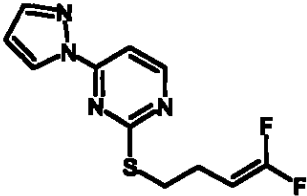
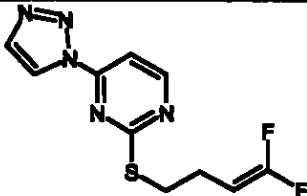
- 10 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas de la polilla de la col (*Plutella xylostella*), en tanto en cuanto las hojas estén aún húmedas.

Al cabo del tiempo deseado se determina el grado de destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

- 15 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla F.

Tabla F
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con Plutella

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(7)	500	100
		
(37)	500	100
		
(54)	500	100

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(1)	500	100
		
(25)	500	100

Ejemplo G.**Ensayo con *Spodoptera frugiperda***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

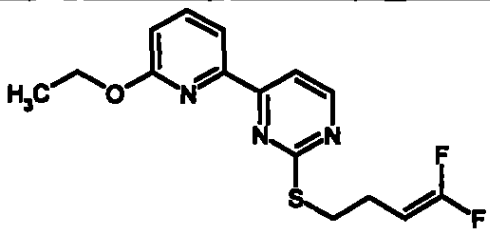
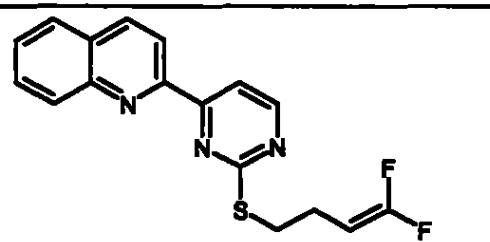
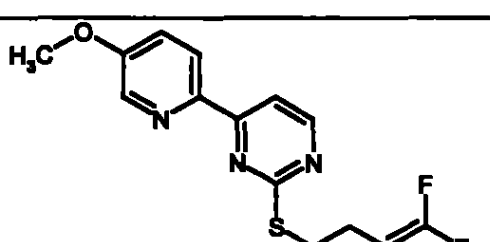
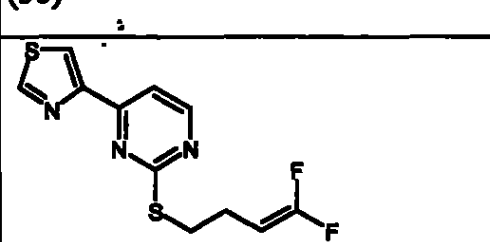
- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

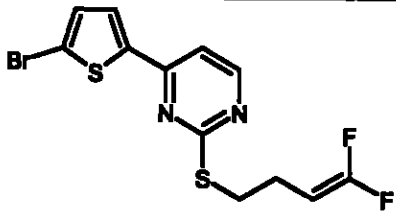
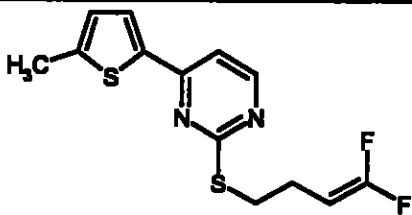
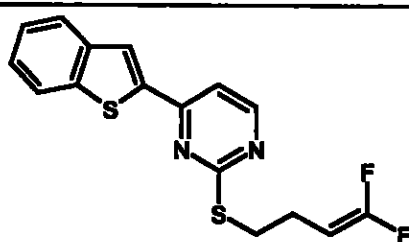
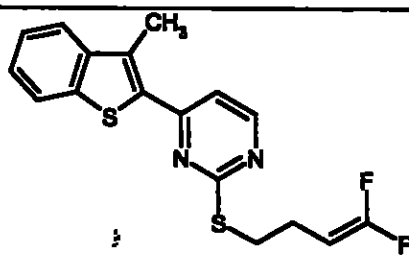
- 10 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas del cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*), en tanto en cuanto las hojas estén aún húmedas.

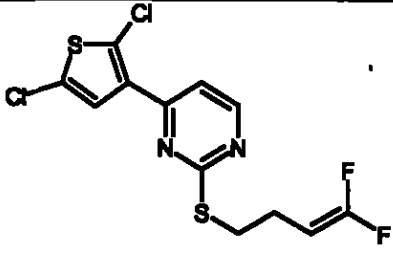
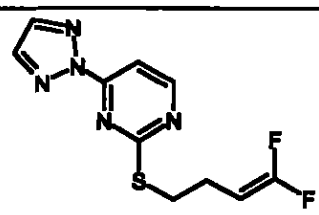
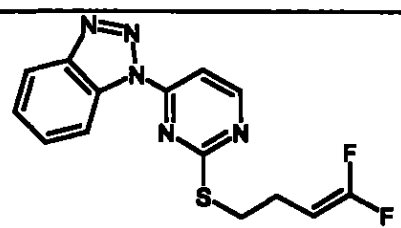
Al cabo del tiempo deseado se determina el grado de destrucción en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

- 15 Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla G.

Tabla G
Insectos dañinos para las plantas
Ensayo con *Spodoptera frugiperda*

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(20)	500	100
		
(31)	500	100
		
(50)	500	100
		

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
(48)	500	100
		
(51)	500	100
		
(52)	500	100
		
(53)	500	100
		
(54)	500	100

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(63)	500	100
		
(26)	500	100
		
(40)	500	100

Ejemplo H**Ensayo con Tetranychus (OP-resistente/tratamiento por inmersión)**

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 Partes en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

- 10 Se sumergen plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que están fuertemente atacadas por todos los estados del desarrollo del ácaro de la arañuela roja común (*Tetranychus urticae*), en una preparación del producto activo de la concentración deseada.

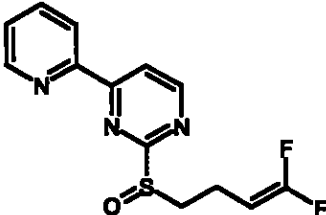
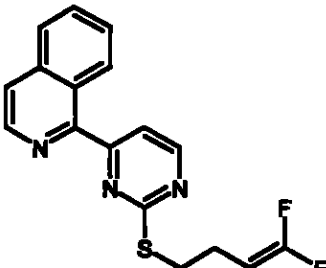
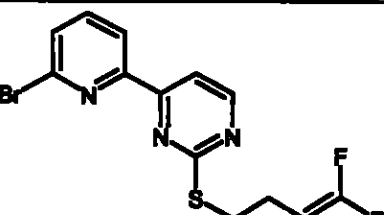
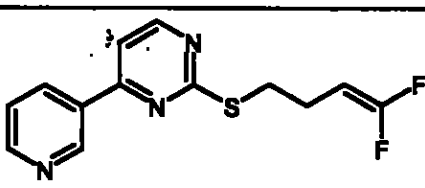
- 15 Al cabo del tiempo deseado se determina en % el grado de muertes. En este caso significan 100 % que se mataron todos los ácaros de la arañuela; 0 % significa que no se mató ningún ácaro de la arañuela.

Los productos activos, las concentraciones de los productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla H.

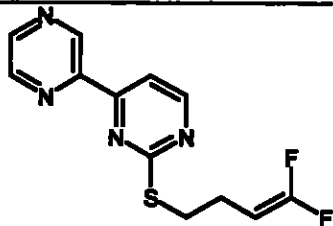
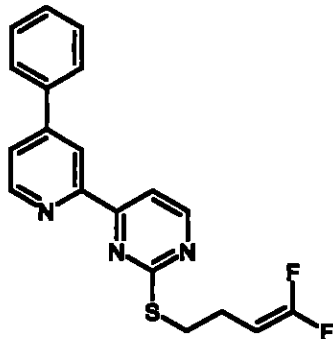
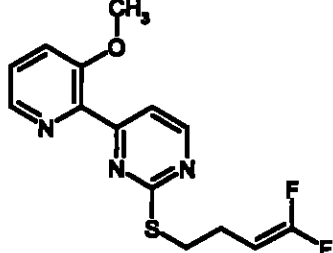
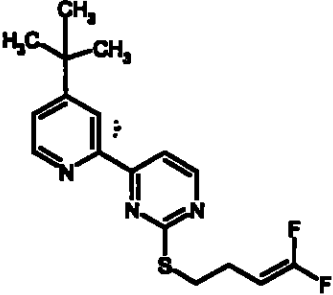
Tabla H

Acaros dañinos para las plantas

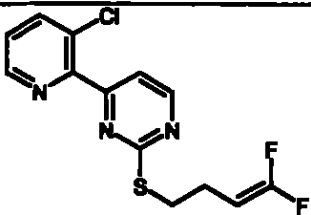
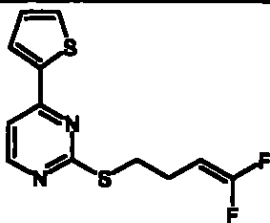
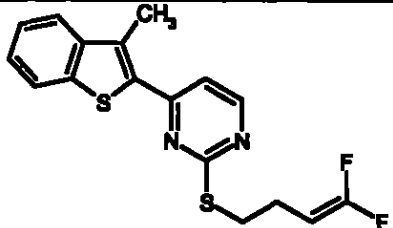
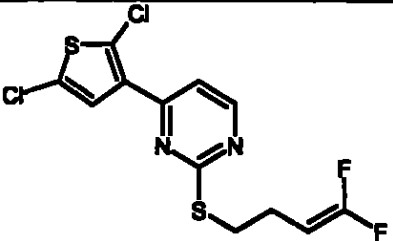
Ensayo con Tetranychus (OP-resistente/tratamiento por inmersión)

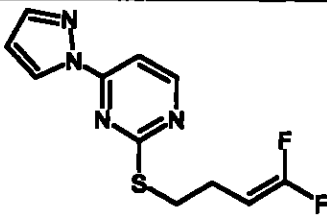
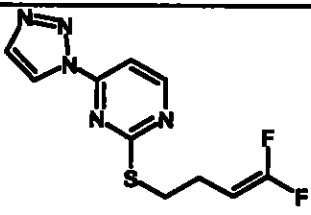
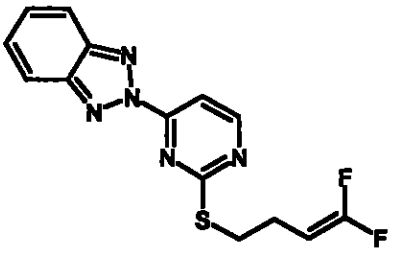
Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(5)	100	100
		
(7)	100	100
		
(17)	100	100
		
(9)	100	100

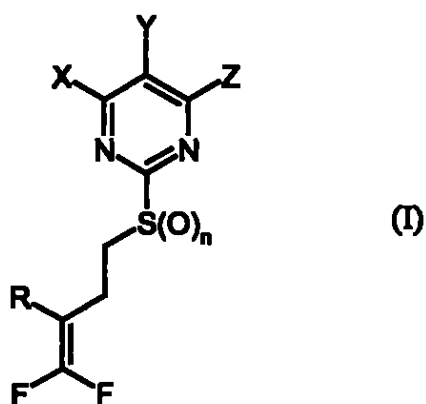
-99-

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(14)	100	100
		
(32)	100	100
		
(37)	100	100
		
(33)	100	100

2X5

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(43)	100	99
		
(27)	100	100
		
(54)	100	100
		
(63)	100	100

Productos activos	Concentración del producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7d
		
(1)	100	100
		
(25)	100	100
		
(42)	100	99

REIVINDICACIONES**1.- Compuestos de la fórmula (I)**

5 en la que

n significa los números 0, 1 o 2,

R significa hidrógeno o flúor,

X, Y y Z independientemente entre sí

significan hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, hidroxi,

10 cianato, tiocianato, halógeno,

significan alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquildaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6

15 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,

significan respectivamente, alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos, en caso

20 dado, por halógeno,

significan cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente,

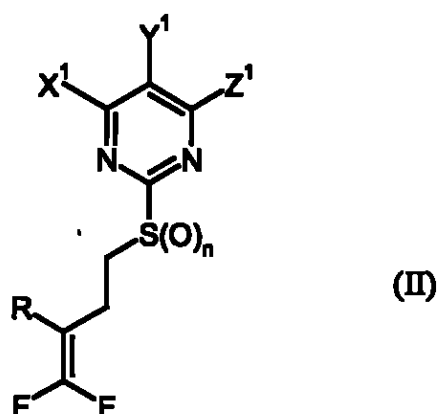
- 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o
- conjuntamente significan un agrupamiento benzo o significan alquilenos o alquenilenos con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono, inclusive, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente contiguos) y estando substituido, a su vez, el anillo, formado de este modo, en caso dado, por halógeno o por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono,
- y, al menos, uno de los restos X, Y o Z
- significa un agrupamiento heterocíclico saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, con hasta 10 átomos de carbono, inclusive, y con hasta 5 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además uno o dos agrupamientos oxo ($C=O$), un agrupamiento tioxo ($C=S$), un agrupamiento $SO-$ o un agrupamiento SO_2- , y que contiene, en caso dado, hasta 4 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:
- nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxilo; halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcóxicarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo

o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono; alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno; cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, con 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo; fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi-carbonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

2.- Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizado porque

(a) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (II),

;



en la que

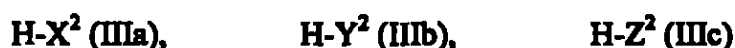
n y R tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

5 X¹, Y¹ y Z¹ tienen los significados indicados respectivamente en la reivindicación 1 para los restos correspondientes X, Y y Z, pero, sin embargo, no significan, en ningún caso un agrupamiento heterocíclico,

y al menos uno de los restos X¹, Y¹ o Z¹ significa halógeno,

con heterociclos de la fórmula (IIIa), (IIIb) o (IIIc)

10



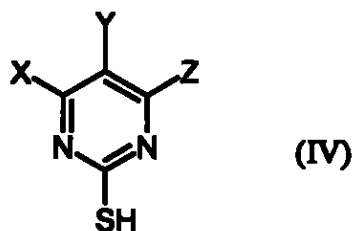
en las que

15 X², Y² y Z² significan un agrupamiento heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico con hasta 10 átomos, inclusive, de carbono y con hasta 5 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además un agrupamiento oxo (C=O), un agrupamiento tioxo (C=S), un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂-, y que contiene, en caso dado, hasta 4 substituyentes, inclusive, de la

20 siguiente enumeración:

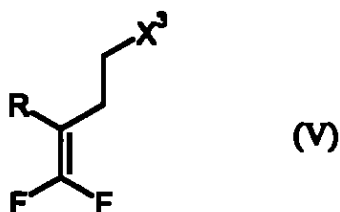
nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí;
 halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alquiltio,
 alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino,
 alquilaminocarbonilo, alcóxicarbonilamino, alquilsulfonilamino,
 5 dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con,
 respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquilo
 substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por halógeno o por
 alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono; alquenilo, alqueniloxi,
 alquenilóxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquinilóxicarbonilo con,
 10 respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono en los grupos alquenilo o
 alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno;
 cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3
 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y,
 en caso dado, 1 hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, fenilo,
 15 bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos
 respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por
 carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4
 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por
 alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos
 20 de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por
 halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo con
 1 a 4 átomos de carbono, por alquilendioxi con 1 a 4 átomos de carbono o
 por haloalquilendioxi con 1 a 2 átomos de carbono,
 en caso dado, en presencia de uno o varios agentes auxiliares de la reacción y, en
 25 caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,
 o porque

(b) se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (IV),



en la que

5 X, Y y Z tienen los significados indicados en la reivindicación 1, con compuestos de la fórmula (V),



en la que

10 R tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

X³ significa halógeno,

en caso dado, en presencia de una o varios agentes auxiliares de la reacción y, en caso dado, en presencia de uno o varios diluyentes,

15 y, en caso dado, los compuestos de la fórmula (I), obtenidos según los procedimientos (a) o (b), se transforman, de manera usual, en otros compuestos de la fórmula (I) según la definición anterior.

3.- Compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizados porque

n significa los números 0 o 2,

20 R significa hidrógeno o flúor,

253

X, Y y Z significan independientemente entre si

hidrógeno, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, hidroxí, cianato, tiocianato, halógeno,

5 significan alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

10 significan alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo,

15 significan cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, o

significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono (significando halógeno, respectivamente, de manera preferente flúor o cloro) o por alcoxycarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, o

25 conjuntamente significan un agrupamiento benzo o significan alquilenos o

- alquenileno con, respectivamente, hasta 4 átomos de carbono, inclusive, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o por 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente contiguos) y estando substituido el anillo, formado de este modo, en caso dado, por flúor, por cloro, por bromo o por alquilo con 1 hasta 3 átomos de carbono, y significando al menos uno de los restos X, Y o Z un agrupamiento heterociclilo saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico, con 4, 6, 9 o 10 átomos de carbono y hasta 4 átomos, inclusive, de nitrógeno y/o con un átomo de oxígeno o de azufre, que contiene, en caso dado, además, uno o dos agrupamientos oxo (C=O), un agrupamiento tioxo (C=S), un agrupamiento SO- o un agrupamiento SO₂-, y que contiene, en caso dado, hasta 3 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:
- nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; halógeno; alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquiltio, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, alquilamino, alquilaminocarbonilo, alcoxicarbonilamino, alquilsulfonilamino, dialquilamino, dialquilaminocarbonilo o dialquilaminosulfonilo con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; alquenilo, alqueniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquinilo, alquiniloxi o alquiniloxicarbonilo con, respectivamente, 2 hasta 5 átomos de carbono en los grupos alquenilo o alquinilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por halógeno; cicloalquilo, cicloalquenilo o cicloalquilalquilo con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo o cicloalquenilo y, en caso dado, 1 hasta 3 átomos de carbono en la parte alquilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro,

- dietilaminosulfonilo, substituidos en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi significan respectivamente, etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo, substituidos en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo, significan ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, o
- 10 significan fenilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmtilo, por diclorometilo, por trifluórmtilo, por triclorometilo, por clorodifluórmtilo, por flúordiclorometilo,
- 15 por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por clorodifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por clorodifluórmtiltio, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, o
- 20 conjuntamente significan trimetileno, tetrametileno, propen-1,3-diilo o butadien-1,4-diilo, pudiendo estar interrumpida la cadena carbonada por 1 hasta 3 átomos de nitrógeno o por 1 hasta 2 átomos de oxígeno (no directamente .contiguos) y el anillo, formado de este modo, está substituido, en caso dado, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por etilo, y significando
- 25 al menos uno de los restos X, Y o Z un agrupamiento heterociclilo, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo,

tetrahidrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indazolilo, tetrahidroindazolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, 2,5-dioxo-1-aza-ciclopentilo, pirazolilo, pirazolinilo, oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, imidazolilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-piridin-1-ilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que están substituidos, en caso dado, con hasta 3 substituyentes, inclusive, elegidos de la siguiente enumeración:

10 nitro; amino; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidróxi; flúor; cloro;
bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo,
n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi,
metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-
butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio,
15 metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o
i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi,
metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino,
metilaminocarbonilo, tilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o
t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, toxicarbonilamino, n- o i-
20 propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino,
etilsulfonilamino, n- o i- propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino,
dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino,
dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o
dietilaminosulfonilo, substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por
25 flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo,
propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo,

buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo, substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, 5 ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmethyl, por diclorometilo, por trifluórmethyl, por triclorometilo, por 10 clorodifluórmethyl, por flúordiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmethyl, por trifluórmethyl, por clorodifluórmethyl, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmethyl, por trifluórmethyl, por clorodifluórmethyl, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, por metilendioxi o por difluórmethylendioxi.

5.- Compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizados porque

n, R, X, Y y Z tienen los significados indicados en la reivindicación 1 como especialmente preferentes, significando Y, preferentemente, hidrógeno, 20 y al menos uno de los restos

X o Z significa un agrupamiento heterociclilo, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo, tetrahydrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indazolilo, tetrahydroindazolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, 2,5-dioxo-1-aza-ciclopentilo, pirazolilo, pirazolinilo, 25 oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, imidazolilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo,

benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, 1,4-dihidro-4-oxo-piridin-1-ilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que contiene, en caso dado, hasta 3 sustituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:

nitro; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; flúor, cloro; bromo; yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-buti-roilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n- o i-propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo substituídos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo substituídos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo; ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo,

ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmtilo, por diclorometilo, por trifluórmtilo, por triclorometilo, por clorodifluórmtilo, por flúordiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmtoxi, por trifluórmtoxi, por clorodifluórmtoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-butiltio, por difluórmtiltio, por trifluórmtiltio, por clorodifluórmtiltio, por metoxicarbonilo, por etoxicarbonilo, por n- o i-propoxicarbonilo, por n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, por metilendioxi o por difluórmtilendioxi, y significando, en caso dado, el resto remanente, X o Z, hidrógeno.

6.- Compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizados porque

n, R, X y Z tiene los significados indicados en la reivindicación 1 como especialmente preferentes, significando X y Z, preferentemente, hidrógeno, e

Y significa un agrupamiento heterocíclico, saturado o insaturado, monocíclico o bicíclico de la serie formada por furilo, benzofurilo, tetrahidrofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, oxopirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, oxopirazolinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclopentilo, triazolilo, benzotriazolilo, oxotriazolinilo, tetrazolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, oxadiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, piperidinilo, oxopiperidinilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, 2-oxo-1,3-diazaciclohexilo, morfolinilo, que contiene, en caso dado, hasta 3 substituyentes, inclusive, de la siguiente enumeración:
nitro; ciano; carboxi; carbamoilo; tiocarbamoilo; hidroxí; flúor; cloro; bromo;

- yodo; metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, acetilo, propionilo, n- o i-butiroilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilo, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o i-propilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o i-propilsulfonilo, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, n- o i-propilsulfoniloxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n- o i-propilaminocarbonilo, n-, i-, s- o t-butilaminocarbonilo, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, n- o i-propoxicarbonilamino, n-, i-, s- o t-butoxicarbonilamino, metilsulfonilamino, etilsulfonilamino, n- o i-propilsulfonilamino, n-, i-, s- o t-butilsulfonilamino, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, dimetilaminosulfonilo o dietilaminosulfonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi; etenilo, propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniloxicarbonilo, buteniloxicarbonilo, etinilo, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniloxicarbonilo o butiniloxicarbonilo substituidos respectivamente, en caso dado, por flúor, por cloro o por bromo; ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, fenoxi, feniltio, piridilo, furilo o tienilo, que están substituidos respectivamente, en caso dado, por nitro, por ciano, por carboxi, por carbamoilo, por tiocarbamoilo, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo, por etilo, por n- o i-propilo, por n-, i-, s- o t-butilo, por difluórmétilo, por diclorometilo, por trifluórmétilo, por triclorometilo, por clorodifluórmétilo, por fluordiclorometilo, por metoxi, por etoxi, por n- o i-

propoxi, por n-, i-, s- o t-butoxi, por difluórmoxi, por trifluórmoxi, por
clorodifluórmoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por n-, i-, s- o t-
butiltio, por difluórmethyltio, por trifluórmethyltio, por clorodifluórmethyltio, por
metoxycarbonilo, por etoxycarbonilo, por n- o i-propoxycarbonilo, por n-, i-, s- o t-
5 butoxycarbonilo.

7.- Agentes para la lucha contra las pestes, caracterizados porque tienen un
contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I), según la reivindicación 1.

8.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, para la
lucha contra las pestes.

10 9.- Procedimiento para la lucha contra las pestes, caracterizado porque se dejan
actuar compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1 o agentes según la
reivindicación 7, sobre las pestes y/o sobre su medio ambiente.

10.- Procedimiento para la obtención de agentes para la lucha contra las pestes,
caracterizado porque se mezclan compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1,
15 con agentes extendedores y/o con agentes tensioactivos.



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
www.royaltechnologies.com

263

Expediente No		No de Folios
05022466		
Item	No de unidades	
1	CD	
2	DVD	
3	REVISTA	
4	LIBRO	
5	PERIODICO	
6	DISQUETES	
7	SOBRE DE MANILA	
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	
10	OTROS:	

Observaciones: Arte final

26X
✓

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radicacion : 05022466 00000000 Folios: 264
Fecha (AMD): 2005-03-18 17:40:18
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 5 - 16,943
FECHA : MARZO 7 DE 2005

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	41376754	07/03/2005	25,165,000.00

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 ASUNTO No.

0010 13549-841-027-7

265

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

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

Firma Responsable: 

Fecha:

766

2020
Bogotá DC

Folio _____

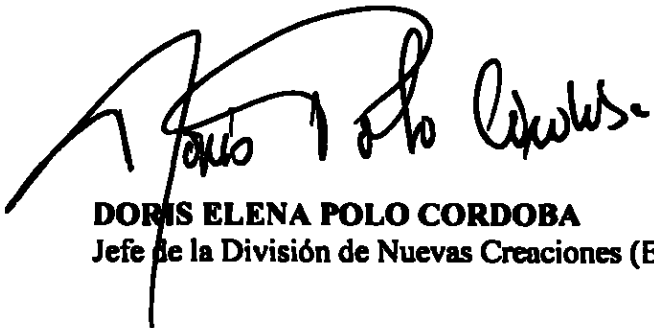
Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado
BAYER CROPSCIENCE AG

REFERENCIA:	Radicación No.	05-22466
	Solicitud Internacional	PCT/EP2003/008881
	Fecha límite inicio fase nacional	23-03-2005
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	488
	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

12 de mayo 2005



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