



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

05-52702

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO Composiciones de materia Ploguicidas.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C 07 D 231/44
A01N 43/76

71. SOLICITANTE Bayer CropScience S.A.

DOMICILIO Lyon, Francia

74. APODERADO Gustavo Hollmann Restrepo

22. BOGOTÁ, D. C., 31 de mayo de 2005

FORMULARIO ÚNICO 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 CROPSOURCE S.A.**

Dirección: **55, avenue René Cassin,
F-69009 Lyon, Francia**

Nacionalidad o Domicilio: **Lyon, Francia**
Lugar de Constitución: **Francia**

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual _____

Número _____

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO**

Dirección **Cra. 11ª No. 94-76 - Of. 308**

Teléfono: **6161948**

Fax: **6163976**

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☒

Cual _____

Número **2.878 023 TP 5903**

④

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: **DÖLLER Uwe**

Dirección **Christian-Morgenstern-Strasse 11,**

Nacionalidad o Domicilio: **63110 Rodgau, Alemania**

⑤ **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. **PCT/EP2003/012620** Fecha **Noviembre 12 de 2003**

Publicación Internacional No. **WO 2004/050633 A1** Fecha **Junio 17 de 2004**

⑥ **Título (54)** **COMPOSICIONES DE MATERIA PLAGUICIDAS.**

⑦ **Clasificación Internacional (51)** **C07D 231/44 A 01 N 93/56**

⑧ **PRIORIDAD:**

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

Europa

(32) Fecha

Diciembre 3, 2002

(31) Número de Solicitud

02027064.1

⑨

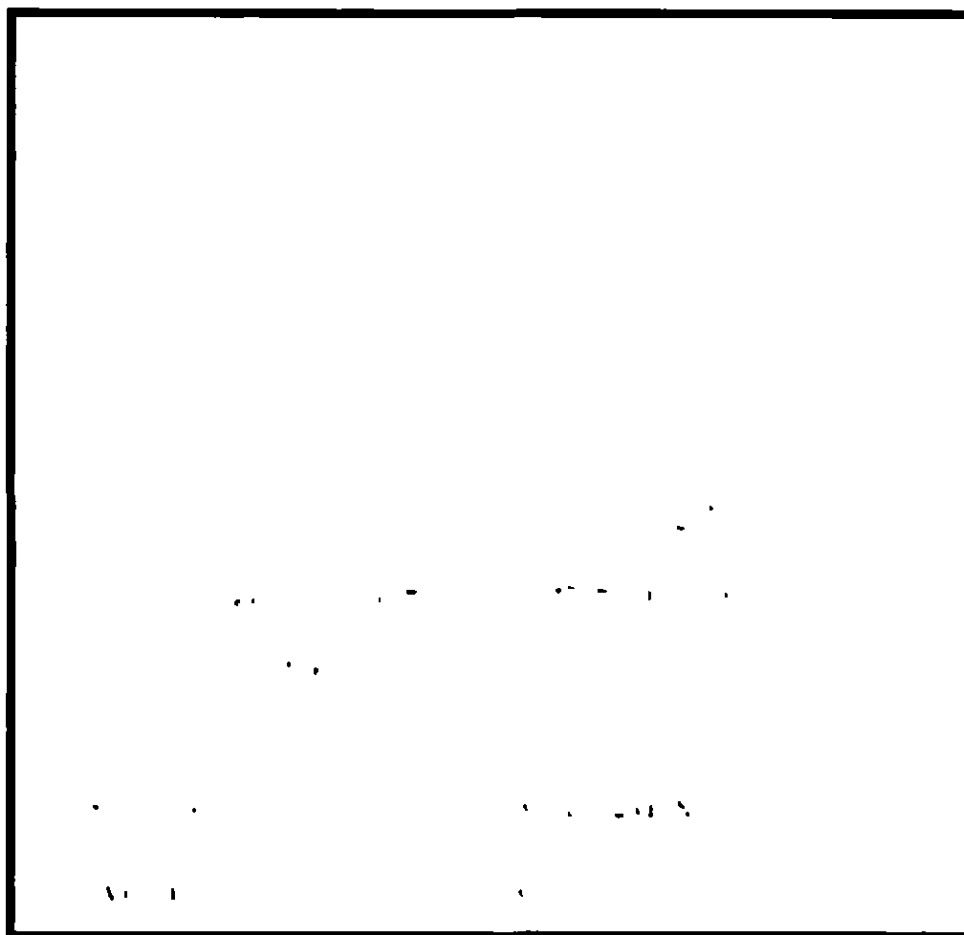
Comprobante de pago No. **05 - 38,469**

Fecha **Mayo 25 de 2005**

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

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

(11) FIGURA CARACTERISTICA



(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

FIRMA:

[Handwritten signature]

C.C. 2.878.023 Bogotá T.P. 5903

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

Continuación nombre, dirección y domicilio de inventores:

<u>Nombre</u>	<u>Dirección</u>	<u>Domicilio</u>
HÖBALD Klaus Dieter	Kolwitzweg 29,	Mörfelden-Waldorf, Alemania
MAIER Michael	Neu Zeilsheim 78,	65931 Frankfurt, Alemania
KUHLMANN Anke	Bern 12,	42799 Leichlingen, Alemania
SEEGER Karl	Schwalbenweg 9,	65719 Holheim, Ts., Alemania

Otros anexos que se acompañan a la solicitud.

Copia formulario PCT/RO/101 correspondiente a la presentación de la solicitud internacional.

Copia formulario PCT/IB/306 correspondiente a la notificación de un cambio

Copia formulario PCT/IB/318 relativa a la notificación de corrección de la prioridad.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 05052702 00000000

Folios: 148

Fecha (AND): 2005-05-31 16:24:53

Tramite : 011 PCT-PATENT 373 FASE NACI 411 PRESENTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 38,469
FECHA : MAYO 25 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
GUSTAVO HOLLMAN	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	37350747	23/05/2005	1,515,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

GENERAL POWER OF ATTORNEY
G. HOLLMANN RESTREPO
ABOGADOS LTDA

G. HOLLMANN RESTREPO
ABOGADOS LTDA

The undersigned Dr. Rudolf Weißert, acting on behalf of and representing of Bayer CropScience S.A. domiciled in, 55, avenue René Cassin, F-69009 Lyon, Francia, hereby appoint(s) GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO and/or LUIS PATIÑO LEYVA, domiciled in Bogotá D.C., Republic of Colombia, as our true and legal attorney with the necessary powers:

1) To apply to the administrative, judicial and police authorities of the Republic of Colombia, in any instance or appeal, for obtaining registration of patents, utility models, industrial designs and models, commercial ensigns and names, trademarks, slogans, health licenses, copyrights and domain names as well as their assignments, extensions, renewals and changes of name; 2) To prepare, apply for, obtain, execute and register contracts, licenses, authorizations and registrations of any kind; 3) To intervene as plaintiff or defendant, in any instance or appeal, before any judge, court, tribunal, corporation, public officer or authority in any judicial, administrative or police action, such as: action dealing with commercial ensigns and names; oppositions against trademark registrations; caducity and nullity actions, recovery actions, actions arising from obtainment and working of license agreements; actions dealing with unfair competition; criminal actions; actions claiming indemnity for damages, complaints or remarks on all sort of industrial property matters; the performance of precautionary measures, and in any other similar action, measure or appeal related to intellectual property matters.

To this effect, I (we) hereby authorize him to file applications, make descriptions, protests, amendments, declarations, oppositions, cancellations, appeals and claims; to pay taxes, quotas and liens as provided by Law; to waive or abandon granted rights or rights in process of being granted, to receive all kind of documents and securities; to issue the respective releases and, in general, to take, before said authorities, pertinent steps to the above mentioned purposes and take all measures they may deem advisable to protect my (our) interests, with all other necessary legal faculties, and I (we) hereby declare as good and valid whatever the attorneys should do to my (our) benefit.

This power comprises the authority to ratify or confirm on my (our) behalf any action, as well as the faculty of receiving, desisting, transacting, compromising, substituting and revoking substitutions, taking notifications, and appointing judicial or extra-judicial attorneys.

Signed in Frankfurt on this 01st day of April 2003

Bayer CropScience S.A.

W. Weißert
Dr. Rudolf Weißert
Authorized Signatory

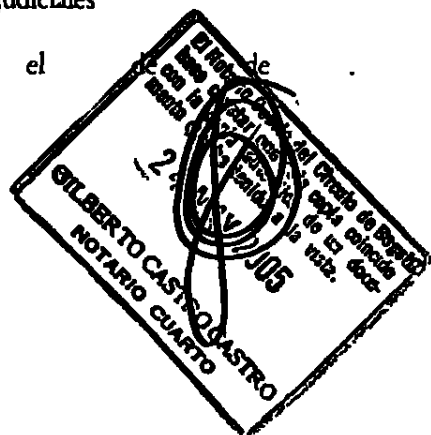
Yo (nosotros), obrando en nombre propio y representación de Bayer CropScience S.A. con domicilio en, 55, avenue René Cassin, F-69009 Lyon, Francia, nombro(amos) a GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO y/o LUIS PATIÑO LEYVA, con domicilio en Bogotá D.C., República de Colombia, Cra 11ª No 94-76, Oficina 308, apoderado verdadero y legal, con poder especial, amplio y suficiente:

1) Para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, dibujos y modelos industriales, registro de marcas, registro de lemas comerciales, depósito de nombres y enseñas comerciales, registros sanitarios, derechos de autor y nombres de dominio así como sus traspasos, prórrogas, renovaciones y cambios de nombre, 2) Elaborar, tramitar, solicitar, obtener, realizar, ejecutar y registrar contratos, licencias, autorizaciones y registros de cualesquiera clases; 3) Intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso y ante cualquier juez, entidad, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía, tales como acciones derivadas de nombre o enseña comerciales, acciones reivindicatorias; acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias, acciones de competencia desleal, demandas penales y civiles, acciones de indemnización de perjuicios, reclamos, u observaciones a cualquier asunto sobre propiedad intelectual; al ejercicio de medidas cautelares y cualesquiera otras acciones, medidas o recursos similares relacionados con la propiedad intelectual.

A este efecto, lo facultamos para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, apelaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la Ley, renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores dando al descargo respectivo, y en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeren conducentes al resguardo de mis (nuestros) intereses, con todas las facultades necesarias, y por este documento desde ahora declaro(amos) válido y bueno todo cuanto los apoderados hicieren en mi (nuestro) beneficio.

Este poder comprende la facultad de ratificar, o confirmar en mi (nuestro) nombre lo actuado, así como la facultad de recibir, desistir, transigir, comprometer, sustituir y revocar sustituciones, recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

Firmado en el



CERTIFICATION
COMPANIES

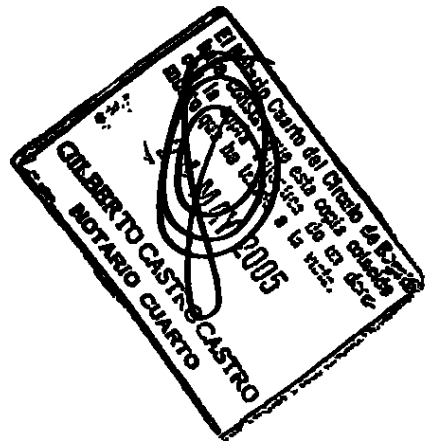
The undersigned _____ certifies that the preceding signature(s) reading _____ is (are) authentic; that the signer(s) at present fill(s) the position of _____ of _____; that he (they) is (are) empowered to grant this power; and that said company exists, accomplishes its social object and is organized in _____ in accordance with the Laws of _____ All the foregoing facts are known to me due to my having examined the respective documents to which I attest

Signed in _____ of _____ on this _____ day of _____

CERTIFICACIÓN
SOCIEDADES

El(la) infrascrito(a) _____ certifica que la(s) firma(s) que antecede(n) y dice(n) _____ es (son) auténtica(s); que el (los) signatario(s) desempeña(n) actualmente el cargo(s) de _____ de _____; que tiene(n) facultad para otorgar este poder, y que dicha compañía existe, cumple su objeto social y está organizada en _____ conforme a las Leyes de _____ Todos los hechos anteriores le constan, por haber examinado los documentos respectivos y de todo ello da fe

Firmado en _____ el _____ de _____ de _____



Armin Knipfer, Notario (firma)

Nummer 127 der Urkundenrolle für das Jahr 2003

Die vorstehende vor mir anerkannte Unterschrift von

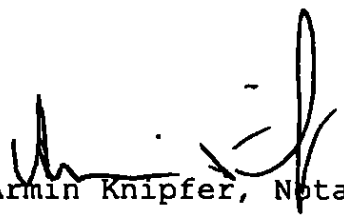
Herrn Dr. Rudolph Weißert
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung
65926 Frankfurt/M.
-von Person bekannt-

glaubige ich hiermit amtlich.

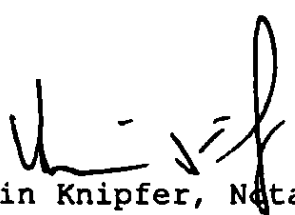
In meiner Eigenschaft als Notar bestätige ich die Unterschriftsberechtigung des Herrn Dr. Weißert für die Bayer CropScience SA, 69009 Lyon, Frankreich erteilt am 04.09.2002 durch die Firma Bayer CropScience SA, 69009 Lyon, Frankreich.

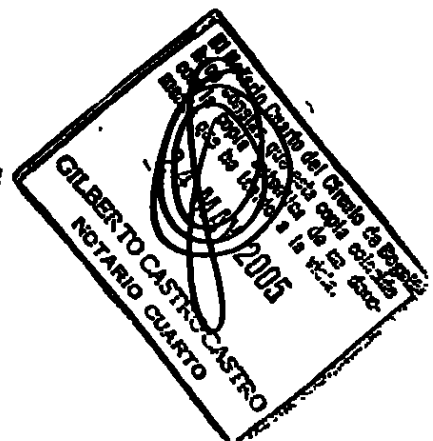
Frankfurt/M. Höchst

11. April 2003


Armin Knipfer, Notar

Kostenrechnung-Wert:	€	5.000,00
Geb. \$ 45 I KostO	€	5,50
Geb. \$ 150 KostO	€	1,00
16 % Mehrwertsteuer	€	3,76
	€	27,76
=====		


Armin Knipfer, Notar



Traducción
gastos y l-
...

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1 Land Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2 ist unterschrieben von

Kuiper

3. in seiner Eigenschaft als

amtlich bestellter Notar

4 sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des(der)Notars

Bestätigt

7. April 2003

5 in Frankfurt/Main

6 am

7 durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts

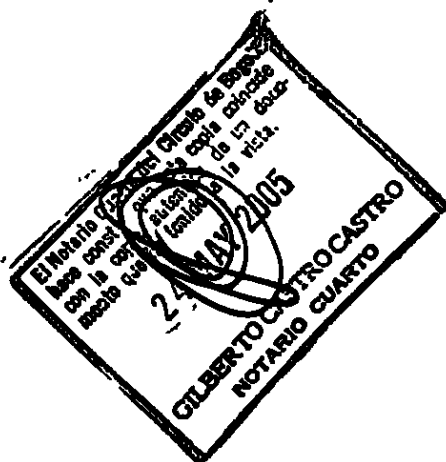
8 unter Nr. 91 Ea A

2174

9. Siegel/Stempel

10. Unterschrift

Schillz



Traducción Oficial del Alemán de la certificación, la nota de gastos y la apostilla adjuntas al poder general que la compañía Bayer CropScience S.A., domiciliada en Lyon, Francia, otorga a Gustavo Hollmann Restrepo y/o Luis Patiño Leyva.

Registro Notarial Número 127 para el año 2003

Mediante este documento autentico oficialmente la firma que aparece anteriormente, la cual fue ejecutada en mi presencia por el

Señor Dr. Rudolph Weißert

domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH

Depto. de Patentes y Licencias

65926 Frankfurt/Main

quien es conocido personalmente por el suscrito Notario.

Al mismo tiempo, en mi calidad de Notario Público, certifico que el Señor Dr. Weißert se encuentra autorizado para firmar en representación de la compañía Bayer CropScience S.A. domiciliada en 69009 Lyon, Francia, según consta en la autorización fechada el 04.09.2002 expedida por la compañía Bayer CropScience S.A. domiciliada en 69009 Lyon, Francia.

Frankfurt/Main-Höchst, 1° de Abril del 2003

Armin Knipfer, Notario en Frankfurt am Main

(Firma y Sello Oficial)

Nota de gastos:

Valor del negocio: 5.000,00 EUROS

Impuesto Artículo 45I Disp. Impuestos

10,50 EUROS

Impuesto Artículo 150 Disp. Impuestos

13,00 EUROS

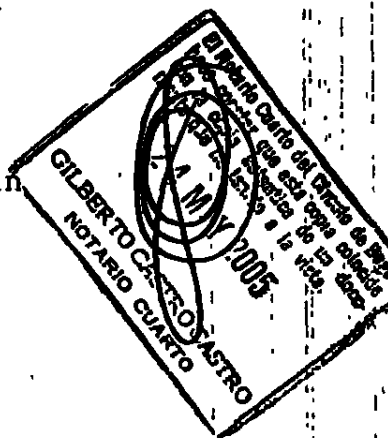
I.V.A. 16%

3,76 EUROS

Total:

27,26 EUROS

Armin Knipfer, Notario (firma)



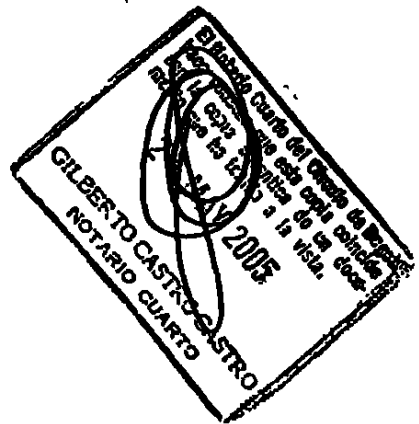
APOSTILLA

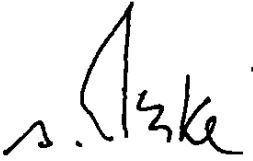
(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por: Knipfer
3. En su calidad de: Notario nombrado oficialmente
4. Y lleva el sello: Del mencionado Notario

Confirmado

5. En: Frankfurt/Main
6. El día: 7 de Abril del 2003
7. Por: El Señor Presidente del Tribunal Regional
8. Bajo el No.: 91 Ea A 2174
9. Sello: EL PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN
FRANKFURT AM MAIN
10. Firma: En representación, Schlitz




ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

meit martinez

U 22529

CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO PRESENTE
LAS FIRMAS DE LOS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 APR 25 P 12:57

PD
JEFE DE DELEGACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



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

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
17 June 2004 (17.06.2004)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2004/050633 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07D 231/44,
A01N 43/56, C07D 401/12, 403/12 409/12 405/12,
417/12

12, 42799 Leichlingen (DE) SEEGER, Karl [DE/DE],
Schwalbenweg 9, 65719 Holheim, Ts (DE)

(21) International Application Number:
PCT/EP2003/012620

(74) Agent: RIPPER, Hans, Christoph Bayer CropScience
GmbH, Patent- und Lizenzabteilung, Industriepark Höchst,
Gebäude K 607, 65926 Frankfurt (DE)

(22) International Filing Date:
12 November 2003 (12 11 2003)

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AU, AZ,
BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ, EC,
EG, GD, GE, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NI, NO,
NZ, OM, PG, PH, PL, RU, SC, SG, SY, TJ, TM, TN, TT,
UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
02027064 1 3 December 2002 (03 12 2002) EP

(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE,
SI, SK, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

(71) Applicant (*for all designated States except US*): BAYER
CROPSCIENCE S.A. [FR/FR], 55, avenue René Cassin,
F-69009 Lyon (FR).

(72) Inventors; and

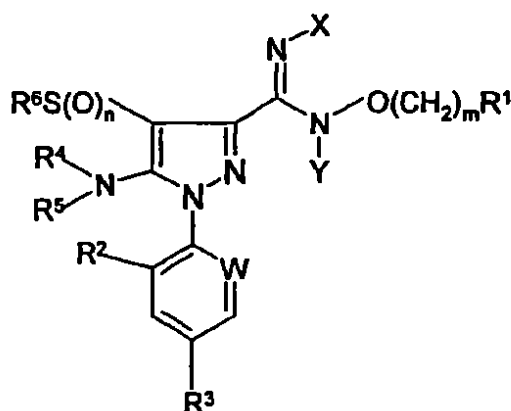
(75) Inventors/Applicants (*for US only*): DÖLLER, Uwe
[DE/DE], Christian-Morgenstern-Strasse 11, 63110
Rodgau (DE) HÖBALD, Klaus, Dieter [DE/DE], Kol-
witzweg 29, 64546 Morfelden-Waldorf (DE) MAIER,
Michael [DE/DE], Neu Zeilsheim 78, 65931 Frankfurt
am Main (DE) KUHLMANN, Anke [DE/DE], Bern

Published:

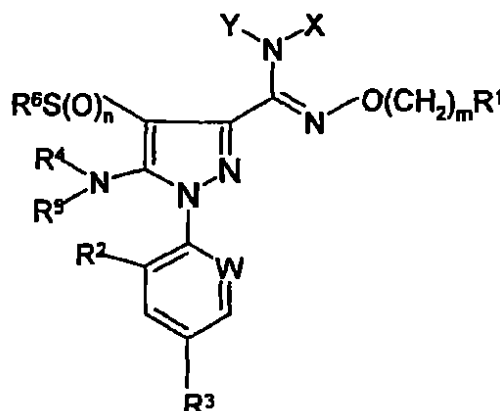
— with international search report

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

(54) Title: PESTICIDAL 1-ARYL-3-AMIDOXIME-PYRAZOLE DERIVATIVES



(1a)



(1b)

(57) Abstract: 1-Arylpyrazole-3-substituted-amidoxime derivatives of formula (1a) or (1b), or salts thereof (1a) (1b) wherein the various symbols are as defined in the description and pesticidal compositions thereof, processes for their preparation, and their use for the control of arthropods (including insects and arachnids) and helminths (including nematodes)

WO 2004/050633 A1

Description

PESTICIDAL 1-ARYL-3-AMIDOXIME-PYRAZOLE DERIVATIVES

The invention relates to 1-arylpyrazole-3-substituted-amidoxime derivatives, processes for their preparation, to compositions thereof, and to their use for the control of pests, such as harmful arthropods (including insects and arachnids) and helminths (including nematodes).

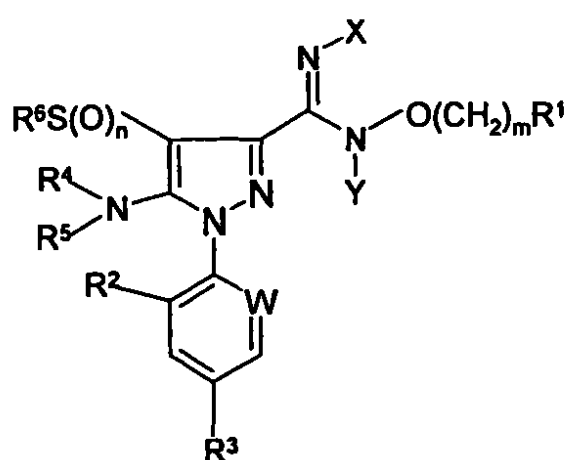
The control of insects, arachnids or helminths with 1-arylpyrazole compounds has been described in, for example, patent publication numbers WO 93/06089, WO 94/21606, WO 87/03781, EP 0295117, EP 659745, EP 679650, EP 201852 and U.S. 5,232,940. The control of parasites in animals with 1-arylpyrazole compounds has also been described in patent publication numbers WO 00/35884, EP 0846686, WO 98/24769 and WO 97/28126.

In particular WO 98/28278 and WO 97/28126 describe certain 1-arylpyrazole-3-substituted-amidoxime derivatives as well as other related compounds, however benzyl substituted and heterocyclic substituted amidoxime compounds are not specifically mentioned therein, nor is it suggested that they might also be useful as pesticides.

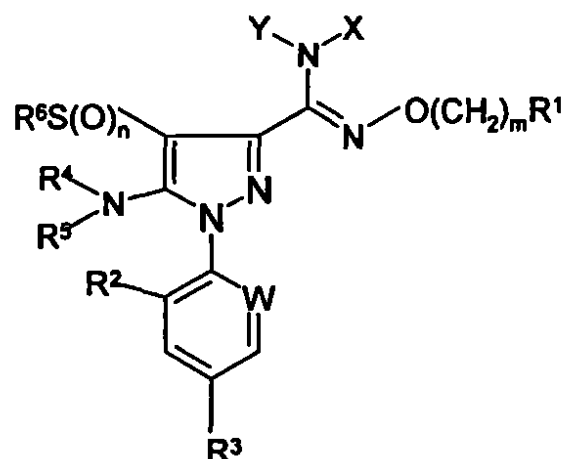
However, the level of action and/or duration of action of these prior-art compounds is not entirely satisfactory in all fields of application, in particular against certain organisms or when low concentrations are applied.

Since modern pesticides must meet a wide range of demands, for example regarding level, duration and spectrum of action, use spectrum, toxicity, combination with other active substances, combination with formulation auxiliaries or synthesis, and since the occurrence of resistances is possible, the development of such substances can never be regarded as concluded, and there is constantly a high demand for novel compounds which are advantageous over the known compounds, at least as far as some aspects are concerned.

The present invention provides a compound which is a 1-arylpyrazole-3-substituted-amidoxime derivative of formula (Ia) or (Ib):



(Ia)



(Ib)

wherein:

R^1 is aryl unsubstituted or substituted by one or more R^{15} radicals; or is R^{10} or R^{19} ;
 X and Y are each independently H, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-haloalkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-haloalkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, CONR⁷R⁸, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸, SO₂R¹³ or COR¹⁷; or (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more R^{11} radicals;

W is N, C-CH₃ or C-halogen;

R^2 is hydrogen, CH₃ or halogen;

R^3 is halo, (C₁-C₃)-alkyl, (C₁-C₃)-haloalkyl, (C₁-C₃)-haloalkoxy, S(O)_p-(C₁-C₃)-haloalkyl or SF₅;

R^4 is H, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-haloalkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-haloalkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, -CO₂-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₃-C₆)-alkenyl, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸ or COCH₂O-(C₁-C₄)-alkyl; or (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more R^{11} radicals;

R^5 is H, (C₂-C₆)-alkynyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl or -SO₂R¹²; or (C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl or CO-(C₁-C₆)-alkyl which last three mentioned groups are unsubstituted or substituted by one or more R^{11} radicals;

R^6 and R^{13} are each independently (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-haloalkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, (C₂-C₆)-haloalkynyl or (C₃-C₇)-cycloalkyl;

R^7 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³ and NR⁹R¹⁴;

R^8 is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -(CH₂)_qR⁷ or -(CH₂)_qR¹⁰;

R^9 and R^{14} are each independently H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl or -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl; or

R^8 and R^9 together with the attached N atom form a five- or six-membered saturated ring which optionally contains an additional hetero atom in the ring which is selected from O, S and N, the ring being unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl and halogen;

R^{10} is heterocyclyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, S(O)_pR¹³, OH and oxo;

R^{11} is halogen, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₇)-cycloalkyl, S(O)_pR¹³, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, -O(C=O)-(C₁-C₆)-alkyl, CO-(C₁-C₆)-alkyl, CO-(C₁-C₆)-haloalkyl, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³ or OR¹⁰;

R^{12} is (C₃-C₇)-cycloalkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-haloalkenyl or R¹⁰; or phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from R¹⁵; or is (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₆)-alkenyloxy, (C₃-C₆)-haloalkenyloxy, (C₃-C₆)-alkynyloxy, (C₃-C₆)-haloalkynyloxy, (C₃-C₇)-cycloalkyl, S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹³, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹⁶, R¹⁰ and CO₂R⁸;

R^{15} is halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, R⁷, SF₅, OH, OR⁷, R¹⁸, OR¹⁸, SO₃H or (C₁-C₆)-alkylideneimino;

R^{16} is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, SO₃H and (C₁-C₆)-alkylideneimino;

R^{17} is (C_1-C_6) -alkyl which is substituted by (C_1-C_6) -alkoxy, $S(O)_p$ -(C_1-C_6)-alkyl or $S(O)_p$ -(C_1-C_6)-haloalkyl;

R^{18} is a heteroaromatic radical selected from the group consisting of pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, thienyl, thiazolyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl and triazolyl, which groups are unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl and (C_1-C_6) -alkoxy;

R^{19} is a heteroaromatic radical selected from the group consisting of pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, thienyl, thiazolyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl and triazolyl, which is unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl and (C_1-C_6) -alkoxy, and which heteroaromatic radical is substituted by R^7 , R^{18} or OR^7 ;

m is 1 or 2;

n and p are each independently zero, one or two;

q is zero or one; and

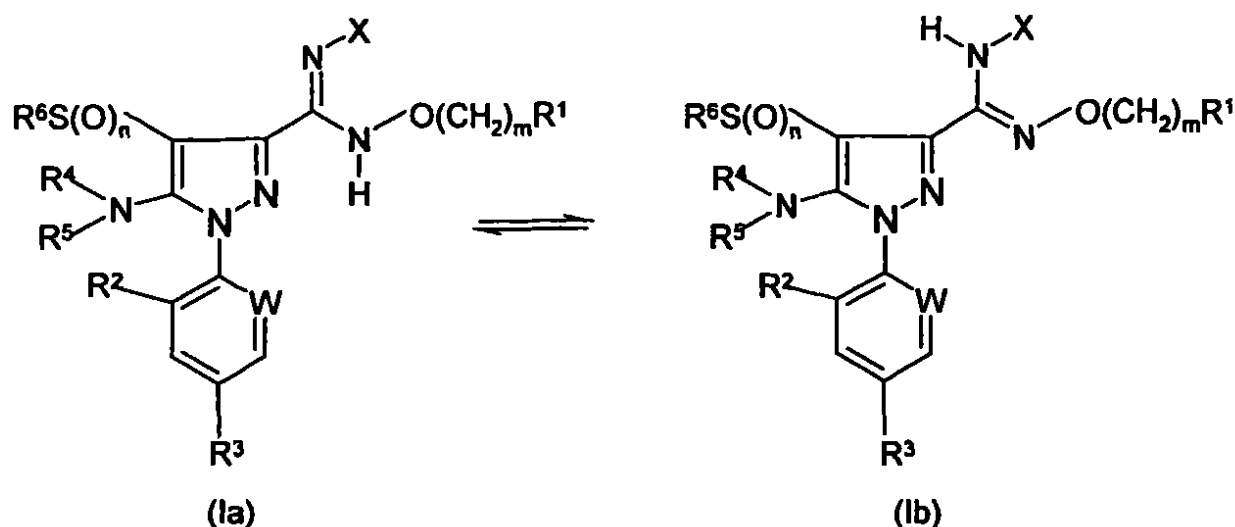
each heterocyclyl in the above-mentioned radicals is independently a heterocyclic radical having 3 to 6 ring atoms and 1, 2 or 3 hetero atoms in the ring selected from the group consisting of N, O and S;

or a pesticidally acceptable salt thereof.

These compounds possess valuable pesticidal properties.

The invention also encompasses any stereoisomer, enantiomer or geometric isomer, and mixtures thereof

Compounds of formula (Ia) and (Ib) wherein Y is H may exist in tautomeric forms as shown below:



Such tautomerism is well known and is described in S.Patai (The Chemistry of Functional Groups: Amidines and Imidates, Vol 2, 1991, pages 276-277). It will be understood that all such tautomeric forms are embraced by the present invention. By the term "pesticidally acceptable salts" is meant salts the anions or cations of which are known and accepted in the art for the formation of salts for pesticidal use. Suitable salts with bases, e.g. formed by compounds of formula (I) containing a carboxylic acid group, include alkali metal (e.g. sodium and potassium), alkaline earth metal (e.g. calcium and magnesium), ammonium and amine (e.g. diethanolamine, triethanolamine, octylamine, morpholine and dioctylmethylamine) salts. Suitable acid addition salts, e.g. formed by compounds of formula (I) containing an amino group, include salts with inorganic acids, for example hydrochlorides, sulphates, phosphates and nitrates and salts with organic acids for example acetic acid.

It is to be understood that the above mentioned provisos are included only for reasons of chemical instability for the particular excluded moieties, and not for reasons of prior art.

In the present patent specification, including the accompanying claims, the aforementioned substituents have the following meanings:

Halogen atom means fluorine, chlorine, bromine or iodine.

The term "halo" before the name of a radical means that this radical is partially or completely halogenated, that is to say, substituted by F, Cl, Br, or I, in any combination, preferably by F or Cl.

Alkyl groups and portions thereof (unless otherwise defined) may be straight- or branched-chain.

The expression "(C₁-C₆)-alkyl" is to be understood as meaning an unbranched or branched hydrocarbon radical having 1, 2, 3, 4, 5 or 6 carbon atoms, such as, for example a methyl, ethyl, propyl, isopropyl, 1-butyl, 2-butyl, 2-methylpropyl or tert-butyl radical.

Alkyl radicals and also in composite groups, unless otherwise defined, preferably have 1 to 4 carbon atoms.

"(C₁-C₆)Haloalkyl" means an alkyl group mentioned under the expression "(C₁-C₆)alkyl" in which one or more hydrogen atoms are replaced by the same number of identical or different halogen atoms, such as monohaloalkyl, perhaloalkyl, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ or CH₂CH₂Cl.

The expression "(C₁-C₁₂)-alkylene" is to be understood as meaning an unbranched or branched saturated carbon chain having from 1 to 12 carbon atoms.

The expression "(C₁-C₁₂)-haloalkylene" is to be understood as meaning an unbranched or branched saturated carbon chain having from 1 to 12 carbon atoms, in which one or more hydrogen atoms are replaced by the same number of identical or different halogen atoms.

The expression "(C₂-C₁₂)-alkenylene" is to be understood as meaning an unbranched or branched saturated carbon chain having from 2 to 12 carbon atoms, and which contains at least one double bond which can be located in any position of the respective unsaturated radical.

"(C₁-C₆)Alkoxy" means an alkoxy group whose carbon chain has the meaning given under the expression "(C₁-C₆)alkyl". "Haloalkoxy" is, for example, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ or OCH₂CH₂Cl.

"(C₂-C₆)Alkenyl" means an unbranched or branched non-cyclic carbon chain having a number of carbon atoms which corresponds to this stated range and which contains at least one double bond which can be located in any position of the

respective unsaturated radical. "(C₂-C₆)Alkenyl" accordingly denotes, for example, the vinyl, allyl, 2-methyl-2-propenyl, 2-butenyl, pentenyl, 2-methylpentenyl or the hexenyl group.

"(C₂-C₆)Alkynyl" means an unbranched or branched non-cyclic carbon chain having a number of carbon atoms which corresponds to this stated range and which contains one triple bond which can be located in any position of the respective unsaturated radical. "(C₂-C₆)Alkynyl" accordingly denotes, for example, the propargyl, 1-methyl-2-propynyl, 2-butyne or 3-butyne group.

Cycloalkyl groups preferably have from three to seven carbon atoms in the ring and are optionally substituted by halogen or alkyl.

In compounds of formula (I) the following examples of radicals are provided:

An example of alkyl substituted by cycloalkyl is cyclopropylmethyl;

an example of alkyl substituted by alkoxy is methoxymethyl (CH₃OCH₂-); and

an example of alkyl substituted by alkylthio is methylthiomethyl (CH₃SCH₂-).

Aryl is a mono- or bicyclic aromatic system, for example phenyl, naphthyl, tetrahydronaphthyl, indenyl, indanyl and the like, preferably phenyl.

A "heterocyclyl" group can be saturated, unsaturated or heteroaromatic; it preferably contains one or more, in particular 1, 2 or 3, hetero atoms in the heterocyclic ring, preferably selected from the group consisting of N, O and S; it is preferably an aliphatic heterocyclyl radical having 3 to 7 ring atoms or a heteroaromatic radical having 5 or 6 ring atoms. The heterocyclic radical can be, for example, a heteroaromatic radical or ring (heteroaryl) such as, for example, a mono-, bi- or polycyclic aromatic system in which at least 1 ring contains one or more hetero atoms, for example pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, thienyl, thiazolyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl and triazolyl, or it is a partially or fully hydrogenated radical such as oxiranyl, oxetanyl, oxolanyl (= tetrahydrofuryl), oxanyl, pyrrolidyl, piperidyl, piperazinyl, dioxolanyl, oxazolinyl, isoxazolinyl, oxazolidinyl, isoxazolidinyl and morpholinyl. The "heterocyclyl" group may be unsubstituted or substituted by one or radicals (preferably 1, 2 or 3 radicals) selected from the group consisting of halogen, alkoxy, haloalkoxy, alkylthio, hydroxyl, amino, nitro, carboxyl, cyano, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyl, formyl, carbamoyl, mono- and dialkylaminocarbonyl, substituted amino

such as acylamino, mono- and dialkylamino, and alkylsulfinyl, haloalkylsulfinyl, alkylsulfonyl, haloalkylsulfonyl, alkyl and haloalkyl, and additionally also oxo. The oxo group can also be present at those hetero ring atoms where various oxidation numbers are possible, for example in the case of N and S.

The term pests means arthropod pests (including insects and arachnids), and helminths (including nematodes).

Compounds of formula (Ib) are preferred.

Preferably R^1 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl, (C_1-C_6) -alkoxy, (C_1-C_6) -haloalkoxy, CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} and $CONR^8R^9$; (more preferably R^1 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_3) -alkyl, (C_1-C_3) -haloalkyl, (C_1-C_3) -alkoxy, (C_1-C_3) -haloalkoxy, CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ and NR^8R^9); and in which preferably R^8 and R^9 are each independently H or (C_1-C_6) -alkyl, or R^8 and R^9 together with the attached N atom form a five- or six-membered saturated ring which optionally contains an additional hetero atom in the ring which is selected from O, S and N, the ring being unsubstituted or substituted by one or more (C_1-C_3) -alkyl radicals; and R^{13} is (C_1-C_3) -alkyl or (C_1-C_3) -haloalkyl.

Preferably X and Y are each independently H, (C_1-C_6) -alkyl or $CO(C_1-C_6)$ -alkyl.

Preferably W is C-Cl.

Preferably R^2 is Cl.

Preferably R^3 is CF_3 or OCF_3 (more preferably R^3 is CF_3).

Preferably R^4 is H, (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkynyl, (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-CO_2-(C_1-C_6)$ -alkyl, $-(C_1-C_6)$ -alkyl- (C_3-C_7) -cycloalkyl, $COCH_2O(C_1-C_4)$ -alkyl, $-(C_1-C_6)$ -alkyl- $S(O)_p-(C_1-C_6)$ -alkyl or $-CH_2R^7$, in which R^7 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from halogen, (C_1-C_3) -alkyl, (C_1-C_3) -haloalkyl, (C_1-C_3) -alkoxy, (C_1-C_3) -haloalkoxy, CN, NO_2 and $S(O)_pR^{13}$, and R^{13} is (C_1-C_3) -alkyl or (C_1-C_3) -haloalkyl.

Preferably R^5 is H, (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkynyl, (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-CO_2-(C_1-C_6)$ -alkyl or $-(C_1-C_6)$ -alkyl- (C_3-C_7) -cycloalkyl.

Preferably R^6 is CF_3

Preferably m is 1.

Preferably heterocyclyl in the above-mentioned radicals is independently a heteroaromatic radical having 3 to 6 ring atoms and 1, 2 or 3 hetero atoms in the ring selected from the group consisting of N, O and S, unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_4) -alkyl, (C_1-C_4) -haloalkyl and (C_1-C_4) -alkoxy (more preferably each heterocyclyl in the above-mentioned radicals is independently a heteroaromatic radical having 5 or 6 ring atoms and 1, 2 or 3 hetero atoms in the ring selected from the group consisting of N, O and S, unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_4) -alkyl, (C_1-C_4) -haloalkyl and (C_1-C_4) -alkoxy).

A preferred class of compounds of formula (Ib) are those in which:

R^1 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_6) -alkyl, (C_1-C_6) -haloalkyl, (C_1-C_6) -alkoxy, $S(O)_p$ - (C_1-C_6) -alkyl or $S(O)_p$ - (C_1-C_6) -haloalkyl; or is pyridyl, pyrimidinyl, thienyl, thiazolyl, furyl, tetrahydrofuryl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrahydrothienyl or tetrazolyl which groups are unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C_1-C_3) -alkyl or (C_1-C_3) -haloalkyl;
 X is H, (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkynyl, (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-(C_1-C_4)$ -alkyl- (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-CO_2$ - (C_1-C_6) -alkyl, CO - (C_1-C_6) -alkyl, $-CH_2O$ - (C_1-C_6) -alkyl, $-(C_1-C_6)$ -alkyl- $S(O)_p$ - (C_1-C_6) -alkyl or $-CH_2$ phenyl;

Y is H;

W is C-Cl;

R^2 is Cl;

R^3 and R^6 are each CF_3 ;

R^4 is H, (C_1-C_6) -alkyl, $COCH_2O$ - (C_1-C_4) -alkyl, $-(C_1-C_6)$ -alkyl- $S(O)_p$ - (C_1-C_6) -alkyl or $-CH_2$ phenyl;

R^5 is H, (C_1-C_6) -alkyl, (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -alkynyl, (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-(C_1-C_4)$ -alkyl- (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-CO_2$ - (C_1-C_6) -alkyl, CO - (C_1-C_6) -alkyl, $-CH_2O$ - (C_1-C_6) -alkyl, $-(C_1-C_6)$ -alkyl- $S(O)_p$ - (C_1-C_6) -alkyl, SO_2 - (C_1-C_6) -alkyl, SO_2 - (C_1-C_6) -haloalkyl or SO_2CH_2 phenyl; and

m is 1 or 2.

A preferred class of compounds of formula (Ia) are those in which:

R¹ is phenyl;

Y is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, CO(C₁-C₆)-alkyl, -CH₂O-(C₁-C₆)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl, SO₂(C₁-C₆)-alkyl, SO₂(C₁-C₆)-haloalkyl or SO₂CH₂phenyl;

X is H;

W is C-Cl;

R² is Cl;

R³ and R⁶ are each CF₃;

R⁴ is H, (C₁-C₆)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl or -CH₂phenyl;

R⁵ is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, CO(C₁-C₆)-alkyl, -CH₂O-(C₁-C₆)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl, SO₂(C₁-C₆)-alkyl, SO₂(C₁-C₆)-haloalkyl or SO₂CH₂phenyl; and

m is 1.

A further preferred class of compounds of formula (Ia) are those in which:

R¹ is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl and S(O)_p-(C₁-C₆)-haloalkyl;

X is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, CO(C₁-C₆)-alkyl, CON[(C₁-C₆)-alkyl]₂, -CH₂O-(C₁-C₆)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl or -CH₂phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₃)-alkyl or (C₁-C₃)-alkoxy;

Y is (C₁-C₆)-alkyl;

W is C-Cl;

R² is Cl;

R³ and R⁶ are each CF₃;

11

R^4 is (C₁-C₆)-alkyl or -(C₂-C₄)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₄)-alkyl;

R^5 is H or CH₃; and

m is 1.

A most preferred class of compounds of formula (Ia) or (Ib) are those in which:

R^1 is phenyl;

X and Y are each independently H, methyl or acetyl;

W is C-Cl;

R^2 is Cl,

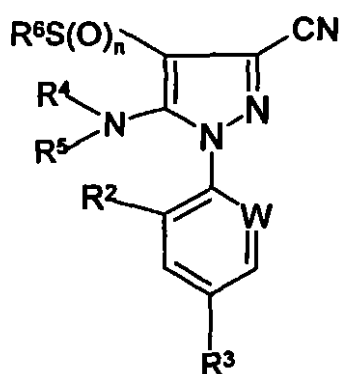
R^3 and R^6 are each CF₃;

R^4 and R^5 are each independently H, methyl, ethyl, allyl, propargyl, cyclopropyl, benzyl, cyclopropylmethyl, methylthioethyl, ethoxyacetyl or ethoxycarbonyl; and
m is 1.

The compounds of general formula (I) can be prepared by the application or adaptation of known methods (i.e. methods heretofore used or described in the chemical literature). It will be understood that in certain cases the use of protecting agents well known in the art may be necessary in order to obtain satisfactory yields. In the following description of processes when symbols appearing in formulae are not specifically defined, it is understood that they are "as defined above" in accordance with the first definition of each symbol in the specification.

According to a feature of the invention compounds of formula (Ia) wherein X is H, m and R^1 are as defined above, and Y is as defined above with the exclusion of H, and the other symbols are as defined above, may be prepared by the reaction of a compound of formula (II):

12



(II)

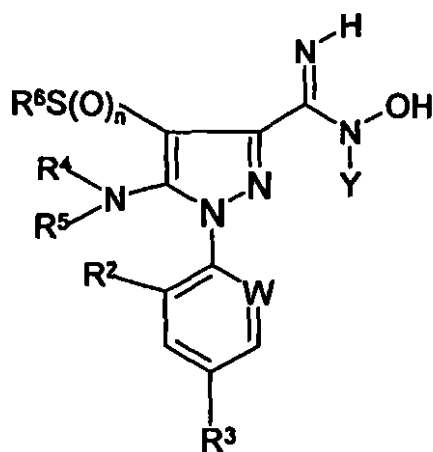
wherein R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W and n are as defined above, with a compound of formula (III):



(III)

wherein R^1 and m are as defined above and Y is as defined above with the exclusion of H . The reaction is generally performed in the presence of a base such as a trialkylamine for example triethylamine, in a solvent such as methanol, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ia) wherein X is H , m and R^1 are as defined above, Y is as defined above with the exclusion of H , and the other symbols are as defined above, may also be prepared by the reaction of a compound of formula (IV):



(IV)

wherein the various symbols are as defined above, with a compound of formula (V):



wherein R^1 and m are as defined above and L is a leaving group such as halogen, preferably chlorine, or sulfonyloxy. The reaction is generally performed in the presence of a base such as sodium hydride, in a solvent such as tetrahydrofuran or N,N -dimethylformamide, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ia) wherein X is as defined above with the exclusion of H , and the other symbols are as defined above, may be prepared by the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ia) wherein X is H , using a compound of formula (VI):



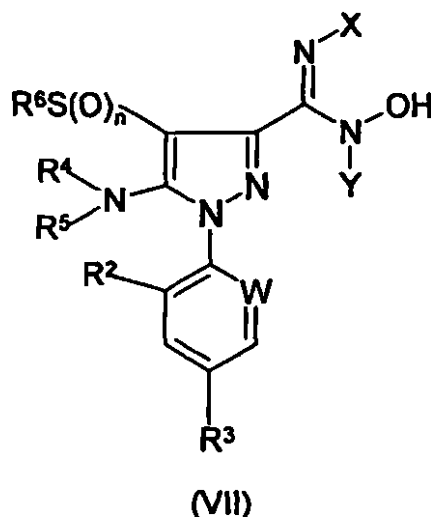
wherein X is as defined above with the exclusion of H and L^1 is a leaving group such as halogen, preferably chlorine, or sulfonyloxy.

The alkylation reaction (when X is (C_3-C_6) -alkenyl, (C_3-C_6) -haloalkenyl, (C_3-C_6) -alkynyl, (C_3-C_6) -haloalkynyl, (C_3-C_7) -cycloalkyl, $-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -alkyl- (C_3-C_7) -cycloalkyl, or (C_1-C_6) -alkyl unsubstituted or substituted by one or more R^{11} radicals; or where X is $-(\text{CH}_2)_q\text{R}^7$, $-(\text{CH}_2)_q\text{R}^{10}$ and q is 0) is generally performed in the presence of a base such as sodium hydride, in a solvent such as tetrahydrofuran or N,N -dimethylformamide, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C). For alkylations where X is $-(\text{CH}_2)_q\text{R}^7$, $-(\text{CH}_2)_q\text{R}^{10}$ and q is 1 (i.e. arylations), L^1 is preferably fluorine.

The sulfonylation reaction (when X is SO_2R^{13}) is generally performed in the presence of a base such as sodium hydride, in a solvent such as tetrahydrofuran or N,N -dimethylformamide, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

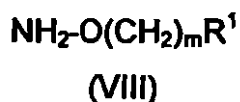
The acylation reaction (when X is $-\text{CO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -alkyl, CONR^7R^8 , CONR^8R^9 , $-\text{CO}_2-(\text{CH}_2)_q\text{R}^7$, COR^8 or COR^{17}) is generally performed in the presence of a base such as triethylamine, in a solvent such as tetrahydrofuran, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ia) wherein X, Y and the other symbols are as defined above, may be prepared by the reaction of a compound of formula (VII):



wherein the various symbols are as defined above, with a compound of formula (V) as defined above. The reaction is generally performed in the presence of a base such as sodium hydride, in a solvent such as tetrahydrofuran or N,N-dimethylformamide, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ib) wherein X and Y are each H, and m, R¹ and the other symbols are as defined above, may be prepared by the reaction of a compound of formula (II) as defined above, with a compound of formula (VIII):



wherein R¹ and m are as defined above. The reaction is generally performed in the presence of a base such as a trialkylamine for example triethylamine, in a solvent such as methanol, at a temperature of from 0° to 100°C (preferably 0° to 50°C).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ib) wherein X is H, Y is as defined above with the exclusion of H, and the other symbols are as defined above, may be prepared by the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ib) wherein Y is H, using a compound of formula (IX):

Y-L²

(IX)

wherein Y is as defined above with the exclusion of H and L² is a leaving group such as halogen, preferably chlorine, or sulfonyloxy.

The alkylation, acylation and sulfonylation reactions may be performed according to the procedures described in the above process for the preparation of compounds of formula (Ia) from compounds of formula (VI).

According to a further feature of the invention compounds of formula (Ib) wherein X and Y are as defined above with the exclusion of H, and the other symbols are as defined above, may be prepared by the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ib) wherein X is H, using a compound of formula (VI) as defined above.

The alkylation, acylation and sulfonylation reactions may be performed according to the procedures described in the above process for the preparation of compounds of formula (Ia) from compounds of formula (VI).

According to a further feature of the invention compounds of formula (I) wherein R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W, X, Y and m are as defined above, and n is 1 or 2 may be prepared by oxidising a corresponding compound in which n is 0 or 1. The oxidation is generally performed using a peracid such as 3-chloroperbenzoic acid in a solvent such as dichloromethane or 1,2-dichloroethane, at a temperature of from 0°C to the reflux temperature of the solvent.

Collections of compounds of the formula (I) which can be synthesized by the above mentioned process may also be prepared in a parallel manner, and this may be effected manually or in a semiautomated or fully automated manner. In this case, it is possible, for example, to automate the procedure of the reaction, work-up or purification of the products or of the intermediates. In total, this is to be understood as meaning a procedure as is described, for example, by S.H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volume 1, Verlag Escom 1997, pages 69 to 77.

A series of commercially available apparatuses as are offered by, for example, Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, England or H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Germany or Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, England, may be used for the parallel procedure of the reaction and work-up. For the parallel purification of compounds of the formula (I), or of intermediates obtained during the preparation, use may be made, inter alia, of chromatography apparatuses, for example those by ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

The apparatuses mentioned lead to a modular procedure in which the individual process steps are automated, but manual operations must be performed between the process steps. This can be prevented by employing semi-integrated or fully integrated automation systems where the automation modules in question are operated by, for example, robots. Such automation systems can be obtained, for example, from Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA.

In addition to what has been described here, compounds of the formula (I) may be prepared in part or fully by solid-phase-supported methods. For this purpose, individual intermediate steps or all intermediate steps of the synthesis or of a synthesis adapted to suit the procedure in question are bound to a synthetic resin. Solid-phase-supported synthesis methods are described extensively in the specialist literature, for example Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

The use of solid-phase-supported synthesis methods permits a series of protocols which are known from the literature and which, in turn, can be performed manually or in an automated manner. For example, the "tea-bag method" (Houghten, US 4,631,211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135), in which products by IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA, are employed, may be semiautomated. The automation of solid-phase-supported parallel syntheses is performed successfully, for example, by apparatuses by Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA or MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Germany.

The preparation of the processes described herein yields compounds of the formula (I) in the form of substance collections which are termed libraries. The present invention also relates to libraries which comprise at least two compounds of the formula (I).

Intermediates of formula (IV) as defined above, may be prepared by the reaction of a compound of formula (II) as defined above, with a compound of formula (X):



wherein Y is as defined above. The reaction may be carried out using the above procedure for the preparation of a compound of formula (Ia) from compounds of formula (III) and (II).

Intermediates of formula (VII) as defined above, may be prepared by the reaction of a compound of formula (IV) as defined above, with a compound of formula (VI) as defined above. The reaction may be carried out using the above procedure for the preparation of compound of formula (Ia) by the alkylation, acylation and sulfonylation of the corresponding compounds of formula (Ia) wherein X is H, using compounds of formula (VI).

Certain compounds of formula (IV) and (VII) are novel and as such form a further feature of the invention.

Compounds of formula (II), (III), (V), (VI), (VIII), (IX) and (X) are known or may be prepared by known methods.

The following non-limiting Examples illustrate the preparation of the compounds of formula (I).

Chemical Examples

In the Examples which follow, quantities (also percentages) are weight-based, unless stated otherwise.

Example 1:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-benzyloxy-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (Compound 1-49)

To a solution of 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-cyano-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (0.5 g, 1.1 mmol) in methanol was added O-benzylhydroxylamine hydrochloride (0.214 g, 1.34 mmol) and triethylamine (0.33 g, 3.3 mmol). The mixture was stirred at 20°C until a clear solution was obtained, and then evaporated. After adding water and ethyl acetate and extractive work up there was obtained the title product (0.387 g) as a white solid.

Example 2:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-(2,6-dichlorobenzyloxy)-N-methyl-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (Compound 4-82)

To a solution of 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-hydroxy-N-methyl-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (0.5 g, 1.0 mmol) in N,N-dimethylformamide was added sodium hydride (90%, 0.029 g, 1.1 mmol) After stirring for 0.5 hour at 20°C, 2,6-dichlorobenzyl bromide (0.252 g, 1.05 mmol) was added dropwise. The mixture was stirred for an additional 7 hours at 20°C. After adding aqueous ammonium chloride and extractive workup, the title product was isolated by chromatography (0.31 g) as a solid.

Example 3:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-methyl-N-(4-trifluoromethylbenzyloxy)-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (Compound 4-128)

By proceeding according to Example 2 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-hydroxy-N-methyl-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (0.5 g, 1.0 mmol), sodium hydride (90%, 0.029 g, 1.1 mmol) and 4-trifluoromethylbenzyl bromide, there was obtained the title compound (0.57 g) as a solid.

Example 4:

19

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-methyl-N-(4-trifluoromethoxybenzyloxy)-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylthiopyrazole (Compound 4-165)

By proceeding according to Example 2 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-hydroxy-N-methyl-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylthiopyrazole (0.5 g, 1.0 mmol), sodium hydride (90%, 0.029 g, 1.1 mmol) and 4-trifluoromethoxybenzyl bromide (0.290 g, 1.05 mmol) there was obtained the title compound (0.093 g) as a solid.

Example 5:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-methyl-N-(4-trifluoromethylbenzyloxy)-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (Compound 4-93)

By proceeding according to Example 2 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-hydroxy-N-methyl-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (0.5 g, 1.0 mmol), sodium hydride 90% (0.029 g, 1.1 mmol) and 4-trifluoromethylbenzyl bromide (0.251 g, 1.05 mmol), and subsequent purification by chromatography there was obtained 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-methyl-N-(4-trifluoromethylbenzyloxy)-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (0.018 g) as a solid.

Example 6:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-[N-(4-fluorobenzyloxy-N-methyl)-N'-(4-fluorobenzyl)-2-amidino]-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (Compound 4-159)

By proceeding according to Example 2 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-methyl-N-hydroxy-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (0.5 g, 1.0 mmol), sodium hydride (90%, 0.029 g, 1.1 mmol) and 4-fluorobenzyl bromide (0.202 g, 1.05 mmol) there was obtained the title compound (0.309 g) as a solid.

The following Reference Examples illustrate the preparation of intermediates used in the synthesis of the above Examples.

Intermediate Example 1:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-hydroxy-N-methyl-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole

To a solution of 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-cyano-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (2.0 g, 4.0 mmol) in methanol was added N-methylhydroxylamine hydrochloride (3.45 g, 41.55 mmol) and triethylamine (10.05 g, 13.9 ml, 99.0 mmol). The mixture was stirred for 8 hours at 20°C, evaporated and the resulting solid washed with water, filtered and dried to yield the title product (14.73 g) as a pale white solid.

Intermediate Example 2:

1-(2,6-Dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-(N-benzyl-N-hydroxy-2-amidino)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole

By proceeding according to Intermediate Example 1 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-cyano-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole (0.5 g, 1.1 mmol), N-benzylhydroxylamine hydrochloride (0.22 g, 1.34 mmol), there was obtained the title compound (0.450 g) as white solid.

Intermediate Example 3:

3-(N-Benzyl-N-hydroxy-2-amidino)-1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-5-methylamino-4-trifluoromethylthiopyrazole

By proceeding according to Intermediate Example 1 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-cyano-5-methylamino-4-trifluoromethylthiopyrazole (0.5 g, 1.1 mmol) and N-benzylhydroxylamine hydrochloride (0.22 g, 1.34 mmol) there was obtained the title compound (0.435 g) as a white solid.

Intermediate Example 4:

3-(N-Benzyl-N-hydroxy-2-amidino)-1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole

By proceeding according to Intermediate Example 1 but using 1-(2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl)-3-cyano-5-methylamino-4-trifluoromethylsulfonylpyrazole (0.5

g, 1.1 mmol) and N-benzylhydroxylamine hydrochloride (0.22 g, 1.34 mmol) there was obtained the title compound (0.61 g) as a white solid.

The following preferred compounds shown in Tables 1 to 7 also form part of the present invention, and were or may be prepared in accordance with, or analogously to, the above-mentioned Examples 1 to 6 or the above-described general methods. In the Tables cPr means cyclopropyl and Ph means phenyl. Where subscripts are omitted after atoms it will be understood that they are intended, for example CH₃ means CH₃.

Compound numbers are given for reference purposes only.

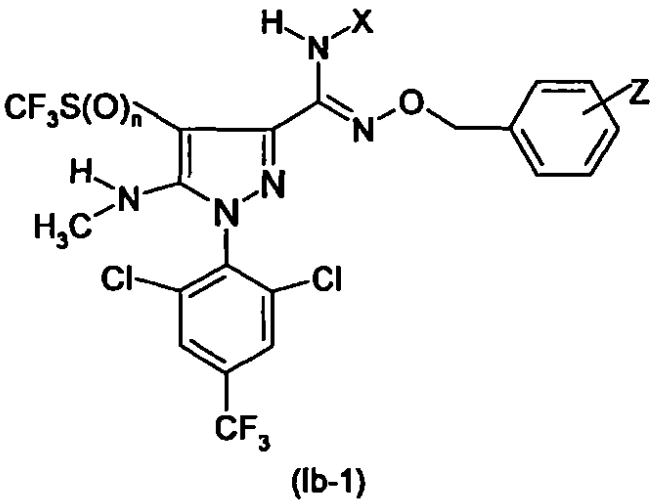
Table 1: Compounds of formula (Ib) where R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 1; R¹ = phenyl; X = Y = H

Compound Number	R ⁵	R ⁴	n	m. p. (°C)
1-1	H	CH ₃	0	
1-2	CH ₃	CH ₃	0	
1-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-6	CH ₂ CHCH ₃	CH ₃	0	
1-7	CH ₂ CCH ₃	CH ₃	0	
1-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	0	
1-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0	
1-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-12	CH ₂ cPr	CH ₃	0	
1-13	cPr	CH ₃	0	
1-14	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
1-15	H	H	0	
1-16	H	CH ₂ CH ₃	0	
1-17	H	iPr	0	
1-18	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
1-19	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0	
1-20	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-21	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	0	
1-22	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	0	
1-23	COCH ₃	CH ₃	0	

Compound Number	R ⁵	R ⁴	n	m p. (°C)
1-24	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-25	H	CH ₃	1	
1-26	CH ₃	CH ₃	1	
1-27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-30	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	1	
1-31	CH ₂ CCH	CH ₃	1	
1-32	C(O)OCH ₃	CH ₃	1	
1-33	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-34	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	1	
1-35	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-36	CH ₂ cPr	CH ₃	1	
1-37	cPr	CH ₃	1	
1-38	CH ₃	CH ₂ Ph	1	
1-39	H	H	1	
1-40	H	CH ₂ CH ₃	1	
1-41	H	iPr	1	
1-42	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	1	
1-43	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	1	
1-44	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-45	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	1	
1-46	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	1	
1-47	COCH ₃	CH ₃	1	
1-48	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-49	H	CH ₃	2	174
1-50	CH ₃	CH ₃	2	
1-51	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-52	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-54	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	2	
1-55	CH ₂ CCH	CH ₃	2	
1-56	C(O)OCH ₃	CH ₃	2	
1-57	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-58	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	2	
1-59	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-60	CH ₂ cPr	CH ₃	2	
1-61	cPr	CH ₃	2	
1-62	CH ₃	CH ₂ Ph	2	
1-63	H	H	2	
1-64	H	CH ₂ CH ₃	2	
1-65	H	iPr	2	

Compound Number	R ⁵	R ⁴	n	m. p. (°C)
1-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	2	
1-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	2	
1-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	2	
1-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	2	
1-71	COCH ₃	CH ₃	2	
1-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	

Table 2: Compounds of formula (Ib-1)



Compound Number	X	Z	n	m. p. (°C)
2-1	H	H	0	
2-2	CH ₃	H	0	
2-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
2-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
2-7	CH ₂ CCH	H	0	
2-8	C(O)OCH ₃	H	0	
2-9	C(O)CH ₃	H	0	
2-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
2-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
2-12	CH ₂ cPr	H	0	
2-13	cPr	H	0	
2-14	CH ₂ Ph	H	0	
2-15	H	H	1	
2-16	CH ₃	H	1	

Compound Number	X	Z	n	m. p. (°C)
2-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
2-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
2-21	CH ₂ CCH	H	1	
2-22	C(O)OCH ₃	H	1	
2-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
2-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-26	CH ₂ cPr	H	1	
2-27	cPr	H	1	
2-28	CH ₂ Ph	H	1	
2-29	H	H	2	
2-30	CH ₃	H	2	
2-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
2-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
2-35	CH ₂ CCH	H	2	
2-36	C(O)OCH ₃	H	2	
2-37	C(O)CH ₃	H	2	
2-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
2-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
2-40	CH ₂ cPr	H	2	
2-41	cPr	H	2	
2-42	CH ₂ Ph	H	2	
2-43	H	2-Cl	0	
2-44	H	3-Cl	0	
2-45	H	4-Cl	0	
2-46	H	2,5-Cl ₂	0	
2-47	H	2,6-Cl ₂	0	
2-48	H	3,4-Cl ₂	0	
2-49	H	2-F	0	
2-50	H	3-F	0	
2-51	H	4-F	0	
2-52	H	3,4-F ₂	0	
2-53	H	2,6-F ₂	0	
2-54	H	4-Br	0	
2-55	H	4-I	0	
2-56	H	2-CF ₃	0	
2-57	H	3-CF ₃	0	
2-58	H	4-CF ₃	0	

Compound Number	X	Z	n	m. p. (°C)
2-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
2-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
2-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
2-62	H	2-OCH ₃	0	
2-63	H	3-OCH ₃	0	
2-64	H	4-OCH ₃	0	
2-65	H	4-SCH ₃	0	
2-66	H	4-SCF ₃	0	
2-67	H	4-SF ₅	0	
2-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
2-69	H	4-Ph	0	
2-70	H	4-I	0	
2-71	H	2-CH ₃	0	
2-72	H	3-CH ₃	0	
2-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
2-74	H	4-CH ₃	0	
2-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
2-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	
2-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
2-78	H	2-Cl	1	
2-79	H	3-Cl	1	
2-80	H	4-Cl	1	
2-81	H	2,5-Cl ₂	1	
2-82	H	2,6-Cl ₂	1	
2-83	H	3,4-Cl ₂	1	
2-84	H	2-F	1	
2-85	H	3-F	1	
2-86	H	4-F	1	
2-87	H	3,4-F ₂	1	
2-88	H	2,6-F ₂	1	
2-89	H	4-Br	1	
2-90	H	4-I	1	
2-91	H	2-CF ₃	1	
2-92	H	3-CF ₃	1	
2-93	H	4-CF ₃	1	
2-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
2-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
2-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
2-97	H	2-OCH ₃	1	
2-98	H	3-OCH ₃	1	
2-99	H	4-OCH ₃	1	
2-100	H	4-SCH ₃	1	

Compound Number	X	Z	n	m p. (°C)
2-101	H	4-SCF ₃	1	
2-102	H	4-SF ₅	1	
2-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
2-104	H	4-Ph	1	
2-105	H	4-I	1	
2-106	H	2-CH ₃	1	
2-107	H	3-CH ₃	1	
2-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
2-109	H	4-CH ₃	1	
2-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
2-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
2-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
2-113	H	2-Cl	2	
2-114	H	3-Cl	2	
2-115	H	4-Cl	2	
2-116	H	2,5-Cl ₂	2	
2-117	H	2,6-Cl ₂	2	
2-118	H	3,4-Cl ₂	2	
2-119	H	2-F	2	
2-120	H	3-F	2	
2-121	H	4-F	2	
2-122	H	3,4-F ₂	2	
2-123	H	2,6-F ₂	2	
2-124	H	4-Br	2	
2-125	H	4-I	2	
2-126	H	2-CF ₃	2	
2-127	H	3-CF ₃	2	
2-128	H	4-CF ₃	2	
2-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
2-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
2-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
2-132	H	2-OCH ₃	2	
2-133	H	3-OCH ₃	2	
2-134	H	4-OCH ₃	2	
2-135	H	4-SCH ₃	2	
2-136	H	4-SCF ₃	2	
2-137	H	4-SF ₅	2	
2-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
2-139	H	4-Ph	2	
2-140	H	4-I	2	
2-141	H	2-CH ₃	2	
2-142	H	3-CH ₃	2	

Compound Number	X	Z	n	m. p. (°C)
2-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
2-144	H	4-CH ₃	2	
2-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
2-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
2-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
2-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
2-149	H	3,5-Cl ₂	0	
2-150	H	3,5-Cl ₂	1	
2-151	H	3,5-Cl ₂	2	

Table 3: Compounds of formula (Ia) where R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 1; R¹ = phenyl; X = H

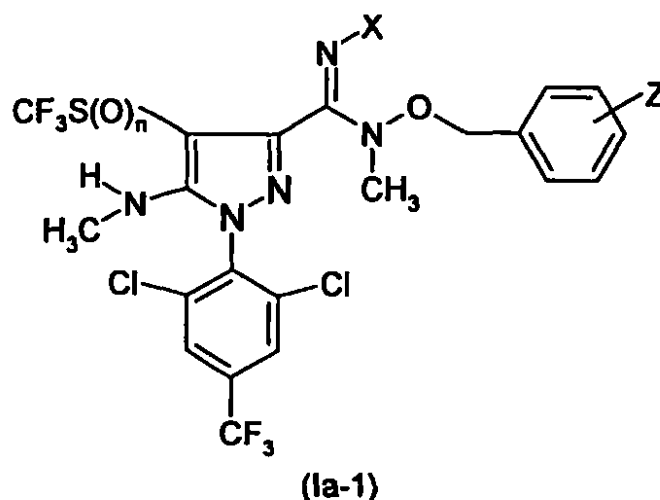
Cpd No.	R ⁵	R ⁴	Y	n	m.p. (°C)/ 1H-NMR
3-1	H	CH ₃	CH ₃	0	
3-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-6	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	0	
3-7	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	0	
3-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-12	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	0	
3-13	cPr	CH ₃	CH ₃	0	
3-14	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	0	
3-15	H	H	CH ₃	0	
3-16	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
3-17	H	iPr	CH ₃	0	
3-18	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	0	
3-19	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-20	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-21	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	0	
3-22	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	0	
3-23	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-24	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	

Cpd No.	R ⁵	R ⁴	Y	n	m.p. (°C)/ 1H-NMR
3-25	H	CH ₃	CH ₃	1	2,50 d,3H,N- CH ₃
3-26	CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-30	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	1	
3-31	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	1	
3-32	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-33	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-34	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-35	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-36	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-37	cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-38	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	1	
3-39	H	H	CH ₃	1	
3-40	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
3-41	H	iPr	CH ₃	1	
3-42	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	1	
3-43	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-44	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-45	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	1	
3-46	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	1	
3-47	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-48	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-49	H	CH ₃	CH ₃	2	
3-50	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-51	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-52	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-54	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	2	
3-55	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	2	
3-56	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-57	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-58	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-59	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-60	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	2	
3-61	cPr	CH ₃	CH ₃	2	
3-62	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	2	
3-63	H	H	CH ₃	2	
3-64	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	

Cpd No.	R ⁵	R ⁴	Y	n	m.p. (°C)/ 1H-NMR
3-65	H	iPr	CH ₃	2	
3-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	2	
3-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	2	
3-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	2	
3-71	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-73	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
3-74	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-75	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-76	H	CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	0	
3-77	H	CH ₃	CH ₂ CCH	0	
3-78	H	CH ₃	C(O)OCH ₃	0	
3-79	H	CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	0	
3-80	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	0	
3-81	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-82	H	CH ₃	CH ₂ cPr	0	
3-83	H	CH ₃	cPr	0	
3-84	H	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
3-85	H	CH ₃	H	0	
3-86	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-87	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-88	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-89	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	0	
3-90	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	0	
3-91	H	CH ₃	COCH ₃	0	
3-92	H	CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-93	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
3-94	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-95	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-96	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CHCH ₂	1	
3-97	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CCH	1	
3-98	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₃	1	
3-99	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	1	
3-100	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₃	1	
3-101	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-102	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ cPr	1	
3-103	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	cPr	1	
3-104	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ Ph	1	
3-105	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	1	
3-106	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	

Cpd No.	R ⁵	R ⁴	Y	n	m.p. (°C)/ 1H-NMR
3-107	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	
3-108	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-109	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	1	
3-110	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	1	
3-111	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₃	1	
3-112	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-113	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
3-114	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-115	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-116	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	2	
3-117	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CCH	2	
3-118	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₃	2	
3-119	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	2	
3-120	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	2	
3-121	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	
3-122	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ cPr	2	
3-123	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	cPr	2	
3-124	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ Ph	2	
3-125	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	2	
3-126	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-127	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-128	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-129	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	2	
3-130	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	2	
3-131	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₃	2	
3-132	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	

Table 4: Compounds of formula (Ia-1)



Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
4-1	CON(CH ₃) ₂	H	0	
4-2	CH ₃	H	0	
4-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
4-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
4-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
4-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
4-7	CH ₂ CCH	H	0	
4-8	C(O)OCH ₃	H	0	
4-9	C(O)CH ₃	H	0	
4-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
4-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
4-12	CH ₂ cPr	H	0	
4-13	cPr	H	0	
4-14	CH ₂ Ph	H	0	
4-15	H	H	1	
4-16	CH ₃	H	1	
4-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
4-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
4-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
4-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
4-21	CH ₂ CCH	H	1	
4-22	C(O)OCH ₃	H	1	
4-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
4-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
4-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
4-26	CH ₂ cPr	H	1	
4-27	cPr	H	1	
4-28	CH ₂ Ph	H	1	
4-29	H	H	2	
4-30	CH ₃	H	2	
4-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
4-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
4-35	CH ₂ CCH	H	2	
4-36	C(O)OCH ₃	H	2	
4-37	C(O)CH ₃	H	2	
4-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
4-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
4-40	CH ₂ cPr	H	2	
4-41	cPr	H	2	

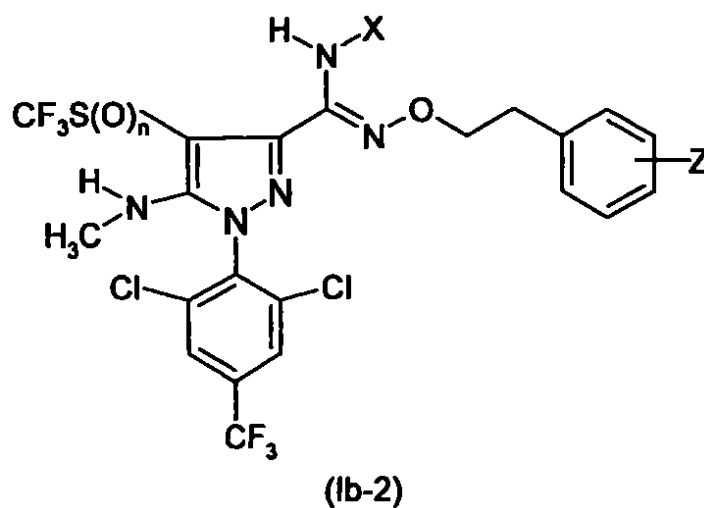
Cpd No.	X	Z	n	m p. (°C)/ ¹ H-NMR
4-42	CH ₂ Ph	H	2	
4-43	H	2-Cl	0	
4-44	H	3-Cl	0	
4-45	H	4-Cl	0	
4-46	H	2,5-Cl ₂	0	
4-47	H	2,6-Cl ₂	0	
4-48	H	3,4-Cl ₂	0	
4-49	H	2-F	0	
4-50	H	3-F	0	
4-51	H	4-F	0	
4-52	H	3,4-F ₂	0	
4-53	H	2,6-F ₂	0	
4-54	H	4-Br	0	
4-55	H	4-I	0	
4-56	H	2-CF ₃	0	
4-57	H	3-CF ₃	0	
4-58	H	4-CF ₃	0	
4-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
4-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
4-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
4-62	H	2-OCH ₃	0	
4-63	H	3-OCH ₃	0	
4-64	H	4-OCH ₃	0	
4-65	H	4-SCH ₃	0	
4-66	H	4-SCF ₃	0	
4-67	H	4-SF ₅	0	
4-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
4-69	H	4-Ph	0	
4-70	H	4-I	0	
4-71	H	2-CH ₃	0	
4-72	H	3-CH ₃	0	
4-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
4-74	H	4-CH ₃	0	
4-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
4-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	
4-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
4-78	H	2-Cl	1	
4-79	H	3-Cl	1	
4-80	H	4-Cl	1	
4-81	H	2,5-Cl ₂	1	
4-82	H	2,6-Cl ₂	1	79
4-83	H	3,4-Cl ₂	1	

Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
4-84	H	2-F	1	
4-85	H	3-F	1	
4-86	H	4-F	1	
4-87	H	3,4-F ₂	1	
4-88	H	2,6-F ₂	1	
4-89	H	4-Br	1	
4-90	H	4-I	1	
4-91	H	2-CF ₃	1	
4-92	H	3-CF ₃	1	
4-93	H	4-CF ₃	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
4-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
4-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
4-97	H	2-OCH ₃	1	
4-98	H	3-OCH ₃	1	
4-99	H	4-OCH ₃	1	
4-100	H	4-SCH ₃	1	
4-101	H	4-SCF ₃	1	2,51, d,3H, N-CH ₃
4-102	H	4-SF ₅	1	
4-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
4-104	H	4-Ph	1	
4-105	H	4-I	1	
4-106	H	2-CH ₃	1	
4-107	H	3-CH ₃	1	
4-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
4-109	H	4-CH ₃	1	
4-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
4-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
4-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
4-113	H	2-Cl	2	
4-114	H	3-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-115	H	4-Cl	2	175
4-116	H	2,5-Cl ₂	2	
4-117	H	2,6-Cl ₂	2	80
4-118	H	3,4-Cl ₂	2	
4-119	H	2-F	2	
4-120	H	3-F	2	
4-121	H	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-122	H	3,4-F ₂	2	
4-123	H	2,6-F ₂	2	
4-124	H	4-Br	2	
4-125	H	4-I	2	

Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
4-126	H	2-CF ₃	2	
4-127	H	3-CF ₃	2	
4-128	H	4-CF ₃	2	93
4-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
4-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
4-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
4-132	H	2-OCH ₃	2	
4-133	H	3-OCH ₃	2	
4-134	H	4-OCH ₃	2	
4-135	H	4-SCH ₃	2	
4-136	H	4-SCF ₃	2	62
4-137	H	4-SF ₅	2	
4-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
4-139	H	4-Ph	2	
4-140	H	4-I	2	
4-141	H	2-CH ₃	2	
4-142	H	3-CH ₃	2	
4-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
4-144	H	4-CH ₃	2	81
4-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
4-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
4-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
4-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
4-149	H	3,5-Cl ₂	0	
4-150	H	3,5-Cl ₂	1	
4-151	H	3,5-Cl ₂	2	
4-152	H	3,5-(CH ₃) ₂	2	64
4-153	H	2-CN	2	54
4-154	H	4-tert-C ₄ H ₉	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-155	H	4-tert-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-156	3-F-benzyl	3-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-157	2-F-benzyl	2-F	2	2,61, d,3H, N-CH ₃
4-158	2-Cl-benzyl	2-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-159	4-F-benzyl	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-160	3-Cl-benzyl	3-Cl	2	2,68, d,3H, N-CH ₃
4-161	3-CH ₃ -benzyl	3-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-162	3-OCH ₃ -benzyl	3-OCH ₃	2	2,62, d,3H, N-CH ₃
4-163	2-CH ₃ -benzyl	2-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-164	4-tert-C ₄ H ₉ -benzyl	4-tert-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-165	H	4-OCF ₃	0	

35

Table 5: Compounds of formula (Ib-2)



Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
5-1	H	H	0	Oil
5-2	CH ₃	H	0	
5-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
5-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
5-7	CH ₂ CCH	H	0	
5-8	C(O)OCH ₃	H	0	
5-9	C(O)CH ₃	H	0	
5-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
5-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
5-12	CH ₂ cPr	H	0	
5-13	cPr	H	0	
5-14	CH ₂ Ph	H	0	
5-15	H	H	1	
5-16	CH ₃	H	1	
5-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
5-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
5-21	CH ₂ CCH	H	1	
5-22	C(O)OCH ₃	H	1	
5-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
5-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
5-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	

Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
5-26	CH ₂ cPr	H	1	
5-27	cPr	H	1	
5-28	CH ₂ Ph	H	1	
5-29	H	H	2	
5-30	CH ₃	H	2	
5-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
5-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
5-35	CH ₂ CCH	H	2	
5-36	C(O)OCH ₃	H	2	
5-37	C(O)CH ₃	H	2	
5-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
5-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
5-40	CH ₂ cPr	H	2	
5-41	cPr	H	2	
5-42	CH ₂ Ph	H	2	
5-43	H	2-Cl	0	
5-44	H	3-Cl	0	
5-45	H	4-Cl	0	
5-46	H	2,5-Cl ₂	0	
5-47	H	2,6-Cl ₂	0	
5-48	H	3,4-Cl ₂	0	
5-49	H	2-F	0	
5-50	H	3-F	0	
5-51	H	4-F	0	
5-52	H	3,4-F ₂	0	
5-53	H	2,6-F ₂	0	
5-54	H	4-Br	0	
5-55	H	4-I	0	
5-56	H	2-CF ₃	0	
5-57	H	3-CF ₃	0	
5-58	H	4-CF ₃	0	
5-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
5-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
5-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
5-62	H	2-OCH ₃	0	
5-63	H	3-OCH ₃	0	
5-64	H	4-OCH ₃	0	
5-65	H	4-SCH ₃	0	
5-66	H	4-SCF ₃	0	
5-67	H	4-SF ₅	0	

Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
5-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
5-69	H	4-Ph	0	
5-70	H	4-I	0	
5-71	H	2-CH ₃	0	
5-72	H	3-CH ₃	0	
5-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
5-74	H	4-CH ₃	0	
5-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
5-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	
5-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
5-78	H	2-Cl	1	
5-79	H	3-Cl	1	
5-80	H	4-Cl	1	
5-81	H	2,5-Cl ₂	1	
5-82	H	2,6-Cl ₂	1	
5-83	H	3,4-Cl ₂	1	
5-84	H	2-F	1	
5-85	H	3-F	1	
5-86	H	4-F	1	
5-87	H	3,4-F ₂	1	
5-88	H	2,6-F ₂	1	
5-89	H	4-Br	1	
5-90	H	4-I	1	
5-91	H	2-CF ₃	1	
5-92	H	3-CF ₃	1	
5-93	H	4-CF ₃	1	
5-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
5-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
5-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
5-97	H	2-OCH ₃	1	
5-98	H	3-OCH ₃	1	
5-99	H	4-OCH ₃	1	
5-100	H	4-SCH ₃	1	
5-101	H	4-SCF ₃	1	
5-102	H	4-SF ₅	1	
5-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
5-104	H	4-Ph	1	
5-105	H	4-I	1	
5-106	H	2-CH ₃	1	
5-107	H	3-CH ₃	1	
2-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
5-109	H	4-CH ₃	1	

Cpd No.	X	Z	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
5-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
5-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
5-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
5-113	H	2-Cl	2	
5-114	H	3-Cl	2	
5-115	H	4-Cl	2	
5-116	H	2,5-Cl ₂	2	
5-117	H	2,6-Cl ₂	2	
5-118	H	3,4-Cl ₂	2	
5-119	H	2-F	2	
5-120	H	3-F	2	
5-121	H	4-F	2	
5-122	H	3,4-F ₂	2	
5-123	H	2,6-F ₂	2	
5-124	H	4-Br	2	
5-125	H	4-I	2	
5-126	H	2-CF ₃	2	
5-127	H	3-CF ₃	2	
5-128	H	4-CF ₃	2	
5-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
5-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
5-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
5-132	H	2-OCH ₃	2	
5-133	H	3-OCH ₃	2	
5-134	H	4-OCH ₃	2	
5-135	H	4-SCH ₃	2	
5-136	H	4-SCF ₃	2	
5-137	H	4-SF ₅	2	
5-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
5-139	H	4-Ph	2	
5-140	H	4-I	2	
5-141	H	2-CH ₃	2	
5-142	H	3-CH ₃	2	
5-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
5-144	H	4-CH ₃	2	
5-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
5-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
5-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
5-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
5-149	H	3,5-Cl ₂	0	
5-150	H	3,5-Cl ₂	1	
5-151	H	3,5-Cl ₂	2	

Table 6: Compounds of formula (Ib) where $R^2 = Cl$; $W = C-Cl$; $R^3 = R^6 = CF_3$; $m = 1$; $R^4 = Y = H$; $R^5 = CH_3$

Cpd No.	X	R^1	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
6-1	H	2-pyridyl	0	
6-2	H	3-pyridyl	0	2,56, d,3H, N-CH ₃
6-3	H	3-pyridyl	0	
6-4	H	4-pyridyl	0	
6-5	H	1-pyrimidyl	0	
6-6	H	3-pyrimidyl	0	
6-7	H	4-pyrimidyl	0	
6-8	H	2-thienyl	0	
6-9	H	3-thienyl	0	
6-10	H	2-furyl	0	
6-11	H	3-furyl	0	
6-12	H	2-tetrahydrofuryl	0	
6-13	H	3-tetrahydrofuryl	0	
6-14	H	3-pyrazolyl	0	
6-15	H	4-pyrazolyl	0	
6-16	H	5-pyrazolyl	0	
6-17	H	2-imidazolyl	0	
6-18	H	4-imidazolyl	0	
6-19	H	5-imidazolyl	0	
6-20	H	2-thiazolyl	0	
6-21	H	4-thiazolyl	0	
6-22	H	5-thiazolyl	0	
6-23	H	2-tetrahydrothienyl	0	
6-24	H	2-pyrrolyl	0	
6-25	H	3-pyrrolyl	0	
6-26	H	4-pyrrolyl	0	
6-27	H	1-tetrazolyl	0	
6-28	H	5-tetrazolyl	0	
6-29	H	3-(1,2,4)-triazolyl	0	
6-30	H	5-(1,2,4)-triazolyl	0	
6-31	CH ₃	2-thienyl	0	
6-32	CH ₂ CH ₃	2-thienyl	0	
6-33	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	0	
6-34	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	0	
6-35	CH ₂ CHCH ₂	1-methyl-4-imidazolyl	0	

Cpd No.	X	R ¹	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
6-36	CH ₂ CCH	1-methyl-4-imidazolyl	0	
6-37	C(O)OCH ₃	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	0	
6-38	C(O)CH ₃	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	0	
6-39	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	0	
6-40	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	0	
6-41	CH ₂ cPr	2,5-dimethyl-3-thienyl	0	
6-42	H	2-Cl-5-pyridyl	0	2,59, d,3H, N-CH ₃
6-43	H	2-pyridyl	1	
6-44	H	3-pyridyl	1	
6-45	H	3-pyridyl	1	
6-46	H	4-pyridyl	1	
6-47	H	1-pyrimidyl	1	
6-48	H	3-pyrimidyl	1	
6-49	H	4-pyrimidyl	1	
6-50	H	2-thienyl	1	
6-51	H	3-thienyl	1	
6-52	H	2-furyl	1	
6-53	H	3-furyl	1	
6-54	H	2-tetrahydrofuryl	1	
6-55	H	3-tetrahydrofuryl	1	
6-56	H	3-pyrazolyl	1	
6-57	H	4-pyrazolyl	1	
6-58	H	5-pyrazolyl	1	
6-59	H	2-imidazolyl	1	
6-60	H	4-imidazolyl	1	
6-61	H	5-imidazolyl	1	
6-62	H	2-thiazolyl	1	
6-63	H	4-thiazolyl	1	
6-64	H	5-thiazolyl	1	
6-65	H	2-tetrahydrothienyl	1	
6-66	H	2-pyrrolyl	1	
6-67	H	3-pyrrolyl	1	
6-68	H	4-pyrrolyl	1	
6-69	H	1-tetrazolyl	1	
6-70	H	5-tetrazolyl	1	
6-71	H	3-(1,2,4)-triazolyl	1	
6-72	H	5-(1,2,4)-triazolyl	1	
6-73	CH ₃	2-thienyl	1	
6-74	CH ₂ CH ₃	2-thienyl	1	
6-75	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	1	
6-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	1	
6-77	CH ₂ CHCH ₂	1-methyl-4-imidazolyl	1	

Cpd No.	X	R ¹	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
6-78	CH ₂ CCH	1-methyl-4-imidazolyl	1	
6-79	C(O)OCH ₃	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	1	
6-80	C(O)CH ₃	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	1	
6-81	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	1	
6-82	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	1	
6-83	CH ₂ cPr	2,5-dimethyl-3-thienyl	1	
6-84	H	2-Cl-5-pyridyl	1	2,64, d,3H, N-CH ₃
6-85	H	2-pyridyl	2	
6-86	H	3-pyridyl	2	
6-87	H	3-pyridyl	2	
6-88	H	4-pyridyl	2	
6-89	H	1-pyrimidyl	2	
6-90	H	3-pyrimidyl	2	
6-91	H	4-pyrimidyl	2	
6-92	H	2-thienyl	2	
6-93	H	3-thienyl	2	
6-94	H	2-furyl	2	
6-95	H	3-furyl	2	
6-96	H	2-tetrahydrofuryl	2	
6-97	H	3-tetrahydrofuryl	2	
6-98	H	3-pyrazolyl	2	
6-99	H	4-pyrazolyl	2	
6-100	H	5-pyrazolyl	2	
6-101	H	2-imidazolyl	2	
6-102	H	4-imidazolyl	2	
6-103	H	5-imidazolyl	2	
6-104	H	2-thiazolyl	2	
6-105	H	4-thiazolyl	2	
6-106	H	5-thiazolyl	2	
6-107	H	2-tetrahydrothienyl	2	
6-108	H	2-pyrrolyl	2	
6-109	H	3-pyrrolyl	2	
6-110	H	4-pyrrolyl	2	
6-111	H	1-tetrazolyl	2	
6-112	H	5-tetrazolyl	2	
6-113	H	3-(1,2,4)-triazolyl	2	
6-114	H	5-(1,2,4)-triazolyl	2	
6-115	CH ₃	2-thienyl	2	
6-116	CH ₂ CH ₃	2-thienyl	2	
6-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	2	
6-118	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-thienyl	2	
6-119	CH ₂ CHCH ₂	1-methyl-4-imidazolyl	2	

Cpd No.	X	R ¹	n	m.p. (°C)/ ¹ H-NMR
6-120	CH ₂ CCH	1-methyl-4-imidazolyl	2	
6-121	C(O)OCH ₃	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	2	
6-122	C(O)CH ₃	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	2	
6-123	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	2	
6-124	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	2	
6-125	CH ₂ cPr	2,5-dimethyl-3-thienyl	2	
6-126	H	2-Cl-5-pyridyl	2	2,65, d,3H, N-CH ₃

Table 7. Compounds of formula (Ib) where R² = Cl; W = C-Cl; R³ = R⁶ = CF₃; m = 2; R⁴ = Y = H; R⁵ = CH₃

Cpd No.	X	R ¹	n	m.p. (°C)
7-1	H	2-pyridyl	0	Oil
7-2	H	3-pyridyl	0	
7-3	H	3-pyridyl	0	
7-4	H	4-pyridyl	0	
7-5	H	1-pyrimidyl	0	
7-6	H	3-pyrimidyl	0	
7-7	H	4-pyrimidyl	0	
7-8	H	2-thienyl	0	
7-9	H	3-thienyl	0	
7-10	H	2-furyl	0	
7-11	H	3-furyl	0	
7-12	H	2-tetrahydrofuryl	0	
7-13	H	3-tetrahydrofuryl	0	
7-14	H	3-pyrazolyl	0	
7-15	H	4-pyrazolyl	0	
7-16	H	5-pyrazolyl	0	
7-17	H	2-imidazolyl	0	
7-18	H	4-imidazolyl	0	
7-19	H	5-imidazolyl	0	
7-20	H	2-thiazolyl	0	
7-21	H	4-thiazolyl	0	
7-22	H	5-thiazolyl	0	
7-23	H	2-tetrahydrothienyl	0	
7-24	H	2-pyrrolyl	0	
7-25	H	3-pyrrolyl	0	
7-26	H	4-pyrrolyl	0	

Cpd No.	X	R ¹	n	m.p. (°C)
7-27	H	1-tetrazolyl	0	
7-28	H	5-tetrazolyl	0	
7-29	H	3-(1,2,4)-triazolyl	0	
7-30	H	5-(1,2,4)-triazolyl	0	
7-31	H	2-thienyl	0	
7-32	H	2-thienyl	0	
7-33	H	2-thienyl	0	
7-34	H	2-thienyl	0	
7-35	H	1-methyl-4-imidazolyl	0	
7-36	H	1-methyl-4-imidazolyl	0	
7-37	H	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	0	
7-38	H	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	0	
7-39	H	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	0	
7-40	H	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	0	
7-41	H	2,5-dimethyl-3-thienyl	0	
7-42	H	2-Cl-5-pyridyl	0	
7-43	H	2-pyridyl	1	
7-44	H	3-pyridyl	1	
7-45	H	3-pyridyl	1	
7-46	H	4-pyridyl	1	
7-47	H	1-pyrimidyl	1	
7-48	H	3-pyrimidyl	1	
7-49	H	4-pyrimidyl	1	
7-50	H	2-thienyl	1	
7-51	H	3-thienyl	1	
7-52	H	2-furyl	1	
7-53	H	3-furyl	1	
7-54	H	2-tetrahydrofuryl	1	
7-55	H	3-tetrahydrofuryl	1	
7-56	H	3-pyrazolyl	1	
7-57	H	4-pyrazolyl	1	
7-58	H	5-pyrazolyl	1	
7-59	H	2-imidazolyl	1	
7-60	H	4-imidazolyl	1	
7-61	H	5-imidazolyl	1	
7-62	H	2-thiazolyl	1	
7-63	H	4-thiazolyl	1	
7-64	H	5-thiazolyl	1	
7-65	H	2-tetrahydrothienyl	1	
7-66	H	2-pyrrolyl	1	
7-67	H	3-pyrrolyl	1	
7-68	H	4-pyrrolyl	1	

Cpd No	X	R ¹	n	m.p (°C)
7-69	H	1-tetrazolyl	1	
7-70	H	5-tetrazolyl	1	
7-71	H	3-(1,2,4)-triazolyl	1	
7-72	H	5-(1,2,4)-triazolyl	1	
7-73	H	2-thienyl	1	
7-74	H	2-thienyl	1	
7-75	H	2-thienyl	1	
7-76	H	2-thienyl	1	
7-77	H	1-methyl-4-imidazolyl	1	
7-78	H	1-methyl-4-imidazolyl	1	
7-79	H	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	1	
7-80	H	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	1	
7-81	H	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	1	
7-82	H	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	1	
7-83	H	2,5-dimethyl-3-thiophenyl	1	
7-84	H	2-Cl-5-pyridyl	1	
7-85	H	2-pyridyl	2	
7-86	H	3-pyridyl	2	
7-87	H	3-pyridyl	2	
7-88	H	4-pyridyl	2	
7-89	H	1-pyrimidyl	2	
7-90	H	3-pyrimidyl	2	
7-91	H	4-pyrimidyl	2	
7-92	H	2-thienyl	2	
7-93	H	3-thienyl	2	
7-94	H	2-furyl	2	
7-95	H	3-furyl	2	
7-96	H	2-tetrahydrofuryl	2	
7-97	H	3-tetrahydrofuryl	2	
7-98	H	3-pyrazolyl	2	
7-99	H	4-pyrazolyl	2	
7-100	H	5-pyrazolyl	2	
7-101	H	2-imidazolyl	2	
7-102	H	4-imidazolyl	2	
7-103	H	5-imidazolyl	2	
7-104	H	2-thiazolyl	2	
7-105	H	4-thiazolyl	2	
7-106	H	5-thiazolyl	2	
7-107	H	2-tetrahydrothienyl	2	
7-108	H	2-pyrrolyl	2	
7-109	H	3-pyrrolyl	2	
7-110	H	4-pyrrolyl	2	

Cpd No.	X	R ¹	n	m p. (°C)
7-111	H	1-tetrazolyl	2	
7-112	H	5-tetrazolyl	2	
7-113	H	3-(1,2,4)-triazolyl	2	
7-114	H	5-(1,2,4)-triazolyl	2	
7-115	H	2-thienyl	2	
7-116	H	2-thienyl	2	
7-117	H	2-thienyl	2	
7-118	H	2-thienyl	2	
7-119	H	1-methyl-4-imidazolyl	2	
7-120	H	1-methyl-4-imidazolyl	2	
7-121	H	1,3-dimethyl-5-Cl-pyrazolyl	2	
7-122	H	2,4-dimethyl-5-thiazolyl	2	
7-123	H	5-(2-pyridyl)-2-thienyl	2	
7-124	H	2-methyl-5-CF ₃ -4-furyl	2	
7-125	H	2,5-dimethyl-3-thienyl	2	
7-126	H	2-Cl-5-pyridyl	2	
7-127	CH ₃	2-pyridyl	1	Oil
7-128	CH ₃	3-pyridyl	0	
7-129	CH ₃	3-pyridyl	0	
7-130	CH ₃	4-pyridyl	0	

According to a further feature of the present invention there is provided a method for the control of pests at a locus which comprises the application of an effective amount of a compound of formula (I) or a salt thereof. For this purpose, the said compound is normally used in the form of a pesticidal composition (i.e. in association with compatible diluents or carriers and/or surface active agents suitable for use in pesticidal compositions), for example as hereinafter described.

The term "compound of the invention" as used hereinafter embraces a 5-substituted-alkylaminopyrazole of formula (I) as defined above and a pesticidally acceptable salt thereof.

One aspect of the present invention as defined above is a method for the control of pests at a locus. The locus includes, for example, the pest itself, the place (plant, field, forest, orchard, waterway, soil, plant product, or the like) where the pest resides or feeds, or a place susceptible to future infestation by the pest. The compound of

the invention may therefore be applied directly to the pest, to the place where the pest resides or feeds, or to the place susceptible to future infestation by the pest. As is evident from the foregoing pesticidal uses, the present invention provides pesticidally active compounds and methods of use of said compounds for the control of a number of pest species which includes: arthropods, especially insects or arachnids, such as mites, or helminths, such as plant nematodes. The compound of the invention may thus be advantageously employed in practical uses, for example, in agricultural or horticultural crops, in forestry, in veterinary medicine or livestock husbandry, or in public health.

The compounds of the invention may be used for example in the following applications and on the following pests:

For the control of soil insects, such as corn rootworm, termites (especially for protection of structures), root maggots, wireworms, root weevils, stalkborers, cutworms, root aphids, or grubs. They may also be used to provide activity against plant pathogenic nematodes, such as root-knot, cyst, dagger, lesion, or stem or bulb nematodes, or against mites. For the control of soil pests, for example corn rootworm, the compounds are advantageously applied to or incorporated at an effective rate into the soil in which crops are planted or to be planted or to the seeds or growing plant roots.

In the area of public health, the compounds are especially useful in the control of many insects, especially filth flies or other Dipteran pests, such as houseflies, stableflies, soldierflies, hornflies, deerflies, horseflies, midges, punkies, blackflies, or mosquitoes.

In the protection of stored products, for example cereals, including grain or flour, groundnuts, animal feedstuffs, timber or household goods, e.g. carpets and textiles, compounds of the invention are useful against attack by arthropods, more especially beetles, including weevils, moths or mites, for example *Ephestia* spp. (flour moths), *Anthrenus* spp. (carpet beetles), *Tribolium* spp. (flour beetles), *Sitophilus* spp. (grain weevils) or *Acarus* spp. (mites).

In the control of cockroaches, ants or termites or similar arthropod pests in infested domestic or industrial premises or in the control of mosquito larvae in waterways, wells, reservoirs or other running or standing water.

For the treatment of foundations, structures or soil in the prevention of the attack on building by termites, for example, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp..

In agriculture against adults, larvae and eggs of Lepidoptera (butterflies and moths), e.g. *Heliothis* spp. such as *Heliothis virescens* (tobacco budworm), *Heliothis armigera* and *Heliothis zea*. Against adults and larvae of Coleoptera (beetles) e.g. *Anthonomus* spp. e.g. *grandis* (cotton boll weevil), *Leptinotarsa decemlineata* (Colorado potato beetle), *Diabrotica* spp. (corn rootworms). Against Heteroptera (Hemiptera and Homoptera) e.g. *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (rice leaf hoppers), *Nilaparvata* spp..

Against Diptera e.g. *Musca* spp.. Against Thysanoptera such as *Thrips tabaci*.

Against Orthoptera such as *Locusta* and *Schistocerca* spp., (locusts and crickets)

e.g. *Gryllus* spp., and *Acheta* spp. for example, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, and *Schistocerca gregaria*. Against Collembola e.g. *Periplaneta* spp. and *Blatella* spp. (roaches).

Against arthropods of agricultural significance such as Acari (mites) e.g. *Tetranychus* spp., and *Panonychus* spp..

Against nematodes which attack plants or trees of importance to agriculture, forestry or horticulture either directly or by spreading bacterial, viral, mycoplasma or fungal diseases of the plants. For example root-knot nematodes such as *Meloidogyne* spp. (e.g. *M. incognita*).

In the field of veterinary medicine or livestock husbandry or in the maintenance of public health against arthropods which are parasitic internally or externally upon vertebrates, particularly warm-blooded vertebrates, for example domestic animals, e.g. cattle, sheep, goats, equines, swine, poultry, dogs or cats, for example Acarina, including ticks (e.g. soft-bodied ticks including Argasidae spp. e.g. *Argas* spp. and *Ornithodoros* spp. (e.g. *Ornithodoros moubata*); hard-bodied ticks including Ixodidae spp., e.g. *Boophilus* spp. e.g. *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp. e.g.

Rhipicephalus appendiculatus and *Rhipicephalus sanguineus*; mites (e.g. *Damalinia* spp.); fleas (e.g. *Ctenocephalides* spp. e.g. *Ctenocephalides felis* (cat flea) and *Ctenocephalides canis* (dog flea)); lice e.g. *Menopon* spp.; Diptera (e.g. *Aedes* spp.,

Anopheles spp., Musca spp., Hypoderma spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (e.g. Periplaneta spp., Blatella spp.); Hymenoptera; for example against infections of the gastro-intestinal tract caused by parasitic nematode worms, for example members of the family Trichostrongylidae.

In a preferred aspect of the invention the compounds of formula (I) are used for the control of parasites of animals. Preferably the animal to be treated is a domestic companion animal such as a dog or a cat.

In a further aspect of the invention the compounds of formula (I) or salts or compositions thereof are used for the preparation of a veterinary medicament.

In practical use for the control of arthropods, especially insects or arachnids, such as mites, or helminths, such as nematode pests of plants, a method, for example, comprises applying to the plants or to the medium in which they grow an effective amount of a compound of the invention. For such a method, the compound of the invention is generally applied to the locus in which the arthropod or nematode infestation is to be controlled at an effective rate in the range of about 2g to about 1kg of the active compound per hectare of locus treated. Under ideal conditions, depending on the pest to be controlled, a lower rate may offer adequate protection. On the other hand, adverse weather conditions, resistance of the pest or other factors may require that the active ingredient be used at higher rates. The optimum rate depends usually upon a number of factors, for example, the type of pest being controlled, the type or the growth stage of the infested plant, the row spacing or also the method of application. Preferably an effective rate range of the active compound is from about 10g/ha to about 400g/ha, more preferably from about 50g/ha to about 200 g/ha.

When a pest is soil-borne, the active compound, generally in a formulated composition, is distributed evenly over the area to be treated (for example broadcast or band treatment) in any convenient manner and is applied at rates from about 10g/ha to about 400g ai/ha, preferably from about 50g/ha to about 200 g ai/ha. When applied as a root dip to seedlings or drip irrigation to plants the liquid solution or suspension contains from about 0.075 to about 1000 mg ai/l, preferably from

about 25 to about 200 mg ai/l. Application may be made, if desired, to the field or crop-growing area generally or in close proximity to the seed or plant to be protected from attack. The compound of the invention can be washed into the soil by spraying with water over the area or can be left to the natural action of rainfall. During or after application, the formulated compound can, if desired, be distributed mechanically in the soil, for example by ploughing, disking, or use of drag chains. Application can be prior to planting, at planting, after planting but before sprouting has taken place, or after sprouting.

The compound of the invention and methods of control of pests therewith are of particular value in the protection of field, forage, plantation, glasshouse, orchard or vineyard crops, of ornamentals, or of plantation or forest trees, for example: cereals (such as wheat or rice), cotton, vegetables (such as peppers), field crops (such as sugar beets, soybeans or oil seed rape), grassland or forage crops (such as maize or sorghum), orchards or groves (such as of stone or pit fruit or citrus), ornamental plants, flowers or vegetables or shrubs under glass or in gardens or parks, or forest trees (both deciduous and evergreen) in forests, plantations or nurseries.

They are also valuable in the protection of timber (standing, felled, converted, stored or structural) from attack, for example, by sawflies or beetles or termites.

They have applications in the protection of stored products such as grains, fruits, nuts, spices or tobacco, whether whole, milled or compounded into products, from moth, beetle, mite or grain weevil attack. Also protected are stored animal products such as skins, hair, wool or feathers in natural or converted form (e.g. as carpets or textiles) from moth or beetle attack as well as stored meat, fish or grains from beetle, mite or fly attack.

Additionally, the compound of the invention and methods of use thereof are of particular value in the control of arthropods or helminths which are injurious to, or spread or act as vectors of diseases domestic animals, for example those hereinbefore mentioned, and more especially in the control of ticks, mites, lice, fleas, midges, or biting, nuisance or myiasis flies. The compounds of the invention are particularly useful in controlling arthropods or helminths which are present inside domestic host animals or which feed in or on the skin or suck the blood of the

animal, for which purpose they may be administered orally, parenterally, percutaneously or topically.

The compositions hereinafter described for application to growing crops or crop growing loci or as a seed dressing may, in general, alternatively be employed in the protection of stored products, household goods, property or areas of the general environment. Suitable means of applying the compounds of the invention include: to growing crops as foliar sprays (for example as an in-furrow spray), dusts, granules, fogs or foams or also as suspensions of finely divided or encapsulated compositions as soil or root treatments by liquid drenches, dusts, granules, smokes or foams; to seeds of crops via application as seed dressings by liquid slurries or dusts;

to animals infested by or exposed to infestation by arthropods or helminths, by parenteral, oral or topical application of compositions in which the active ingredient exhibits an immediate and/or prolonged action over a period of time against the arthropods or helminths, for example by incorporation in feed or suitable orally-ingestible pharmaceutical formulations, edible baits, salt licks, dietary supplements, pour-on formulations, sprays, baths, dips, showers, jets, dusts, greases, shampoos, creams, wax smears or livestock self-treatment systems;

to the environment in general or to specific locations where pests may lurk, including stored products, timber, household goods, or domestic or industrial premises, as sprays, fogs, dusts, smokes, wax-smears, lacquers, granules or baits, or in tricklefeeds to waterways, wells, reservoirs or other running or standing water.

The compounds of formula (I) are particularly useful for the control of parasites of animals when applied orally, and in a further preferred aspect of the invention the compounds of formula (I) are used for the control of parasites of animals by oral application. The compounds of the formula (I) or salts thereof may be administered before, during or after meals. The compounds of the formula (I) or salts thereof may be mixed with a carrier and/or foodstuff.

The compound of the formula (I) or salt thereof is administered orally in a dose to the animal in a dose range generally from 0.1 to 500 mg/kg of the compound of the formula (I) or salt thereof per kilogram of animal body weight (mg/kg).

The frequency of treatment of the animal, preferably the domestic animal to be treated by the compound of the formula (I) or salt thereof is generally from about once per week to about once per year, preferably from about once every two weeks to once every three months.

The compounds of the invention may be administered most advantageously with another parasitically effective material, such as an endoparasiticide, and/or an ectoparasiticide, and/or an endectoparasiticide. For example, such compounds include macrocyclic lactones such as avermectins or milbemycins e.g., ivermectin, pyratel or an insect growth regulator such as lufenuron or methoprene.

The compounds of the formula (I) can also be employed for controlling pests in crops of known genetically engineered plants or genetically engineered plants yet to be developed. As a rule, the transgenic plants are distinguished by especially advantageous properties, for example by resistances to particular crop protection agents, resistances to plant diseases or pathogens of plant diseases, such as particular insects or microorganisms such as fungi, bacteria or viruses. Other particular properties concern, for example, the harvested material with regard to quantity, quality, storage properties, composition and specific constituents. Thus, transgenic plants are known where the starch content is increased, or the starch quality is altered, or where the harvested material has a different fatty acid composition.

The use in economically important transgenic crops of useful plants and ornamentals is preferred, for example of cereals such as wheat, barley, rye, oats, millet, rice, cassava and maize or else crops of sugar beet, cotton, soya, oilseed rape, potatoes, tomatoes, peas and other types of vegetables.

When used in transgenic crops, in particular those which have resistances to insects, effects are frequently observed, in addition to the effects against pests to be observed in other crops, which are specific for application in the transgenic crop in question, for example an altered or specifically widened spectrum of pests

which can be controlled, or altered application rates which may be employed for application.

The invention therefore also relates to the use of compounds of the formula (I) for controlling pests in transgenic crop plants.

According to a further feature of the present invention there is provided a pesticidal composition comprising one or more compounds of the invention as defined above, in association with, and preferably homogeneously dispersed in one or more compatible pesticidally acceptable diluents or carriers and/or surface active agents [i.e. diluents or carriers and/or surface active agents of the type generally accepted in the art as being suitable for use in pesticidal compositions and which are compatible with compounds of the invention].

In practice, the compounds of the invention most frequently form parts of compositions. These compositions can be employed to control arthropods, especially insects and arachnids, such as mites, or helminths, such as plant nemathodes. The compositions may be of any type known in the art suitable for application to the desired pest in any premises or indoor or outdoor area. These compositions contain at least one compound of the invention as the active ingredient in combination or association with one or more other compatible components which are for example, solid or liquid carriers or diluents, adjuvants, surface-active-agents, or the like appropriate for the intended use and which are agronomically or medicinally acceptable. These compositions, which may be prepared by any manner known in the art, likewise form a part of this invention.

The compounds of the invention, in their commercially available formulations and in the use forms prepared from these formulations may be present in mixtures with other active substances such as insecticides, attractants, sterilants, acaricides, nematocides, fungicides, growth regulatory substances or herbicides

The pesticides include, for example, phosphoric esters, carbamates, carboxylic esters, formamidines, tin compounds and materials produced by microorganisms.

Preferred components in mixtures are:

1. from the group of the phosphorus compounds

acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-methyl, bromophos, bromophos-ethyl, cadusafos (F-67825), chlorethoxyphos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, demeton, demeton-S-methyl, demeton-S-methyl sulfone, dialifos, diazinon, dichlorvos, dicrotophos, dimethoate, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenitriothion, fensulfothion, fenthion, flupyrzofos, fonofos, formothion, fosthiazate, heptenophos, isazophos, isothioate, isoxathion, malathion, methacrifos, methamidophos, methidathion, salithion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, parathion, parathion-methyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosfolan, phosphocarb (BAS-301), phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos, pirimiphos-ethyl, pirimiphos-methyl, profenofos, propaphos, proetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridapenthion, quinalphos, sulprofos, temephos, terbufos, tebupirimfos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorphon, vamidothion;

2. from the group of the carbamates

alanycarb (OK-135), aldicarb, 2-sec-butylphenyl methylcarbamate (BPMC), carbaryl, carbofuran, carbosulfan, cloethocarb, benfuracarb, ethiofencarb, furathiocarb, HCN-801, isoprocarb, methomyl, 5-methyl-m-cumenylbutyryl (methyl)carbamate, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, 1-methylthio(ethylideneamino)-N-methyl-N-(morpholinothio)carbamate (UC 51717), triazamate;

3. from the group of the carboxylic esters

acrinathrin, allethrin, alphametrin, 5-benzyl-3-furylmethyl (E)- (1R)-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, beta-cyfluthrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, bioallethrin, bioallethrin ((S)-cyclopentylisomer), bioresmethrin, bifenthrin, (RS)-1-cyano-1-(6-phenoxy-2-pyridyl)methyl (1RS)-trans-3-(4-tert-butylphenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (NCI 85193), cycloprothrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cythithrin, cypermethrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenthrin, esfenvalerate, fenfluthrin, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate,

flumethrin, fluvalinate (D isomer), imiprothrin (S-41311), lambda-cyhalothrin, permethrin, phenothrin (@ isomer), prallethrin, pyrethrins (natural products), resmethrin, tefluthrin, tetramethrin, theta-cypermethrin, tralomethrin, transfluthrin, zeta-cypermethrin (F-56701);

4. from the group of the amidines

amitraz, chlordimeform;

5. from the group of the tin compounds

cyhexatin, fenbutatin oxide;

6. others

abamectin, ABG-9008, acetamiprid, acequinocyl, *Anagrapha falcitera*, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadirachtin, *Bacillus thuringiensis*, *Beauveria bassiana*, bensultap, bifenazate, binapacryl, BJL-932, bromopropylate, BTG-504, BTG-505, buprofezin, camphechlor, cartap, chlorobenzilate, chlorfenapyr, chlorfluazuron, 2-(4-chlorophenyl)-4,5-diphenylthiophene (UBI-T 930), chlorfentezine, chlorproxyfen, chromafenozide, clothianidine, 2-naphthylmethyl cyclopropanecarboxylate (Ro12-0470), cyromazin, diaclofen (thiamethoxam), diafenthiuron, DBI-3204, ethyl 2-chloro-N-(3,5-dichloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propyloxy)phenyl)carbamoyl)-2-carboximidate, DDT, dicofol, diflubenzuron, N-(2,3-dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylidine, dihydroxymethyldihydroxypyrrolidine, dinobuton, dinocap, diofenolan, emamectin benzoate, endosulfan, ethiprole (sulfethiprole), ethofenprox, etoxazole, fenazaquin, fenoxycarb, fipronil, fluazuron, flumite (flufenzine, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl)-4-methyl-1-pentyl)diphenyl ether (MTI 800), granulosis and nuclear polyhedrosis viruses, fenpyroximate, fenthioncarb, fluacrypyrim, flubenzimine, flubrocycythrinate, flucycloxuron, flufenoxuron, flufenzine, flufenprox, fluproxyfen, gamma-HCH, halfenozide, halofenprox, hexaflumuron (DE_473), hexythiazox, HOI-9004, hydramethylnon (AC 217300), IKI-220, indoxacarb, ivermectin, L-14165, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), kanemite (AKD-2023), lufenuron, M-020, M-020, methoxyfenozide, milbemectin, NC-196, neemgard, nidinoterfuran, nitenpyram, 2-nitromethyl-4,5-dihydro-6H-thiazine (DS

52618), 2-nitromethyl-3,4-dihydrothiazole (SD 35651), 2-nitromethylene-1,2-thiazinan-3-ylcarbamaldehyde (WL 108477), novaluron, piridaryl, propargite, protrifenbute, pymethroline, pyridaben, pyrimidifen, pyriproxyfen, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofen, silomadine (CG-177), spinosad, spirodiclofen, SU-9118, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tetradifon, tetrasul, thiacloprid, thiocyclam, thiamethoxam, tolfenpyrad, triazamate, triethoxyspinosyn A, triflumuron, verbutin, vertalec (mykotal), YI-5301.

The abovementioned components for combinations are known active substances, many of which are described in Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12th Edition, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

The effective use doses of the compounds employed in the invention can vary within wide limits, particularly depending on the nature of the pest to be eliminated or degree of infestation, for example, of crops with these pests. In general, the compositions according to the invention usually contain about 0.05 to about 95% (by weight) of one or more active ingredients according to the invention, about 1 to about 95% of one or more solid or liquid carriers and, optionally, about 0.1 to about 50% of one or more other compatible components, such as surface-active agents or the like. In the present account, the term "carrier" denotes an organic or inorganic ingredient, natural or synthetic, with which the active ingredient is combined to facilitate its application, for example, to the plant, to seeds or to the soil. This carrier is therefore generally inert and it must be acceptable (for example, agronomically acceptable, particularly to the treated plant).

The carrier may be a solid, for example, clays, natural or synthetic silicates, silica, resins, waxes, solid fertilizers (for example ammonium salts), ground natural minerals, such as kaolins, clays, talc, chalk, quartz, attapulgit, montmorillonite, bentonite or diatomaceous earth, or ground synthetic minerals, such as silica, alumina, or silicates especially aluminium or magnesium silicates. As solid carriers for granules the following are suitable: crushed or fractionated natural rocks such as calcite, marble, pumice, sepiolite and dolomite; synthetic granules of inorganic or

organic meals; granules of organic material such as sawdust, coconut shells, corn cobs, corn husks or tobacco stalks; kieselguhr, tricalcium phosphate, powdered cork, or absorbent carbon black; water soluble polymers, resins, waxes; or solid fertilizers. Such solid compositions may, if desired, contain one or more compatible wetting, dispersing, emulsifying or colouring agents which, when solid, may also serve as a diluent.

The carrier may also be liquid, for example: water; alcohols, particularly butanol or glycol, as well as their ethers or esters, particularly methylglycol acetate; ketones, particularly acetone, cyclohexanone, methylethyl ketone, methylisobutylketone, or isophorone; petroleum fractions such as paraffinic or aromatic hydrocarbons, particularly xylenes or alkyl naphthalenes; mineral or vegetable oils; aliphatic chlorinated hydrocarbons, particularly trichloroethane or methylene chloride; aromatic chlorinated hydrocarbons, particularly chlorobenzenes; water-soluble or strongly polar solvents such as dimethylformamide, dimethyl sulphoxide, or N-methylpyrrolidone; liquefied gases; or the like or a mixture thereof.

The surface-active agent may be an emulsifying agent, dispersing agent or wetting agent of the ionic or non-ionic type or a mixture of such surface-active agents.

Amongst these are e.g., salts of polyacrylic acids, salts of lignosulphonic acids, salts of phenolsulphonic or naphthalenesulphonic acids, polycondensates of ethylene oxide with fatty alcohols or fatty acids or fatty esters or fatty amines, substituted phenols (particularly alkylphenols or arylphenols), salts of sulphosuccinic acid esters, taurine derivatives (particularly alkyltaurates), phosphoric esters of alcohols or of polycondensates of ethylene oxide with phenols, esters of fatty acids with polyols, or sulphate, sulphonate or phosphate functional derivatives of the above compounds.

The presence of at least one surface-active agent is generally essential when the active ingredient and/or the inert carrier are only slightly water soluble or are not water soluble and the carrier agent of the composition for application is water.

Compositions of the invention may further contain other additives such as adhesives or colorants. Adhesives such as carboxymethylcellulose or natural or synthetic polymers in the form of powders, granules or lattices, such as arabic gum, polyvinyl alcohol or polyvinyl acetate, natural phospholipids, such as cephalins or lecithins, or synthetic phospholipids can be used in the formulations. It is possible to use

colorants such as inorganic pigments, for example: iron oxides, titanium oxides or Prussian Blue; organic dyestuffs, such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs or metal phthalocyanine dyestuffs; or trace nutrients such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum or zinc.

For their agricultural application, the compounds of the invention are therefore generally in the form of compositions, which are in various solid or liquid forms.

Solid forms of compositions which can be used are dusting powders (with a content of the compound of the invention, ranging up to 80%), wettable powders or granules (including water dispersible granules), particularly those obtained by extrusion, compacting, impregnation of a granular carrier, or granulation starting from a powder (the content of the compound of the invention, in these wettable powders or granules being between about 0.5 and about 80%). Solid homogenous or heterogenous compositions containing one or more compounds of the invention, for example granules, pellets, briquettes or capsules, may be used to treat standing or running water over a period of time. A similar effect may be achieved using trickle or intermittent feeds of water dispersible concentrates as described herein.

Liquid compositions, for example, include aqueous or non-aqueous solutions or suspensions (such as emulsifiable concentrates, emulsions, flowables, dispersions, or solutions) or aerosols. Liquid compositions also include, in particular, emulsifiable concentrates, dispersions, emulsions, flowables, aerosols, wettable powders (or powder for spraying), dry flowables or pastes as forms of compositions which are liquid or intended to form liquid compositions when applied, for example as aqueous sprays (including low and ultra-low volume) or as fogs or aerosols.

Liquid compositions, for example, in the form of emulsifiable or soluble concentrates most frequently comprise about 5 to about 80% by weight of the active ingredient, while the emulsions or solutions which are ready for application contain, in their case, about 0.01 to about 20% of the active ingredient. Besides the solvent, the emulsifiable or soluble concentrates may contain, when required, about 2 to about 50% of suitable additives, such as stabilizers, surface-active agents, penetrating agents, corrosion inhibitors, colorants or adhesives. Emulsions of any required concentration, which are particularly suitable for application, for example, to plants, may be obtained from these concentrates by dilution with water. These

compositions are included within the scope of the compositions which may be employed in the present invention. The emulsions may be in the form of water-in-oil or oil-in-water type and they may have a thick consistency.

The liquid compositions of this invention may, in addition to normal agricultural use applications be used for example to treat substrates or sites infested or liable to infestation by arthropods (or other pests controlled by compounds of this invention) including premises, outdoor or indoor storage or processing areas, containers or equipment or standing or running water.

All these aqueous dispersions or emulsions or spraying mixtures can be applied, for example, to crops by any suitable means, chiefly by spraying, at rates which are generally of the order of about 100 to about 1,200 liters of spraying mixture per hectare, but may be higher or lower (eg low or ultra-low volume) depending upon the need or application technique. The compound or compositions according to the invention are conveniently applied to vegetation and in particular to roots or leaves having pests to be eliminated. Another method of application of the compounds or compositions according to the invention is by chemigation, that is to say, the addition of a formulation containing the active ingredient to irrigation water. This irrigation may be sprinkler irrigation for foliar pesticides or it can be ground irrigation or underground irrigation for soil or for systemic pesticides.

The concentrated suspensions, which can be applied by spraying, are prepared so as to produce a stable fluid product which does not settle (fine grinding) and usually contain from about 10 to about 75% by weight of active ingredient, from about 0.5 to about 30% of surface-active agents, from about 0.1 to about 10% of thixotropic agents, from about 0 to about 30% of suitable additives, such as anti-foaming agents, corrosion inhibitors, stabilizers, penetrating agents, adhesives and, as the carrier, water or an organic liquid in which the active ingredient is poorly soluble or insoluble. Some organic solids or inorganic salts may be dissolved in the carrier to help prevent settling or as antifreezes for water.

The wettable powers (or powder for spraying) are usually prepared so that they contain from about 10 to about 80% by weight of active ingredient, from about 20 to about 90% of a solid carrier, from about 0 to about 5% of a wetting agent, from about 3 to about 10% of a dispersing agent and, when necessary, from about 0 to about

80% of one or more stabilizers and/or other additives, such as penetrating agents, adhesives, anti-caking agents, colorants, or the like. To obtain these wettable powders, the active ingredient is thoroughly mixed in a suitable blender with additional substances which may be impregnated on the porous filler and is ground using a mill or other suitable grinder. This produces wettable powders, the wettability and the suspendability of which are advantageous. They may be suspended in water to give any desired concentration and this suspension can be employed very advantageously in particular for application to plant foliage.

The "water dispersible granules (WG)" (granules which are readily dispersible in water) have compositions which are substantially close to that of the wettable powders. They may be prepared by granulation of formulations described for the wettable powders, either by a wet route (contacting finely divided active ingredient with the inert filler and a little water, e.g. 1 to 20% by weight, or with an aqueous solution of a dispersing agent or binder, followed by drying and screening), or by a dry route (compacting followed by grinding and screening).

The rates and concentrations of the formulated compositions may vary according to the method of application or the nature of the compositions or use thereof. Generally speaking, the compositions for application to control arthropod or plant nematode pests usually contain from about 0.00001% to about 95%, more particularly from about 0.0005% to about 50% by weight of one or more compounds of the invention, or of total active ingredients (that is to say the compounds of the invention, together with other substances toxic to arthropods or plant nematodes, synergists, trace elements or stabilizers). The actual compositions employed and their rate of application will be selected to achieve the desired effect(s) by the farmer, livestock producer, medical or veterinary practitioner, pest control operator or other person skilled in the art.

Solid or liquid compositions for application topically to animals, timber, stored products or household goods usually contain from about 0.00005% to about 90%, more particularly from about 0.001% to about 10%, by weight of one or more compounds of the invention. For administration to animals orally or parenterally, including percutaneously solid or liquid compositions, these normally contain from about 0.1% to about 90% by weight of one or more compounds of the invention.

Medicated feedstuffs normally contain from about 0.001% to about 3% by weight of one or more compounds of the invention. Concentrates or supplements for mixing with feedstuffs normally contain from about 5% to about 90%, preferably from about 5% to about 50%, by weight of one or more compounds of the invention. Mineral salt licks normally contain from about 0.1% to about 10% by weight of one or more compounds of formula (I) or pesticidally acceptable salts thereof.

Dusts or liquid compositions for application to livestock, goods, premises or outdoor areas may contain from about 0.0001% to about 15%, more especially from about 0.005% to about 2.0%, by weight, of one or more compounds of the invention.

Suitable concentrations in treated waters are between about 0.0001 ppm and about 20 ppm, more particularly about 0.001 ppm to about 5.0 ppm, of one or more compounds of the invention, and may be used therapeutically in fish farming with appropriate exposure times. Edible baits may contain from about 0.01% to about 5%, preferably from about 0.01% to about 1.0%, by weight, of one or more compounds of the invention.

When administered to vertebrates parenterally, orally or by percutaneous or other means, the dosage of compounds of the invention, will depend upon the species, age, or health of the vertebrate and upon the nature and degree of its actual or potential infestation by arthropod or helminth pests. A single dose of about 0.1 to about 100 mg, preferably about 2.0 to about 20.0 mg, per kg body weight of the animal or doses of about 0.01 to about 20.0 mg, preferably about 0.1 to about 5.0 mg, per kg body weight of the animal per day, for sustained medication, are generally suitable by oral or parenteral administration. By use of sustained release formulations or devices, the daily doses required over a period of months may be combined and administered to animals on a single occasion.

The following composition EXAMPLES 2A - 2M illustrate compositions for use against arthropods, especially mites or insects, or plant nematodes, which comprise, as active ingredient, compounds of the invention, such as those described in preparative examples. The compositions described in EXAMPLES 2A - 2M can each be diluted to give a sprayable composition at concentrations suitable for use in the field. Generic chemical descriptions of the ingredients (for which all of the

following percentages are in weight percent), used in the composition EXAMPLES 2A - 2M exemplified below, are as follows:

Trade Name	Chemical Description
Ethylan BCP	Nonylphenol ethylene oxide condensate
Soprophor BSU	Tristyrylphenol ethylene oxide condensate
Arylan CA	A 70% w/v solution of calcium dodecylbenzenesulfonate
Solvesso 150	Light C ₁₀ aromatic solvent
Arylan S	Sodium dodecylbenzenesulfonate
Darvan NO ₂	Sodium lignosulphonate
Celite PF	Synthetic magnesium silicate carrier
Sopropon T36	Sodium salts of polycarboxylic acids
Rhodigel 23	Polysaccharide xanthan gum
Bentone 38	Organic derivative of magnesium montmorillonite
Aerosil	Microfine silicon dioxide

EXAMPLE 2A

A water soluble concentrate is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	7%
Ethylan BCP	10%
N-methylpyrrolidone	83%

To a solution of Ethylan BCP dissolved in a portion of N-methylpyrrolidone is added the active ingredient with heating and stirring until dissolved. The resulting solution is made up to volume with the remainder of the solvent.

EXAMPLE 2B

An emulsifiable concentrate (EC) is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	25%(max)
Soprophor BSU	10%
Arylan CA	5%
N-methylpyrrolidone	50%
Solvesso 150	10%

The first three components are dissolved in N-methylpyrrolidone and to this is then added the Solvesso 150 to give the final volume.

EXAMPLE 2C

A wettable powder (WP) is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	40%
Arylan S	2%
Darvan NO ₂	5%
Celite PF	53%

The ingredients are mixed and ground in a hammer-mill to a powder with a particle size of less than 50 microns.

EXAMPLE 2D

An aqueous-flowable formulation is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	40.00%
Ethylan BCP	1.00%
Sopropon T360.	0.20%
Ethylene glycol	5.00%
Rhodigel 230.	0.15%
Water	53.65%

The ingredients are intimately mixed and are ground in a bead mill until a mean particle size of less than 3 microns is obtained.

EXAMPLE 2E

An emulsifiable suspension concentrate is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	30.0%
Ethylan BCP	10.0%
Bentone 38	0.5%
Solvesso 150	59.5%

The ingredients are intimately mixed and ground in a beadmill until a mean particle size of less than 3 microns is obtained.

EXAMPLE 2F

A water dispersible granule is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	30%
Darvan No 2	15%
Arylan S	8%
Celite PF	47%

The ingredients are mixed, micronized in a fluid-energy mill and then granulated in a rotating pelletizer by spraying with water (up to 10%). The resulting granules are dried in a fluid-bed drier to remove excess water.

EXAMPLE 2G

A dusting powder is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	1 to 10%
Talc powder-superfine	99 to 90%

The ingredients are intimately mixed and further ground as necessary to achieve a fine powder. This powder may be applied to a locus of arthropod infestation, for example refuse dumps, stored products or household goods or animals infested by, or at risk of infestation by, arthropods to control the arthropods by oral ingestion. Suitable means for distributing the dusting powder to the locus of arthropod infestation include mechanical blowers, handshakers or livestock self treatment devices.

EXAMPLE 2H

An edible bait is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	0.1 to 1.0%
Wheat flour	80%
Molasses	19.9 to 19%

The ingredients are intimately mixed and formed as required into a bait form. This edible bait may be distributed at a locus, for example domestic or industrial premises, e.g. kitchens, hospitals or stores, or outdoor areas, infested by arthropods, for example ants, locusts, cockroaches or flies, to control the arthropods by oral ingestion.

EXAMPLE 2I

A solution formulation is prepared with a composition as follows:

Active ingredient	15%
Dimethyl sulfoxide	85%

The active ingredient is dissolved in dimethyl sulfoxide with mixing and or heating as required. This solution may be applied percutaneously as a pour-on application to domestic animals infested by arthropods or, after sterilization by filtration through a polytetrafluoroethylene membrane (0.22 micrometer pore size), by parenteral injection, at a rate of application of from 1.2 to 12 ml of solution per 100 kg of animal body weight.

EXAMPLE 2J

A wettable powder is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

The Ethylan BCP is absorbed onto the Aerosil which is then mixed with the other ingredients and ground in a hammer-mill to give a wettable powder, which may be diluted with water to a concentration of from 0.001% to 2% by weight of the active compound and applied to a locus of infestation by arthropods, for example, dipterous larvae or plant nematodes, by spraying, or to domestic animals infested by, or at risk of infection by arthropods, by spraying or dipping, or by oral administration in drinking water, to control the arthropods.

EXAMPLE 2K

A slow release bolus composition is formed from granules containing the following components in varying percentages(similar to those described for the previous compositions) depending upon need:

Active ingredient
Density agent
Slow-release agent
Binder

The intimately mixed ingredients are formed into granules which are compressed into a bolus with a specific gravity of 2 or more. This can be administered orally to ruminant domestic animals for retention within the reticulo-rumen to give a continual slow release of active compound over an extended period of time to control infestation of the ruminant domestic animals by arthropods.

EXAMPLE 2L

A slow release composition in the form of granules, pellets, brickettes or the like can be prepared with compositions as follows:

Active ingredient 0.5 to 25%
Polyvinyl chloride 75 to 99.5%
Dioctyl phthalate (plasticizer)

The components are blended and then formed into suitable shapes by melt-extrusion or molding. These composition are useful, for example, for addition to standing water or for fabrication into collars or eartags for attachment to domestic animals to control pests by slow release.

EXAMPLE 2M

A water dispersible granule is prepared with the composition as follows:

Active ingredient	85%(max)
Polyvinylpyrrolidone	5%
Attapulgate clay	6%
Sodium lauryl sulfate	2%
Glycerine	2%

The ingredients are mixed as a 45% slurry with water and wet milled to a particle size of 4 microns, then spray-dried to remove water.

METHODS OF PESTICIDAL USE

The following representative test procedures, using compounds of the invention, were conducted to determine the parasiticial and pesticidal activity of compounds of the invention.

METHOD A: Screening method to test systemicity of compounds against *Ctenocephalides felis* (Cat flea)

A test container was filled with 10 adults of *Ctenocephalides felis*. A glass cylinder was closed on one end with parafilm and placed on top of the test container. The test compound solution was then pipetted into bovine blood and added to the glass cylinder. The treated *Ctenocephalides felis* were held in this artificial dog test (blood 37 °C, 40-60 % relative humidity; *Ctenocephalides felis* 20-22°C, 40-60 % relative humidity) and assessment performed at 24 and 48 hours after application.

Active compounds gave at least 90% control of *Ctenocephalides felis* at a test concentration of 5ppm or less.

METHOD B: *Diabrotica undecimpunctata* (southern corn rootworm) screen

Two days before application, seeds of maize were soaked in water under warm conditions to elicit fast germination. One day before application, eggs of *Diabrotica undecimpunctata* were transferred to one half of a Japanese filter paper placed in a plastic petri dish. Afterwards, a sprouted maize seed was placed on a moistened pad beside the filter paper. Three drops of 200 microlitres of test compound solution were carefully pipetted onto the egg. The remainder of the solution was placed on the maize and then the Petri dish was closed. The treated eggs in the Petri dishes were held in a climate chamber for 6 days. The compound efficacy (percentage of dead eggs and/or larvae in comparison to untreated control) was assessed 6 days after application using a binocular microscope.

Active compounds gave at least 90% control of *Diabrotica undecimpunctata* at a test concentration of 10ppm.

METHOD C: *Nephotettix Cinciceps* (rice leafhopper) screen

The leaves of 12 rice plants having a stem length of 8 cm were dipped for 5 seconds into an aqueous solution of the formulated test compound. After the solution had run off, the rice plants treated in this manner were placed in a Petri dish and populated with about 20 larvae (L3 stage) of *Nephotettix cincticeps*. The Petri dish was closed and then stored in a climate chamber (16 hours of light/day, 25°C, 40-60% relative humidity). After 6 days storage, the percentage mortality of leafhopper larvae was determined.

Active compounds gave at least 98% mortality of *Nephotettix cincticeps* larvae at a test concentration of 100 ppm.

METHOD D: Screening method to test contact activity against *Ctenocephalides felis* (Cat flea)

Solutions of the test compounds were dropped onto filter paper, dried and the filter paper placed into test tubes and infested with 10 adults of *Ctenocephalides felis*. The treated *Ctenocephalides felis* were held in a climate chamber (26°C, 80% RH) and the percentage efficacy assessed 24 hours and 48 hours after application in comparison with the untreated control.

Active compounds gave at least 70% contact control of *Ctenocephalides felis* at a test concentration of 1000 ppm.

METHOD E Screening method to test contact activity against *Rhipicephalus sanguineus* (Brown dog tick)

Solutions of the test compounds were dropped onto filter paper, dried and the filter paper placed into test tubes and infested with 20-30 larvae (L1) of *Rhipicephalus sanguineus* and the tubes closed with a clip. The treated *Rhipicephalus sanguineus* were held in a climate chamber (25°C, 90% RH) and the percentage efficacy assessed 24 hours after application in comparison with the untreated control.

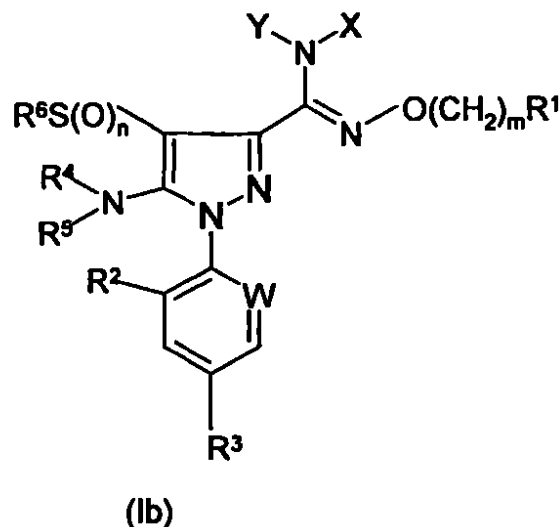
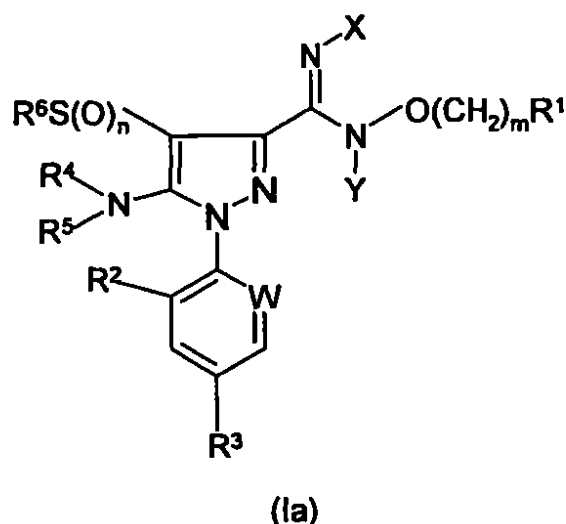
Active compounds gave at least 70% contact control of *Rhipicephalus sanguineus* at a test concentration of 100 ppm.

The following Compound numbers were active in one or more of the above tests:

1-49, 3-25, 4-82, 4-93, 4-101, 4-114, 4-115, 4-117, 4-121, 4-128, 4-136, 4-144, 4-152, 4-153, 5-1, 6-2, 6-42, 7-1, 7-127

CLAIMS

1. A compound of formula (Ia) or (Ib):



wherein:

R¹ is aryl unsubstituted or substituted by one or more R¹⁵ radicals; or is R¹⁰ or R¹⁹;
 X and Y are each independently H, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-haloalkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-haloalkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, CONR⁷R⁸, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸, SO₂R¹³ or COR¹⁷; or (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more R¹¹ radicals;

W is N, C-CH₃ or C-halogen;

R² is hydrogen, CH₃ or halogen;

R³ is halo, (C₁-C₃)-alkyl, (C₁-C₃)-haloalkyl, (C₁-C₃)-haloalkoxy, S(O)_p-(C₁-C₃)-haloalkyl or SF₅;

R⁴ is H, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-haloalkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₆)-haloalkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, -CO₂-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₃-C₆)-alkenyl, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸ or COCH₂O-(C₁-C₄)-alkyl; or (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more R¹¹ radicals;

R⁵ is H, (C₂-C₆)-alkynyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl or -SO₂R¹²; or (C₁-C₆)-alkyl, (C₂-C₆)-alkenyl or CO-(C₁-C₆)-alkyl which last three mentioned groups are unsubstituted or substituted by one or more R¹¹ radicals;

R^6 and R^{13} are each independently (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-haloalkenyl, (C₂-C₆)-alkynyl, (C₂-C₆)-haloalkynyl or (C₃-C₇)-cycloalkyl;

R^7 is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³ and NR⁹R¹⁴;

R^8 is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, -(CH₂)_qR⁷ or -(CH₂)_qR¹⁰;

R^9 and R^{14} are each independently H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl or -(C₁-C₄)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl; or

R^8 and R^9 together with the attached N atom form a five- or six-membered saturated ring which optionally contains an additional hetero atom in the ring which is selected from O, S and N, the ring being unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl and halogen;

R^{10} is heterocyclyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₄)-alkyl, (C₁-C₄)-haloalkyl, (C₁-C₄)-alkoxy, S(O)_pR¹³, OH and oxo;

R^{11} is halogen, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₇)-cycloalkyl, S(O)_pR¹³, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, -O(C=O)-(C₁-C₆)-alkyl, CO-(C₁-C₆)-alkyl, CO-(C₁-C₆)-haloalkyl, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³ or OR¹⁰;

R^{12} is (C₃-C₇)-cycloalkyl, (C₂-C₆)-alkenyl, (C₂-C₆)-haloalkenyl or R¹⁰; or phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from R¹⁵; or is (C₁-C₆)-alkyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, (C₃-C₆)-alkenyloxy, (C₃-C₆)-haloalkenyloxy, (C₃-C₆)-alkynyloxy, (C₃-C₆)-haloalkynyloxy, (C₃-C₇)-cycloalkyl, S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹³, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹⁴, NR⁸SO₂R¹³, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹⁶, R¹⁰ and CO₂R⁸;

R^{15} is halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, R⁷, SF₅, OH, OR⁷, R¹⁸, OR¹⁸, SO₃H or (C₁-C₆)-alkylideneimino;

R^{16} is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-

haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, SO₃H and (C₁-C₆)-alkylideneimino;

R¹⁷ is (C₁-C₆)-alkyl which is substituted by (C₁-C₆)-alkoxy, S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl or S(O)_p-(C₁-C₆)-haloalkyl,

R¹⁸ is a heteroaromatic radical selected from the group consisting of pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, thienyl, thiazolyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl and triazolyl, which groups are unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl and (C₁-C₆)-alkoxy;

R¹⁹ is a heteroaromatic radical selected from the group consisting of pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, thienyl, thiazolyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl and triazolyl, which is unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl and (C₁-C₆)-alkoxy, and which heteroaromatic radical is substituted by R⁷, R¹⁸ or OR⁷;

m is 1 or 2;

n and p are each independently zero, one or two;

q is zero or one; and

each heterocyclyl in the above-mentioned radicals is independently a heterocyclic radical having 3 to 6 ring atoms and 1, 2 or 3 hetero atoms in the ring selected from the group consisting of N, O and S;

or a pesticidally acceptable salt thereof.

2. A compound or a salt thereof as claimed in claim 1 wherein R¹ is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from the group consisting of halogen, (C₁-C₆)-alkyl, (C₁-C₆)-haloalkyl, (C₁-C₆)-alkoxy, (C₁-C₆)-haloalkoxy, CN, NO₂, S(O)_pR¹³, NR⁸R⁹, COR¹³ and CONR⁸R⁹; and in which R⁸ and R⁹ are each independently H or (C₁-C₆)-alkyl, or R⁸ and R⁹ together with the attached N atom form a five- or six-membered saturated ring which optionally contains an additional hetero atom in the ring which is selected from O, S and N, the ring being unsubstituted or substituted by one or more (C₁-C₃)-alkyl radicals; and R¹³ is (C₁-C₃)-alkyl or (C₁-C₃)-haloalkyl.

3. A compound or a salt thereof as claimed in claim 1 or 2 wherein X and Y are each independently H, (C₁-C₆)-alkyl or CO(C₁-C₆)-alkyl.
4. A compound or a salt thereof as claimed in claim 1, 2 or 3 wherein W is C-Cl.
5. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 4 wherein R² is Cl.
6. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 5 wherein R³ is CF₃.
7. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 6 wherein R⁴ is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl, COCH₂O(C₁-C₄)-alkyl, -(C₁-C₆)-alkyl-S(O)_p-(C₁-C₆)-alkyl or -CH₂R⁷, in which R⁷ is phenyl unsubstituted or substituted by one or more radicals selected from halogen, (C₁-C₃)-alkyl, (C₁-C₃)-haloalkyl, (C₁-C₃)-alkoxy, (C₁-C₃)-haloalkoxy, CN, NO₂ and S(O)_pR¹³, and R¹³ is (C₁-C₃)-alkyl or (C₁-C₃)-haloalkyl.
8. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 7 wherein R⁵ is H, (C₁-C₆)-alkyl, (C₃-C₆)-alkenyl, (C₃-C₆)-alkynyl, (C₃-C₇)-cycloalkyl, -CO₂-(C₁-C₆)-alkyl or -(C₁-C₆)-alkyl-(C₃-C₇)-cycloalkyl.
9. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 8 wherein R⁶ is CF₃.
10. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 9 wherein m is 1.
11. A compound or a salt thereof as claimed in any one of claims 1 to 10 wherein R¹ is phenyl;

46
47

X and Y are each independently H, methyl or acetyl;

W is C-Cl;

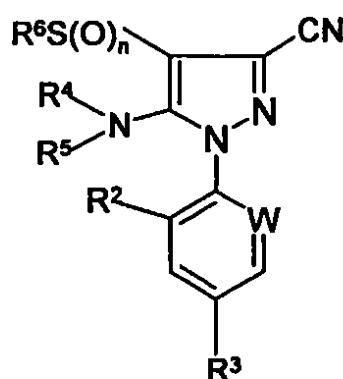
R² is Cl;

R³ and R⁶ are each CF₃;

R⁴ and R⁵ are each independently H, methyl, ethyl, allyl, propargyl, cyclopropyl, benzyl, cyclopropylmethyl, methylthioethyl, ethoxyacetyl or ethoxycarbonyl; and m is 1.

12. A process for the preparation of a compound of formula (I) or a salt thereof as defined in any one of claims 1 to 11, which process comprises:

a) where (I) is a formula (Ia), X is H, m and R¹ are as defined in claim 1, Y is as defined in claim 1 with the exclusion of H, and the other symbols are as defined in claim 1, reacting a compound of formula (II):



(II)

wherein R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W and n are as defined in claim 1, with a compound of formula (III):

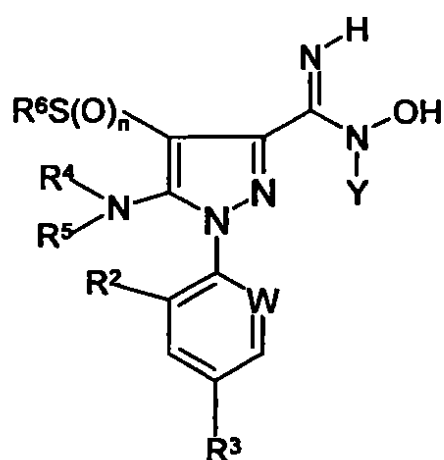


(III)

wherein R¹ and m are as defined in claim 1 and Y is as defined in claim 1 with the exclusion of H; or

b) where (I) is a formula (Ia), X is H, m and R¹ are as defined in claim 1, Y is as defined in claim 1 with the exclusion of H, and the other symbols are as defined in claim 1, reacting a compound of formula (IV):

74



(IV)

wherein the various symbols are as defined in claim 1, with a compound of formula (V):



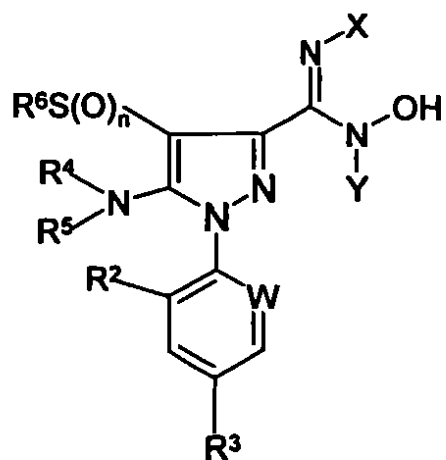
wherein R^1 and m are as defined in claim 1 and L is a leaving group; or

c) where (I) is a formula (Ia), X is as defined in claim 1 with the exclusion of H , and the other symbols are as defined in claim 1, the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ia) wherein X is H , using a compound of formula (VI):



wherein X is as defined in claim 1 with the exclusion of H and L^1 is a leaving group; or

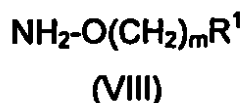
d) where (I) is a formula (Ia), X , Y and the other symbols are as defined in claim 1, the reaction of a compound of formula (VII):



(VII)

wherein the various symbols are as defined in claim 1, with a compound of formula (V) as defined above; or

e) where (I) is a formula (Ib), X and Y are each H, and m, R¹ and the other symbols are as defined in claim 1, the reaction of a compound of formula (II) as defined in claim 1, with a compound of formula (VIII):



wherein R¹ and m are as defined in claim 1; or

f) where (I) is a formula (Ib), X is H, Y is as defined in claim 1 with the exclusion of H, and the other symbols are as defined in claim 1, the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ib) wherein Y is H, using a compound of formula (IX):



wherein Y is as defined in claim 1 with the exclusion of H and L² is a leaving group; or

g) where (I) is a formula (Ib), X and Y are as defined in claim 1 with the exclusion of H, and the other symbols are as defined in claim 1, the alkylation, acylation or sulfonylation of the corresponding compound of formula (Ib) wherein X is H, using a compound of formula (VI) as defined in claim 1; or

h) where R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W, X, Y and m are as defined in claim 1, and n is 1 or 2, oxidising a corresponding compound in which n is 0 or 1; and

i) if desired, converting a resulting compound of formula (I) into a pesticidally acceptable salt thereof.

13. A pesticidal composition comprising a compound of formula (I) or a pesticidally acceptable salt thereof as defined in any one of claims 1 to 11, in association with a pesticidally acceptable diluent or carrier and/or surface active agent.

14. The use of a compound of formula (I) or a salt thereof according to any one of claims 1 to 11 or of a composition according to claim 13, for the preparation of a veterinary medicament.

15. The use of a compound of formula (I) or a salt thereof according to any one of claims 1 to 11 or of a composition according to claim 13, for the preparation of a veterinary medicament for controlling pests.

16. A method for the control of pests at a locus which comprises the application of an effective amount of a compound of formula (I) or a salt thereof as claimed in any of claims 1 to 11 or of a composition as claimed in claim 13.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/12620

A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D231/44 A01N43/56 C07D401/12 C07D403/12 C07D409/12
C07D405/12 C07D417/12

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)

EPO-Internal

C DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document with indication where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
X	WO 97 28126 A (AKAYAMA ATSUO, KANDO YASUYUKI (JP); KIJJI TOSHIYUKI (JP), NOGUCHI M) 7 August 1997 (1997-08-07) cited in the application claim 1, examples	1-16
X	WO 98 28278 A (RHONE-POULENC AGROCHIMIE) 2 July 1998 (1998-07-02) cited in the application claim 1; examples	1-16

☐ 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
- *A* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

9 February 2004

Date of mailing of the international search report

18/02/2004

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office P.B. 5816 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel (+31-70) 340-2040 Tx 31 651 epo nl
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

De Jong, B

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/12620

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9728126	A	07-08-1997	AT 227269 T	15-11-2002
			AU 1555797 A	22-08-1997
			BR 9707473 A	27-07-1999
			CN 1210518 A	10-03-1999
			DE 69716880 D1	12-12-2002
			DE 69716880 T2	17-07-2003
			EP 0879229 A1	25-11-1998
			ES 2187751 T3	16-06-2003
			JP 10152476 A	09-06-1998
			WO 9728126 A1	07-08-1997
			US 6316477 B1	13-11-2001
WO 9828278	A	02-07-1998	AP 1039 A	23-01-2002
			AT 224877 T	15-10-2002
			AU 745770 B2	28-03-2002
			AU 5759998 A	17-07-1998
			BG 103591 A	30-11-2000
			BR 9714187 A	29-02-2000
			CN 1316424 A	10-10-2001
			CN 1245492 A , B	23-02-2000
			CZ 9902283 A3	17-11-1999
			DE 69715911 D1	31-10-2002
			DE 69715911 T2	28-05-2003
			DK 948485 T3	03-02-2003
			EA 3186 B1	27-02-2003
			EE 9900322 A	15-06-2000
			EG 21703 A	27-02-2002
			WO 9828278 A1	02-07-1998
			EP 0948485 A1	13-10-1999
			ES 2179386 T3	16-01-2003
			HR 970704 A1	31-10-1998
			HU 0000482 A2	28-06-2000
			ID 19261 A	28-06-1998
			JP 2001507002 T	29-05-2001
			NZ 336419 A	30-03-2001
			PL 334282 A1	14-02-2000
			SK 85999 A3	16-05-2000
			TR 9901472 T2	22-11-1999
			TW 476757 B	21-02-2002
			US 2003144251 A1	31-07-2003
			US 2002045758 A1	18-04-2002
			US 6350771 B1	26-02-2002
			ZA 9711534 A	24-06-1998

(12) Solicitud Internacional publicada según el Tratado de Cooperación Internacional en Matena de Patentes (PCT)

(19) Organización Mundial para la Propiedad Intelectual
Oficina Internacional

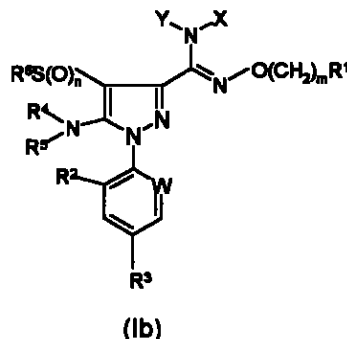
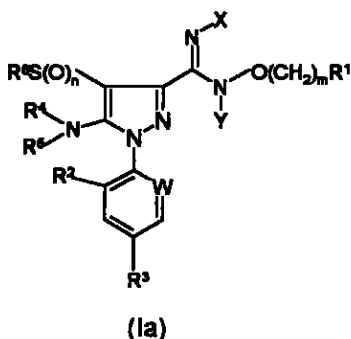
(43) Fecha de Publicación Internacional:
17 Junio 2004 (17.06 2004)

(10) Número de publicación Internacional
WO 2004/050633 A1

PCT

(51) Clasificación Internacional de Patentes ⁷ C07D 231/44 A01N 43/58, C07D, 401/12, 403/12, 409/12, 405/12, 417/12	Schwalbenweg 9, 65719 Hofheim Ts (DE)
(21) Expediente Internacional PCT/EP2003/012820	(74) Agente: RIPPEL, Hans, Christoph, Bayer CropScience GmbH, Patent- und Lizenzabteilung, Industriepark Höchst, Gebäude K 607, 65926 Frankfurt (DE)
(22) Fecha de solicitud internacional 12 Noviembre 2003 (12 11 2003)	(81) Estados designados (nacional) AE, AG, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BR, BY, BZ, CA, CN, CO, CR, CU, DM, DZ, EC, EG, GD, GE, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, RU, SC, SG, SY, TJ, TM, TN, TT, UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA
(25) Idioma de solicitud Inglés	(84) Estados designados (regional) patentes ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), patentes euroasiáticas (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), patentes europeas (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), patentes OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
(26) Idioma de publicación Inglés	Publicado - sin informe internacional de Búsqueda
(30) Datos de prioridad 02027084 1 3 Diciembre 2002 (03 12 2002) EP	Para códigos con dos letras y otras abreviaturas consulte las "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparece al principio de cada edición regular del boletín PCT
(71) Solicitante (para todos los estados designados excepto US) BAYER CROPSCIENCE S.A [FR/FR], 55, avenue Roné Cassin, F-69009 Lyon (FR)	
(72) Inventor, y (75) Inventor/Solicitante (sólo para US) DÖLLER, Uwe [DE/DE], Christian-Morgenstern-Strasse 11, 63110 Rodgau (DE) HOBALD, Klaus, Dieter [DE/DE], Kolwitzweg 29, 64546 Mörfelden-Waldorf (DE) MAIER, Michael [DE/DE], Neu Zeilsheim 78, 65931 Frankfurt am Main (DE) KUHLMANN, Anke [DE/DE], Bern 12, 42799 Leichlingen (DE) SEEGER, Karl [DE/DE],	

(54) Título: Derivados plaguicidas de 1-aril-3-amidoxima-pirazoles



(57) Resumen Derivados de 1-arilpirazol-amidoximas sustituidas en la posición 3, de la fórmula (Ia) o (Ib), o sus sales en las que los diversos símbolos son como se han definido en la memoria descriptiva, y composiciones plaguicidas de ellos, procedimientos para su preparación, y su uso para la represión de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos)

Memoria Descriptiva

Composiciones de Materia Plaguicidas

5 El invento se refiere a derivados de 1-arilpirazol-amidoximas sustituidas en la posición 3, a procedimientos para su preparación, a sus composiciones, y a su uso para la represión de plagas tales como artrópodos (inclusive insectos y arácnidos) y helmintos (inclusive nematodos) perjudiciales

La represión de insectos, arácnidos o helmintos con compuestos de 1-arilpirazoles ha sido descrita, por ejemplo, en los números de publicaciones de patentes internacionales WO 93/06089, WO 94/21606, WO 87/03781, de patentes europeas EP 0295117, EP 659745, EP 679650, EP 201852 y de patentes de los EE.UU U.S. 5.232 940. La represión de parásitos en animales con compuestos de 1-arilpirazoles ha sido descrita también en los números de publicaciones de patentes WO 15 00/35884, EP 0846686, WO 98/24769 y WO 97/28126.

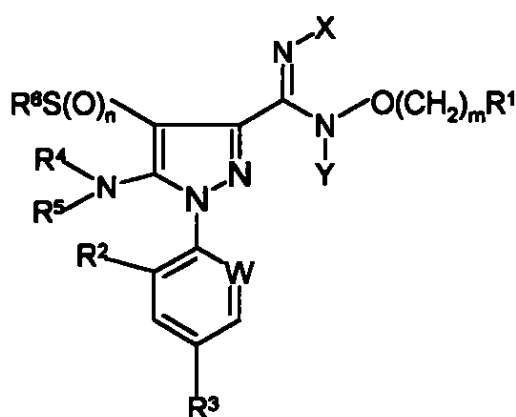
En particular, los documentos WO 98/28278 y WO 97/28126 describen ciertos 1-arilpirazol-amidoximas sustituidas en la posición 3 así como otros compuestos afines, pero no se mencionan específicamente en ellos compuestos de amidoximas sustituidos con bencilo ni sustituidos con radicales heterocíclicos, ni tampoco se 20 sugiere que ellos puedan ser también útiles como plaguicidas.

Sin embargo, el nivel de acción y/o la duración de la acción de estos compuestos de la técnica anterior no son enteramente satisfactorios en todos los campos de aplicación, en particular contra ciertos organismos o cuando se aplican bajas 25 concentraciones.

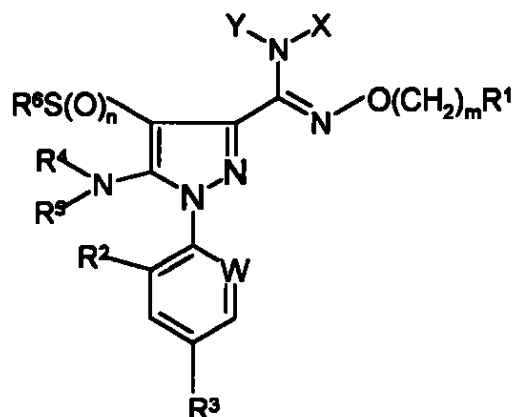
Puesto que los modernos plaguicidas deben satisfacer una amplia gama de demandas, por ejemplo en lo que se refiere al nivel, la duración y el espectro de acción, el espectro de usos, la toxicidad, la combinación con otras sustancias 30 activas, la combinación con agentes auxiliares de formulación o la síntesis, y puesto que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de tales sustancias jamás se podrá considerar como terminado, y hay constantemente una demanda de

nuevos compuestos que sean ventajosos con respecto a los compuestos conocidos, al menos siempre que estén implicados algunos aspectos

El presente invento proporciona un compuesto que es un derivado de 1-anlpirazol-
5 amidoxima sustituida en la posición 3 de la fórmula (Ia) o (Ib)



(Ia)



(Ib)

en las que:

R¹ es anlo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹⁵; o es R¹⁰ ó R¹⁹,

10 X e Y son, cada uno independientemente, H, alquenilo (C₃-C₆), haloalquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), haloalquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CONR⁷R⁸, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸, SO₂R¹³ ó COR¹⁷, o alquilo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹¹,

15 W es N, C-CH₃ ó C-halógeno,

R² es hidrógeno, CH₃ o halógeno;

R³ es halo, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), S(O)_p-haloalquilo (C₁-C₃) ó SF₅,

R⁴ es H, alquenilo (C₃-C₆), haloalquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), haloalquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), -CO₂-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquenilo (C₃-C₆), -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁸ ó COCH₂O-alquilo (C₁-C₄); o alquilo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹¹,

20

- R^5 es H, alquinilo (C_2-C_6), $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) ó $-SO_2R^{12}$; o alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6) cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{11} ;
- R^6 y R^{13} son, cada uno independientemente, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6), haloalquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), haloalquinilo (C_2-C_6) o cicloalquilo (C_3-C_7);
- R^7 es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^8R^{14} ,
- R^8 es H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7), $-(CH_2)_qR^7$ ó $-(CH_2)_qR^{10}$;
- R^9 y R^{14} son, cada uno independientemente, H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) o -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7); o
- R^8 y R^9 conjuntamente con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene en el anillo un heteroátomo adicional que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y halógeno;
- R^{10} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), $S(O)_pR^{13}$, OH y oxo;
- R^{11} es halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_pR^{13}$, $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), $-O(C=O)$ -alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6), CO-haloalquilo (C_1-C_6), NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, CN, NO_2 , OR^7 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$ ó OR^{10} ;
- R^{12} es cicloalquilo (C_3-C_7), alquenilo (C_2-C_6), haloalquenilo (C_2-C_6) o R^{10} , o fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre R^{15} ; o es alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), haloalqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), haloalquiniloxi (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_pR^7$, $S(O)_pR^{10}$, $S(O)_pR^{13}$, CN, NO_2 , OH, COR^8 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$, $CONR^8R^9$, NR^8R^9 , OR^7 , OR^{10} , R^{16} , R^{10} y CO_2R^8 ;

JS
SA

R^{15} es halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN , NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, R^7 , SF_5 , OH , OR^7 , R^{18} , OR^{18} , SO_3H o alquiliden (C_1-C_6)-imino,

- 5 R^{16} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN , NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH , SO_3H y alquiliden (C_1-C_6)-imino,

R^{17} es alquilo (C_1-C_6) que está sustituido con alcoxi (C_1-C_6), $S(O)_p$ -alquilo (C_1-C_6) o $S(O)_p$ -haloalquilo (C_1-C_6);

- 10 R^{18} es un radical heteroaromático seleccionado entre el conjunto que consiste en pindilo, pinmidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, funilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6);

- 15 R^{19} es un radical heteroaromático seleccionado entre el conjunto que consiste en piridilo, pirimidinilo, pindazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, funilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que
- 20 consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6), y cuyo radical heteroaromático está sustituido con R^7 , R^{18} ó OR^7 ;

m es 1 ó 2,

n y p son, cada uno independientemente, cero, uno o dos;

q es cero o uno, y

- 25 cada heterocíclo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S;

o una de sus sales aceptables como plaguicidas.

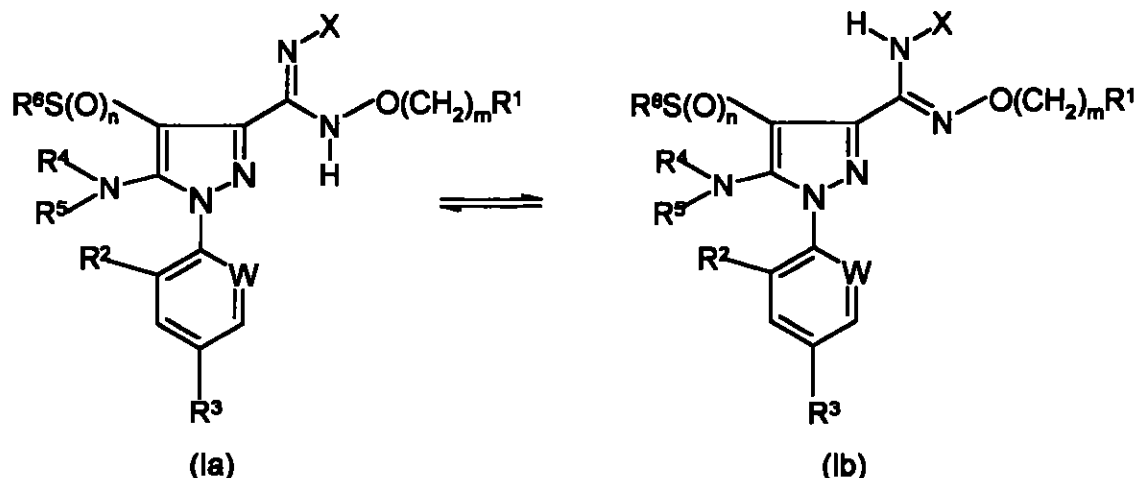
Estos compuestos poseen valiosas propiedades plaguicidas

30

El invento abarca también cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y sus mezclas.

54
55

Los compuestos de las fórmulas (Ia) y (Ib) en las que Y es H pueden existir en unas formas tautómeras, como se muestran seguidamente:



- 5 Dicha tautomería es bien conocida y se describe en la cita de S.Patai (The Chemistry of Functional Groups: Amidines and Imidates [La Química de Grupos Funcionales: Amidinas e Imidatos, Volumen 2, 1991, páginas 276-277). Se entenderá que todas estas formas tautómeras están abarcadas por el presente invento.
- 10 Por el término "sales aceptables como plaguicidas" se entienden las sales cuyos aniones o cationes son conocidos y están aceptados en la técnica para la formación de sales para su uso como plaguicidas
Apropiadas sales con bases, p ej. formadas por compuestos de la fórmula (I) que contienen un grupo de ácido carboxílico, incluyen sales de metales alcalinos (p ej. sodio y potasio), metales alcalino-térreos (p ej. calcio y magnesio), amonio y aminas (p ej. dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y dioctilmetilamina).
- 15 Apropiadas sales por adición de ácidos, p ej formadas por compuestos de la fórmula (I) que contienen un amino grupo, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo hidrocloruros, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos
- 20 por ejemplo ácido acético

Ha de entenderse que la condición antes mencionada se incluye solamente por razones de la inestabilidad química de las moléculas excluidas particulares, y no por razones de la técnica anterior

56

En la presente memoria descriptiva de patente, inclusive las reivindicaciones anejas, los sustituyentes antes mencionados tienen los siguientes significados

Un átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

El término "halo" situado delante del nombre de un radical significa que este radical

- 5 está parcial o completamente halogenado, es decir, sustituido con F, Cl, Br ó I, en cualquier combinación, preferiblemente con F ó Cl.

Los grupos alquilo y las porciones de ellos (a menos que se defina otra cosa distinta) pueden ser de cadena lineal o ramificada

- 10 La expresión "alquilo (C₁-C₆)" se ha de entender que significa un radical hidrocarbilo sin ramificar o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono, tal como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o terc.-butilo.

Los radicales alquilo y también en grupos compuestos, a menos que se defina otra cosa distinta, tienen preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

- 15 Un "haloalquilo (C₁-C₆)" significa un grupo alquilo mencionado dentro de la expresión "alquilo (C₁-C₆)" en el que uno o más átomos de hidrógeno está(n) reemplazado(s) por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes, tales como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ ó CH₂CH₂Cl.

- 20 La expresión "alquilenos (C₁-C₁₂)" se ha de entender como que significa una cadena de carbonos, saturada, sin ramificar o ramificada, que tiene de 1 a 12 átomos de carbono.

La expresión "haloalquilenos (C₁-C₁₂)" se ha de entender como que significa una cadena de carbonos, saturada, sin ramificar o ramificada, que tiene de 1 a 12

- 25 átomos de carbono, en el que uno o más átomos de hidrógeno está(n) reemplazado(s) por el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes

La expresión "alquilenos (C₂-C₁₂)" se ha de entender como que significa una cadena de carbonos, saturada, sin ramificar o ramificada, que tiene de 2 a 12 átomos de carbono, y que contiene por lo menos un doble enlace que puede estar

- 30 situado en cualquier posición del respectivo radical insaturado.

Un "alcoxi (C₁-C₆)" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbonos tiene el significado dado dentro de la expresión "alquilo (C₁-C₆)". Un "haloalcoxi" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ ó OCH₂CH₂Cl.

- Un "alquenilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos, no cíclica, sin ramificar o ramificada, que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo señalado y que contiene por lo menos un doble enlace que puede estar situado en cualquier posición del respectivo radical insaturado. Un "alquenilo (C₂-C₆)" designa correspondientemente, por ejemplo, al grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o hexenilo.
- 10 Un "alquinilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos, no cíclica, sin ramificar o ramificada, que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo señalado y que contiene un triple enlace que puede estar situado en cualquier posición del respectivo radical insaturado. Un "alquinilo (C₂-C₆)" designa correspondientemente, por ejemplo, al grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butenilo o 3-butenilo.

Los grupos cicloalquilo tienen preferiblemente de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos con halógeno o alquilo.

En compuestos de la fórmula (I) se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales

- 20 Un ejemplo de alquilo sustituido con cicloalquilo es ciclopropilmetilo;
un ejemplo de alquilo sustituido con alcoxi es metoximetilo (CH₃OCH₂-); y
un ejemplo de alquilo sustituido con alquiltio es metiltiometilo (CH₃SCH₂-).
Un anillo es un sistema aromático mono- o bicíclico, por ejemplo fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo y otros similares, preferiblemente fenilo
- 25 Un grupo "heterociclilo" puede ser saturado, insaturado o heteroaromático; preferiblemente contiene uno o más, en particular 1, 2 ó 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S; es preferiblemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático que tiene 5 ó 6 átomos de anillo. El radical
- 30 heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical o anillo heteroaromático (heteroarilo) tal como, por ejemplo, un sistema aromático mono-, bi- o poli-cíclico en el que por lo menos 1 anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo piridilo,

pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, triadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y tnazolilo, o es un radical hidrogenado total o parcialmente tal como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. El grupo "heterociclilo" puede estar sin sustituir o sustituido con uno o más radicales (preferiblemente 1, 2 ó 3 radicales) seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamilo, mono- y di-alquilaminocarbonilo, amino sustituido tal como acilamino, mono- y di-alquilamino, y alquilsulfinilo, haloalquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilo y haloalquilo, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo puede también estar presente en aquellos heteroátomos de anillo en los que son posibles varios números o índices de oxidación, por ejemplo en el caso de N y S.

15

El término plagas significa plagas de artrópodos (inclusive de insectos y arácnidos), y de helmintos (inclusive de nematodos)

Se prefieren compuestos de la fórmula (Ib).

20 Preferiblemente R^1 es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} y $CONR^8R^9$; (más preferiblemente R^1 es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^8R^9); y en que preferiblemente R^8 y R^9 son, cada uno independientemente, H o alquilo (C_1-C_6), o R^8 y R^9 conjuntamente con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene en el anillo un heteroátomo adicional que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales alquilo (C_1-C_3), y R^{13} es alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3)

25

30

Preferiblemente X e Y son, cada uno independientemente, H, alquilo (C₁-C₆) o CO-alquilo (C₁-C₆)

Preferiblemente W es C-Cl.

Preferiblemente R² es Cl

- 5 Preferiblemente R³ es CF₃ o OCF₃ (más preferiblemente R³ es CF₃).

Preferiblemente R⁴ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₇), COCH₂O-alquilo (C₁-C₄), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂R⁷, en que R⁷ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre

- 10 halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), CN, NO₂ y S(O)_pR¹³, y R¹³ es alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃)

Preferiblemente R⁵ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆) o -alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₇).

Preferiblemente R⁶ es CF₃.

- 15 Preferiblemente m es 1.

Preferiblemente un heterociclilo, en los radicales antes mencionados, es independientemente un radical heteroaromático que tiene 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S, sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el

- 20 conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄) (más preferiblemente cada heterociclilo, en los radicales antes mencionados, es independientemente un radical heteroaromático que tiene 5 ó 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S, sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el
- 25 conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄)

Una clase preferida de compuestos de la fórmula (Ib) es la de aquellos en los que.

- 30 R¹ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o S(O)_p-haloalquilo (C₁-C₆); o es pindilo, pirimidinilo, tienilo, tiazolilo, funilo, tetrahydrofurilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo,

tetrahidrotienilo o tetrazolilo cuyos grupos están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆);

X es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇),

- 5 -alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆), -CH₂O-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂fenilo;

Y es H;

W es C-Cl,

R² es Cl;

- 10 R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

R⁴ es H, alquilo (C₁-C₆), COCH₂O-alquilo (C₁-C₄), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂fenilo;

R⁵ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇),

-alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆), -CH₂O-

- 15 alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆), SO₂-alquilo (C₁-C₆), SO₂-haloalquilo (C₁-C₆) o SO₂CH₂fenilo, y

m es 1 ó 2

Una clase preferida de compuestos de la fórmula (Ia) es la de aquellos en los que:

- 20 R¹ es fenilo,

Y es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇),

-alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆), -CH₂O-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆), SO₂-alquilo (C₁-C₆), SO₂-haloalquilo (C₁-C₆) o SO₂CH₂fenilo,

- 25 X es H,

W es C-Cl;

R² es Cl;

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

R⁴ es H, alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂fenilo;

- 30 R⁵ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇),

-alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆), -CH₂O-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆), SO₂-alquilo (C₁-C₆), SO₂-haloalquilo (C₁-C₆) o SO₂CH₂fenilo, y
m es 1

5

Una clase adicionalmente preferida de compuestos de la fórmula (Ia) es la de aquellos en los que

R¹ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) y S(O)_p-haloalquilo (C₁-C₆),

10

X es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆), CON[alquilo (C₁-C₆)]₂, -CH₂O-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C₁-C₃) o alcoxi (C₁-C₃);

15

Y es alquilo (C₁-C₆);

W es C-Cl;

R² es Cl,

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

R⁴ es alquilo (C₁-C₆) o -alquil (C₂-C₄)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₄),

20

R⁵ es H ó CH₃; y

m es 1.

Una clase sumamente preferida de compuestos de la fórmula (Ia) o (Ib) es la de aquellos en los que

25

R¹ es fenilo;

X e Y son, cada uno independientemente, H, metilo o acetilo;

W es C-Cl,

R² es Cl;

R³ y R⁶ son cada uno CF₃;

30

R⁴ y R⁵ son, cada uno independientemente, H, metilo, etilo, alilo, propargilo, ciclopropilo, bencilo, ciclopropilmetilo, metiltioetilo, etoxiacetilo o etoxicarbonilo, y

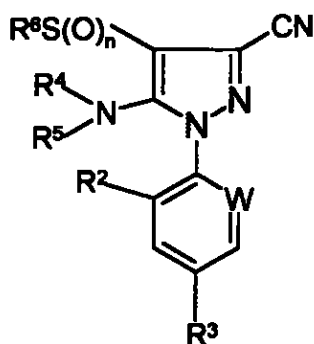
62

m es 1.

Los compuestos de la general formula (I) se pueden preparar por la aplicación o adaptación de métodos conocidos (es decir, métodos hasta ahora usados o descritos en la bibliografía química) Se entenderá que en ciertos casos puede ser necesario el uso de agentes protectores bien conocidos en la técnica con el fin de obtener rendimientos satisfactorios.

En la siguiente descripción de procedimientos, cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no se definen específicamente, se entiende que éstos son "como antes se han definido" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

De acuerdo con una característica del invento, los compuestos de la fórmula (Ia) en la que X es H, m y R¹ son como antes se han definido, e Y es como antes se ha definido, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de la fórmula (II):



(II)

en la que R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W y n son como antes se han definido, con un compuesto de la fórmula (III):

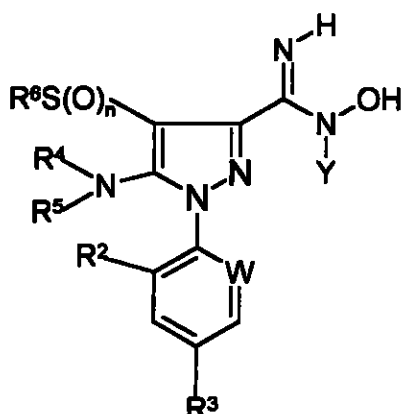


(III)

en la que R¹ y m son como antes se han definido e Y es como antes se ha definido, con la exclusión de H. La reacción se realiza generalmente en la presencia de una base tal como una trietilamina por ejemplo trietilamina, en el seno de un

disolvente tal como metanol, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C)

- De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ia) en la que X es H, m y R¹ son como antes se han definido, Y es como antes se ha definido, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar también por la reacción de un compuesto de la fórmula (IV):



10 (IV)

en la que los diversos símbolos son como antes se han definido, con un compuesto de la fórmula (V):



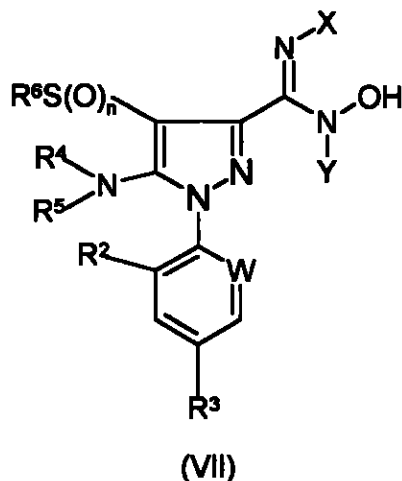
- en la que R¹ y m son como antes se han definido y L es un grupo lábil tal como halógeno, preferiblemente cloro, o sulfoxilo. La reacción se realiza generalmente en la presencia de una base tal como hidruro de sodio, en el seno de un disolvente tal como tetrahidrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C)

- De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ia) en la que X es como antes se ha definido, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la alquilación, acilación o sulfoxilación del correspondiente compuesto de la fórmula (Ia) en la que X es H, usando un compuesto de la fórmula (VI):



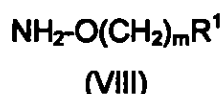
en la que X es como antes se ha definido, con la exclusión de H, y L¹ es un grupo lábil tal como halógeno, preferiblemente cloro, o sulfonyloxi.

- La reacción de alquilación (cuando X es alqueno (C₃-C₆), haloalqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆), haloalquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₇), o alquilo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹¹; o cuando X es -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰ y q es 0) se realiza generalmente en la presencia de una base tal como hidruro de sodio, en el seno de un disolvente tal como tetrahydrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C). Para alquilaciones cuando X es -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰ y q es 1 (es decir, arilaciones), L¹ es preferiblemente es flúor.
- La reacción de sulfonylación (cuando X es SO₂R¹³) se realiza generalmente en la presencia de una base tal como hidruro de sodio, en el seno de un disolvente tal como tetrahydrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C).
- La reacción de acilación (cuando X es -CO₂-alquilo (C₁-C₆), CONR⁷R⁸, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, COR⁸ ó COR¹⁷) se realiza generalmente en la presencia de una base tal como trietilamina, en el seno de un disolvente tal como tetrahydrofurano, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C).
- De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ia) en la que X, Y y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de la fórmula (VII)



en la que los diversos símbolos son como antes se han definido, con un compuesto de la fórmula (V) como antes se ha definido. La reacción se realiza generalmente en la presencia de una base tal como hidruro de sodio, en el seno de un disolvente tal como tetrahidrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C).

De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ib) en la que X e Y son cada uno H, y m, R¹ y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de la fórmula (II) como antes se ha definido, con un compuesto de la fórmula (VIII):



en la que R¹ y m son como antes se han definido. La reacción se realiza generalmente en la presencia de una base tal como una trietilamina por ejemplo trietilamina, en el seno de un disolvente tal como metanol, a una temperatura de desde 0° hasta 100°C (preferiblemente desde 0° hasta 50°C).

De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ib) en la que X es H, Y es como antes se ha definido, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de la fórmula (Ib) en la que Y es H, usando un compuesto de la fórmula (IX).



en la que Y es como antes se ha definido, con la exclusión de H y L² es un grupo lábil tal como halógeno, preferiblemente cloro, o sulfoniloxi.

Las reacciones de alquilación, acilación y sulfonilación se pueden realizar de acuerdo con los procesos descritos en el anterior procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula (Ia) a partir de compuestos de la fórmula (VI)

De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (Ib) en la que X e Y son como antes se han definido, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como antes se han definido, se pueden preparar por la

65
66

alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de la fórmula (Ib) en la que X es H, usando un compuesto de la fórmula (VI) como antes se ha definido.

5 Las reacciones de alquilación, acilación y sulfonilación se pueden realizar de acuerdo con los procesos descritos en el anterior procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula (Ia) a partir de compuestos de la fórmula (VI)

10 De acuerdo con una característica adicional del invento, los compuestos de la fórmula (I) en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, W, X, Y y m son como antes se han definido, y n es 1 ó 2 se pueden preparar por oxidación de un correspondiente compuesto en que n es 0 ó 1. La oxidación se realiza generalmente usando un perácido tal como ácido 3-cloroperbenzoico en el seno de un disolvente tal como diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de desde 0°C hasta la temperatura de reflujo del disolvente.

15

Colecciones de compuestos de la fórmula (I), que se pueden sintetizar por el procedimiento anteriormente mencionado, se pueden preparar también de una manera paralela, y esto se puede efectuar manualmente o de una manera semiautomática o plenamente automática. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el proceso de la reacción, del tratamiento o la purificación de los productos o de los compuestos intermedios. En total, se ha de entender como que significa un proceso como se describe, por ejemplo, por S H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity Automated Synthesis" [Informes Anuales en Química Combinatoria y Diversidad Molecular], Volumen 1, Editorial Escom 1997, páginas 69 hasta 77.

30 Una serie de aparatos comercialmente disponibles son como se ofrecen, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, se pueden usar para el proceso paralelo de la reacción y del tratamiento. Para la purificación paralela de compuestos de la fórmula (I), o de compuestos intermedios obtenidos

durante la preparación, se puede hacer uso, entre otros, de aparatos de cromatografía, por ejemplo los vendidos por ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE UU.

- 5 Los aparatos mencionados conducen a un proceso modular en el que las etapas individuales del procedimiento están automatizadas, pero se deben realizar operaciones manuales entre las etapas del procedimiento. Esto se puede evitar empleando sistemas de automatización semi-integrados o plenamente integrados en los que los módulos de automatización en cuestión se hacen funcionar, por ejemplo, por autómatas (robots). Tales sistemas de automatización se pueden obtener, por ejemplo, a partir de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

- Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar en parte o completamente por métodos soportados por fases sólidas. Para esta finalidad, ciertas etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis destinada a adaptarse al proceso en cuestión están unidas a una resina sintética. Métodos de síntesis soportados por fases sólidas se describen extensamente en la bibliografía especializada, por ejemplo Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index" [El Índice Combinatorio], Academic Press, 1998.

- El uso de métodos de síntesis soportados por fases sólidas permite una serie de protocolos que se conocen a partir de la bibliografía y que, a su vez, se pueden realizar manualmente o de una manera automática. Por ejemplo, el "tea-bag method" [método de la bolsa de té] (Houghten, documento US 4 631.211, Houghten y colaboradores, Proc. Natl Acad Sci, 1985, 82, 5131-5135), en el que se emplean productos producidos por IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU., puede ser semiautomático. La automatización de síntesis paralelas soportadas por fases sólidas se realiza satisfactoriamente, por ejemplo, por aparatos producidos por Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

67
68

La preparación por los procedimientos aquí descritos proporciona compuestos de la fórmula (I) en la forma de colecciones de sustancias que se denominan librerías. El presente invento se refiere también a librerías que comprenden por lo menos dos compuestos de la fórmula (I).

5

Los compuestos intermedios de la fórmula (IV) como antes se ha definido, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de la fórmula (II) como antes se ha definido, con un compuesto de la fórmula (X)



10 en la que Y es como antes se ha definido. La reacción se puede llevar a cabo usando el proceso anterior para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia) a partir de compuestos de las fórmulas (III) y (II).

15 Los compuestos de la fórmula (VII) como antes se ha definido, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de la fórmula (IV) como antes se ha definido, con un compuesto de la fórmula (VI) como antes se ha definido. La reacción se puede llevar a cabo usando el proceso anterior para la preparación de un compuesto de la fórmula (Ia) por la alquilación, acilación y sulfonilación de los correspondientes compuestos de la fórmula (Ia) en la que X es H, usando compuestos de la fórmula
20 (VI).

Ciertos compuestos de las fórmulas (IV) y (VII) son nuevos y como tales forman una característica adicional del invento.

25 Los compuestos de las fórmulas (II), (III), (V), (VI), (VIII), (IX) y (X) son conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos

Los siguientes Ejemplos no limitativos ilustran la preparación de los compuestos de la fórmula (I).

30 Ejemplos Químicos

En los Ejemplos que siguen, las cantidades (también los porcentajes) se basan en el peso, a menos que se señale otra cosa distinta.

Ejemplo 1:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-benciloxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 1-49)

A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,1 mmol) en metanol se le añadieron hidrocloreto de O-bencilhidroxilamina (0,214 g, 1,34 mmol) y trietilamina (0,33 g, 3,3 mmol). La mezcla se agitó a 20°C hasta que se obtuvo una solución transparente, y luego se evaporó. Después de haber añadido agua y acetato de etilo y de un tratamiento por extracción se obtuvo el producto del título (0,387 g) como un material sólido de color blanco.

Ejemplo 2:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-(2,6-diclorobenciloxi)-N-metil-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 4-82)

A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol) en N,N-dimetilformamida se le añadió hidruro de sodio (90%, 0,029 g, 1,1 mmol). Después de haber agitado durante 0,5 horas a 20°C, se añadió gota a gota bromuro de 2,6-diclorobencilo (0,252 g, 1,05 mmol). La mezcla se agitó durante 7 horas adicionales a 20°C. Después de haber añadido cloruro de amonio acuoso y de un tratamiento por extracción, el producto del título se aisló por cromatografía (0,31 g) como un material sólido

Ejemplo 3.

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 4-128)

Trabajando de acuerdo con el Ejemplo 2 pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometilbencilo, se obtuvo el compuesto del título (0,57 g) como un material sólido

Ejemplo 4:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometoxibenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (Compuesto 4-165)

Trabajando de acuerdo con el Ejemplo 2 pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometoxibencilo (0,290 g, 1,05 mmol) se obtuvo el compuesto del título (0,093 g) como un material sólido

10 Ejemplo 5:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (Compuesto 4-93)

Trabajando de acuerdo con el Ejemplo 2 pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio al 90% (0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-trifluorometoxibencilo (0,251 g, 1,05 mmol), y subsiguiente purificación por cromatografía se obtuvo 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-metil-N-(4-trifluorometilbenciloxi)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,018 g) como un material sólido.

20

Ejemplo 6:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-[N-(4-fluorobenciloxi-N-metil)-N'-(4-fluorobencil)-2-amidino]-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (Compuesto 4-159)

Trabajando de acuerdo con el Ejemplo 2 pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-metil-N-hidroxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,0 mmol), hidruro de sodio (al 90%, 0,029 g, 1,1 mmol) y bromuro de 4-fluorobencilo (0,202 g, 1,05 mmol) se obtuvo el compuesto del título (0,309 g) como un material sólido.

30 Los siguientes Ejemplos de Referencia ilustran la preparación de compuestos intermedios usados en la síntesis de los antenores Ejemplos.

Ejemplo Intermedio 1:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-hidroxi-N-metil-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol

5 A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (2,0 g, 4,0 mmol) en metanol se le añadieron hidrocloreto de N-metilhidroxilamina (3,45 g, 41,55 mmol) y trietilamina (10,05 g, 13,9 ml, 99,0 mmol). La mezcla se agitó durante 8 horas a 20°C, se evaporó y el material sólido resultante se lavó con agua, se filtró y se secó para proporcionar el producto del título (14,73 g) como un material sólido de color blanco pálido.

10

Ejemplo Intermedio 2:

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-(N-bencil-N-hidroxi-2-amidino)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol

15 Trabajando de acuerdo con Ejemplo Intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,5 g, 1,1 mmol) e hidrocloreto de N-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol), se obtuvo el compuesto del título (0,450 g) como un material sólido de color blanco.

Ejemplo Intermedio 3.

20 **3-(N-Bencil-N-hidroxi-2-amidino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol**

Trabajando de acuerdo con Ejemplo Intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (0,5 g, 1,1 mmol) e hidrocloreto de N-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol) se obtuvo el compuesto
25 del título (0,435 g) como un material sólido de color blanco.

Ejemplo Intermedio 4:

3-(N-Bencil-N-hidroxi-2-amidino)-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol

30 Trabajando de acuerdo con Ejemplo Intermedio 1, pero usando 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,5 g, 1,1

71
20

mmol) e hidrocloreto de N-bencilhidroxilamina (0,22 g, 1,34 mmol) se obtuvo el compuesto del título (0,61 g) como un material sólido de color blanco

5 Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las Tablas 1 a 7 también forman parte del presente invento, y se prepararon o se pueden preparar de acuerdo con, o de una manera análoga a, los Ejemplos 1 a 6 antes mencionados o los métodos generales antes descritos.

10 En las Tablas cPr significa ciclopropilo y Ph significa fenilo. Donde se omitan subíndices después de átomos se entenderá que éstos están considerados, por ejemplo CH₃ significa CH₃.

Los números de compuestos se dan solamente con finalidades de referencia

Tabla 1. Compuestos de la fórmula (Ib) en que R² = Cl; W = C-Cl, R³ = R⁶ = CF₃; m = 1, R¹ = fenilo; X = Y = H

15

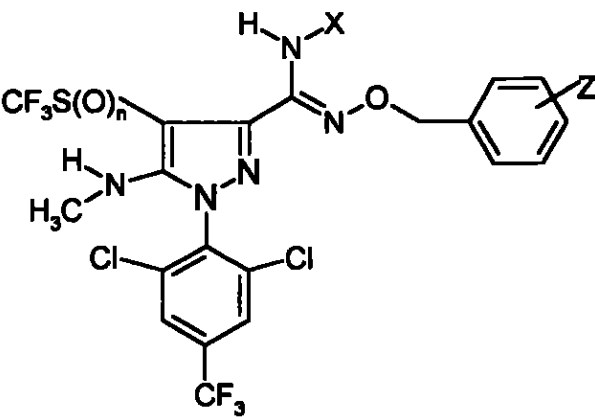
Compuesto Número	R ⁵	R ⁴	n	p f (°C)
1-1	H	CH ₃	0	
1-2	CH ₃	CH ₃	0	
1-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-6	CH ₂ CHCH ₃	CH ₃	0	
1-7	CH ₂ CCH ₃	CH ₃	0	
1-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	0	
1-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0	
1-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-12	CH ₂ cPr	CH ₃	0	
1-13	cPr	CH ₃	0	
1-14	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
1-15	H	H	0	
1-16	H	CH ₂ CH ₃	0	
1-17	H	iPr	0	
1-18	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	0	
1-19	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0	
1-20	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-21	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	0	
1-22	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	0	

72
73

Compuesto Número	R ⁵	R ⁴	n	p f (°C)
1-23	COCH3	CH3	0	
1-24	COCH2OCH2CH3	CH3	0	
1-25	H	CH3	1	
1-26	CH3	CH3	1	
1-27	CH2CH3	CH3	1	
1-28	CH2CH2CH3	CH3	1	
1-29	CH2CH2CH2CH3	CH3	1	
1-30	CH2CHCH2	CH3	1	
1-31	CH2CCH	CH3	1	
1-32	C(O)OCH3	CH3	1	
1-33	C(O)OCH2CH3	CH3	1	
1-34	CH2OCH3	CH3	1	
1-35	CH2OCH2CH3	CH3	1	
1-36	CH2cPr	CH3	1	
1-37	cPr	CH3	1	
1-38	CH3	CH2Ph	1	
1-39	H	H	1	
1-40	H	CH2CH3	1	
1-41	H	iPr	1	
1-42	CH2CH2SCH3	H	1	
1-43	CH2CH2SCH3	CH3	1	
1-44	SO2CH2CH3	CH3	1	
1-45	SO2CH2CH2CH2Cl	CH3	1	
1-46	SO2CH2Ph	CH3	1	
1-47	COCH3	CH3	1	
1-48	COCH2OCH2CH3	CH3	1	
1-49	H	CH3	2	174
1-50	CH3	CH3	2	
1-51	CH2CH3	CH3	2	
1-52	CH2CH2CH3	CH3	2	
1-53	CH2CH2CH2CH3	CH3	2	
1-54	CH2CHCH2	CH3	2	
1-55	CH2CCH	CH3	2	
1-56	C(O)OCH3	CH3	2	
1-57	C(O)OCH2CH3	CH3	2	
1-58	CH2OCH3	CH3	2	
1-59	CH2OCH2CH3	CH3	2	
1-60	CH2cPr	CH3	2	
1-61	cPr	CH3	2	
1-62	CH3	CH2Ph	2	
1-63	H	H	2	
1-64	H	CH2CH3	2	

Compuesto Número	R ⁵	R ⁴	n	p.f. (°C)
1-65	H	iPr	2	
1-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	2	
1-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	2	
1-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	2	
1-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	2	
1-71	COCH ₃	CH ₃	2	
1-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	

Tabla 2: Compuestos de la fórmula (Ib-1)



5

(Ib-1)

Compuesto Número	X	Z	n	p.f. (°C)
2-1	H	H	0	
2-2	CH ₃	H	0	
2-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
2-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
2-7	CH ₂ CCH	H	0	
2-8	C(O)OCH ₃	H	0	
2-9	C(O)CH ₃	H	0	
2-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
2-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
2-12	CH ₂ cPr	H	0	
2-13	cPr	H	0	
2-14	CH ₂ Ph	H	0	
2-15	H	H	1	

24
25

Compuesto Número	X	Z	n	p.f. (°C)
2-16	CH ₃	H	1	
2-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
2-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
2-21	CH ₂ CCH	H	1	
2-22	C(O)OCH ₃	H	1	
2-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
2-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-26	CH ₂ cPr	H	1	
2-27	cPr	H	1	
2-28	CH ₂ Ph	H	1	
2-29	H	H	2	
2-30	CH ₃	H	2	
2-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
2-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
2-35	CH ₂ CCH	H	2	
2-36	C(O)OCH ₃	H	2	
2-37	C(O)CH ₃	H	2	
2-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
2-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
2-40	CH ₂ cPr	H	2	
2-41	cPr	H	2	
2-42	CH ₂ Ph	H	2	
2-43	H	2-Cl	0	
2-44	H	3-Cl	0	
2-45	H	4-Cl	0	
2-46	H	2,5-Cl ₂	0	
2-47	H	2,6-Cl ₂	0	
2-48	H	3,4-Cl ₂	0	
2-49	H	2-F	0	
2-50	H	3-F	0	
2-51	H	4-F	0	
2-52	H	3,4-F ₂	0	
2-53	H	2,6-F ₂	0	
2-54	H	4-Br	0	
2-55	H	4-I	0	
2-56	H	2-CF ₃	0	
2-57	H	3-CF ₃	0	

25
76

Compuesto Número	X	Z	n	p f (°C)
2-58	H	4-CF3	0	
2-59	H	3,5-(CF3)2	0	
2-60	H	4-CF3, 2-Cl	0	
2-61	H	3-CF3, 4-Cl	0	
2-62	H	2-OCH3	0	
2-63	H	3-OCH3	0	
2-64	H	4-OCH3	0	
2-65	H	4-SCH3	0	
2-66	H	4-SCF3	0	
2-67	H	4-SF5	0	
2-68	H	3,4-(OCH3)2	0	
2-69	H	4-Ph	0	
2-70	H	4-I	0	
2-71	H	2-CH3	0	
2-72	H	3-CH3	0	
2-73	H	2,3-(CH3)2	0	
2-74	H	4-CH3	0	
2-75	H	2,5-(CH3)2	0	
2-76	H	2,6-(CH3)2	0	
2-77	H	3,4-(CH3)2	0	
2-78	H	2-Cl	1	
2-79	H	3-Cl	1	
2-80	H	4-Cl	1	
2-81	H	2,5-Cl2	1	
2-82	H	2,6-Cl2	1	
2-83	H	3,4-Cl2	1	
2-84	H	2-F	1	
2-85	H	3-F	1	
2-86	H	4-F	1	
2-87	H	3,4-F2	1	
2-88	H	2,6-F2	1	
2-89	H	4-Br	1	
2-90	H	4-I	1	
2-91	H	2-CF3	1	
2-92	H	3-CF3	1	
2-93	H	4-CF3	1	
2-94	H	3,5-(CF3)2	1	
2-95	H	4-CF3, 2-Cl	1	
2-96	H	3-CF3, 4-Cl	1	
2-97	H	2-OCH3	1	
2-98	H	3-OCH3	1	
2-99	H	4-OCH3	1	

28
27

Compuesto Número	X	Z	n	p.f. (°C)
2-100	H	4-SCH3	1	
2-101	H	4-SCF3	1	
2-102	H	4-SF5	1	
2-103	H	3,4-(OCH3)2	1	
2-104	H	4-Ph	1	
2-105	H	4-I	1	
2-106	H	2-CH3	1	
2-107	H	3-CH3	1	
2-108	H	2,3-(CH3)2	1	
2-109	H	4-CH3	1	
2-110	H	2,5-(CH3)2	1	
2-111	H	2,6-(CH3)2	1	
2-112	H	3,4-(CH3)2	1	
2-113	H	2-Cl	2	
2-114	H	3-Cl	2	
2-115	H	4-Cl	2	
2-116	H	2,5-Cl2	2	
2-117	H	2,6-Cl2	2	
2-118	H	3,4-Cl2	2	
2-119	H	2-F	2	
2-120	H	3-F	2	
2-121	H	4-F	2	
2-122	H	3,4-F2	2	
2-123	H	2,6-F2	2	
2-124	H	4-Br	2	
2-125	H	4-I	2	
2-126	H	2-CF3	2	
2-127	H	3-CF3	2	
2-128	H	4-CF3	2	
2-129	H	3,5-(CF3)2	2	
2-130	H	4-CF3, 2-Cl	2	
2-131	H	3-CF3, 4-Cl	2	
2-132	H	2-OCH3	2	
2-133	H	3-OCH3	2	
2-134	H	4-OCH3	2	
2-135	H	4-SCH3	2	
2-136	H	4-SCF3	2	
2-137	H	4-SF5	2	
2-138	H	3,4-(OCH3)2	2	
2-139	H	4-Ph	2	
2-140	H	4-I	2	
2-141	H	2-CH3	2	

77
78

Compuesto Número	X	Z	n	p.f. (°C)
2-142	H	3-CH3	2	
2-143	H	2,3-(CH3)2	2	
2-144	H	4-CH3	2	
2-145	H	2,5-(CH3)2	2	
2-146	H	2,6-(CH3)2	2	
2-147	H	3,4-(CH3)2	2	
2-148	H	4-C5H11	0	
2-149	H	3,5-Cl2	0	
2-150	H	3,5-Cl2	1	
2-151	H	3,5-Cl2	2	

Tabla 3: Compuestos de la fórmula (Ia) en que $R^2 = Cl$, $W = C-Cl$; $R^3 = R^6 = CF_3$;
 $m = 1$; $R^1 = \text{fenilo}$, $X = H$

5

Com Nº	R ⁵	R ⁴	Y	n	p f (°C)/ 1H-NMR
3-1	H	CH3	CH3	0	
3-2	CH3	CH3	CH3	0	
3-3	CH2CH3	CH3	CH3	0	
3-4	CH2CH2CH3	CH3	CH3	0	
3-5	CH2CH2CH2CH3	CH3	CH3	0	
3-6	CH2CHCH2	CH3	CH3	0	
3-7	CH2CCH	CH3	CH3	0	
3-8	C(O)OCH3	CH3	CH3	0	
3-9	C(O)OCH2CH3	CH3	CH3	0	
3-10	CH2OCH3	CH3	CH3	0	
3-11	CH2OCH2CH3	CH3	CH3	0	
3-12	CH2cPr	CH3	CH3	0	
3-13	cPr	CH3	CH3	0	
3-14	CH3	CH2Ph	CH3	0	
3-15	H	H	CH3	0	
3-16	H	CH2CH3	CH3	0	
3-17	H	iPr	CH3	0	
3-18	CH2CH2SCH3	H	CH3	0	
3-19	CH2CH2SCH3	CH3	CH3	0	
3-20	SO2CH2CH3	CH3	CH3	0	
3-21	SO2CH2CH2CH2Cl	CH3	CH3	0	
3-22	SO2CH2Ph	CH3	CH3	0	
3-23	COCH3	CH3	CH3	0	

78
79

Com Nº	R ⁵	R ⁴	Y	n	p f (°C)/ 1H-NMR
3-24	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	0	
3-25	H	CH ₃	CH ₃	1	2,50 d,3H,N- CH ₃
3-26	CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-27	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-30	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	1	
3-31	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	1	
3-32	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-33	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-34	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-35	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-36	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-37	cPr	CH ₃	CH ₃	1	
3-38	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	1	
3-39	H	H	CH ₃	1	
3-40	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
3-41	H	iPr	CH ₃	1	
3-42	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	1	
3-43	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-44	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-45	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	1	
3-46	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	1	
3-47	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-48	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	1	
3-49	H	CH ₃	CH ₃	2	
3-50	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-51	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-52	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-53	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-54	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	CH ₃	2	
3-55	CH ₂ CCH	CH ₃	CH ₃	2	
3-56	C(O)OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-57	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-58	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-59	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-60	CH ₂ cPr	CH ₃	CH ₃	2	
3-61	cPr	CH ₃	CH ₃	2	
3-62	CH ₃	CH ₂ Ph	CH ₃	2	
3-63	H	H	CH ₃	2	

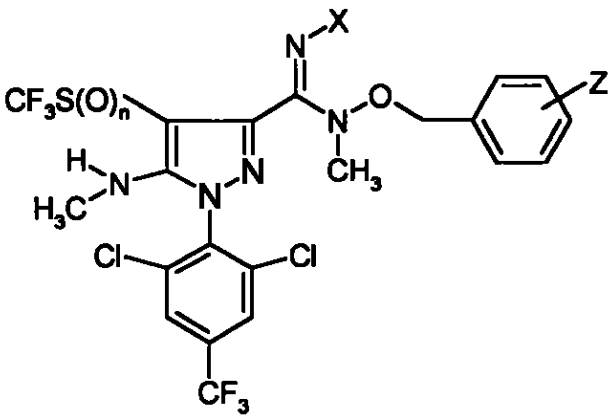
Com N°	R ⁵	R ⁴	Y	n	p f (°C)/ 1H-NMR
3-64	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
3-65	H	iPr	CH ₃	2	
3-66	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	2	
3-67	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-68	SO ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-69	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	2	
3-70	SO ₂ CH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	2	
3-71	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-72	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	2	
3-73	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
3-74	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-75	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-76	H	CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	0	
3-77	H	CH ₃	CH ₂ CCH	0	
3-78	H	CH ₃	C(O)OCH ₃	0	
3-79	H	CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	0	
3-80	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	0	
3-81	H	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-82	H	CH ₃	CH ₂ cPr	0	
3-83	H	CH ₃	cPr	0	
3-84	H	CH ₃	CH ₂ Ph	0	
3-85	H	CH ₃	H	0	
3-86	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-87	H	CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	0	
3-88	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	0	
3-89	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	0	
3-90	H	CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	0	
3-91	H	CH ₃	COCH ₃	0	
3-92	H	CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	0	
3-93	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
3-94	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-95	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-96	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CHCH ₂	1	
3-97	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CCH	1	
3-98	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₃	1	
3-99	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	1	
3-100	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₃	1	
3-101	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-102	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ cPr	1	
3-103	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	cPr	1	
3-104	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ Ph	1	
3-105	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	1	

80/81

Com Nº	R ⁵	R ⁴	Y	n	p.f. (°C)/ 1H-NMR
3-106	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	
3-107	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1	
3-108	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	1	
3-109	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	1	
3-110	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	1	
3-111	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₃	1	
3-112	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	1	
3-113	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
3-114	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-115	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-116	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CHCH ₂	2	
3-117	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CCH	2	
3-118	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₃	2	
3-119	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C(O)OCH ₂ CH ₃	2	
3-120	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₃	2	
3-121	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	
3-122	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ cPr	2	
3-123	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	cPr	2	
3-124	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ Ph	2	
3-125	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	2	
3-126	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-127	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	2	
3-128	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	2	
3-129	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	2	
3-130	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂ Ph	2	
3-131	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₃	2	
3-132	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	COCH ₂ OCH ₂ CH ₃	2	

81
02

Tabla 4: Compuestos de la fórmula (Ia-1)



(Ia-1)

Com N°	X	Z	n	p f (°C)/1H-NMR
4-1	CON(CH3)2	H	0	
4-2	CH3	H	0	
4-3	CH2CH3	H	0	
4-4	CH2CH2CH3	H	0	
4-5	CH2CH2CH2CH3	H	0	
4-6	CH2CHCH2	H	0	
4-7	CH2CCH	H	0	
4-8	C(O)OCH3	H	0	
4-9	C(O)CH3	H	0	
4-10	CH2OCH3	H	0	
4-11	CH2OCH2CH3	H	0	
4-12	CH2cPr	H	0	
4-13	cPr	H	0	
4-14	CH2Ph	H	0	
4-15	H	H	1	
4-16	CH3	H	1	
4-17	CH2CH3	H	1	
4-18	CH2CH2CH3	H	1	
4-19	CH2CH2CH2CH3	H	1	
4-20	CH2CHCH2	H	1	
4-21	CH2CCH	H	1	
4-22	C(O)OCH3	H	1	
4-23	C(O)OCH2CH3	H	1	
4-24	CH2OCH3	H	1	
4-25	CH2OCH2CH3	H	1	
4-26	CH2cPr	H	1	
4-27	cPr	H	1	

8/2
03

Com Nº	X	Z	n	p f. (°C)/ ¹ H-NMR
4-28	CH ₂ Ph	H	1	
4-29	H	H	2	
4-30	CH ₃	H	2	
4-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
4-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
4-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
4-35	CH ₂ CCH	H	2	
4-36	C(O)OCH ₃	H	2	
4-37	C(O)CH ₃	H	2	
4-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
4-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
4-40	CH ₂ cPr	H	2	
4-41	cPr	H	2	
4-42	CH ₂ Ph	H	2	
4-43	H	2-Cl	0	
4-44	H	3-Cl	0	
4-45	H	4-Cl	0	
4-46	H	2,5-Cl ₂	0	
4-47	H	2,6-Cl ₂	0	
4-48	H	3,4-Cl ₂	0	
4-49	H	2-F	0	
4-50	H	3-F	0	
4-51	H	4-F	0	
4-52	H	3,4-F ₂	0	
4-53	H	2,6-F ₂	0	
4-54	H	4-Br	0	
4-55	H	4-I	0	
4-56	H	2-CF ₃	0	
4-57	H	3-CF ₃	0	
4-58	H	4-CF ₃	0	
4-59	H	3,5-(CF ₃) ₂	0	
4-60	H	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
4-61	H	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
4-62	H	2-OCH ₃	0	
4-63	H	3-OCH ₃	0	
4-64	H	4-OCH ₃	0	
4-65	H	4-SCH ₃	0	
4-66	H	4-SCF ₃	0	
4-67	H	4-SF ₅	0	
4-68	H	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
4-69	H	4-Ph	0	

83
84

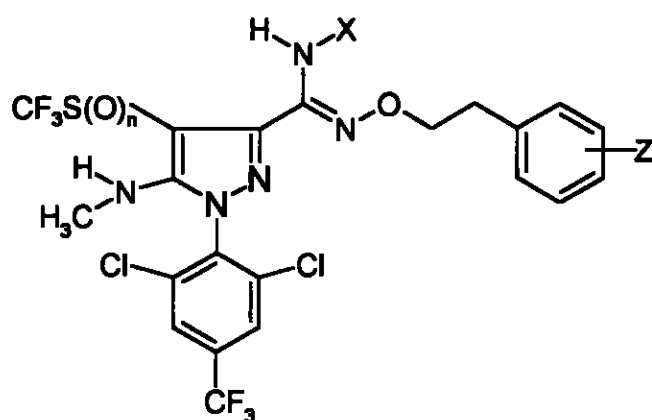
Com Nº	X	Z	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
4-70	H	4-I	0	
4-71	H	2-CH ₃	0	
4-72	H	3-CH ₃	0	
4-73	H	2,3-(CH ₃) ₂	0	
4-74	H	4-CH ₃	0	
4-75	H	2,5-(CH ₃) ₂	0	
4-76	H	2,6-(CH ₃) ₂	0	
4-77	H	3,4-(CH ₃) ₂	0	
4-78	H	2-Cl	1	
4-79	H	3-Cl	1	
4-80	H	4-Cl	1	
4-81	H	2,5-Cl ₂	1	
4-82	H	2,6-Cl ₂	1	79
4-83	H	3,4-Cl ₂	1	
4-84	H	2-F	1	
4-85	H	3-F	1	
4-86	H	4-F	1	
4-87	H	3,4-F ₂	1	
4-88	H	2,6-F ₂	1	
4-89	H	4-Br	1	
4-90	H	4-I	1	
4-91	H	2-CF ₃	1	
4-92	H	3-CF ₃	1	
4-93	H	4-CF ₃	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
4-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
4-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
4-97	H	2-OCH ₃	1	
4-98	H	3-OCH ₃	1	
4-99	H	4-OCH ₃	1	
4-100	H	4-SCH ₃	1	
4-101	H	4-SCF ₃	1	2,51, d,3H, N-CH ₃
4-102	H	4-SF ₅	1	
4-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
4-104	H	4-Ph	1	
4-105	H	4-I	1	
4-106	H	2-CH ₃	1	
4-107	H	3-CH ₃	1	
4-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
4-109	H	4-CH ₃	1	
4-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
4-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	

84
85

Com Nº	X	Z	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
4-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
4-113	H	2-Cl	2	
4-114	H	3-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-115	H	4-Cl	2	175
4-116	H	2,5-Cl ₂	2	
4-117	H	2,6-Cl ₂	2	80
4-118	H	3,4-Cl ₂	2	
4-119	H	2-F	2	
4-120	H	3-F	2	
4-121	H	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-122	H	3,4-F ₂	2	
4-123	H	2,6-F ₂	2	
4-124	H	4-Br	2	
4-125	H	4-I	2	
4-126	H	2-CF ₃	2	
4-127	H	3-CF ₃	2	
4-128	H	4-CF ₃	2	93
4-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
4-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
4-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
4-132	H	2-OCH ₃	2	
4-133	H	3-OCH ₃	2	
4-134	H	4-OCH ₃	2	
4-135	H	4-SCH ₃	2	
4-136	H	4-SCF ₃	2	62
4-137	H	4-SF ₅	2	
4-138	H	3,4-(OCH ₃) ₂	2	
4-139	H	4-Ph	2	
4-140	H	4-I	2	
4-141	H	2-CH ₃	2	
4-142	H	3-CH ₃	2	
4-143	H	2,3-(CH ₃) ₂	2	
4-144	H	4-CH ₃	2	81
4-145	H	2,5-(CH ₃) ₂	2	
4-146	H	2,6-(CH ₃) ₂	2	
4-147	H	3,4-(CH ₃) ₂	2	
4-148	H	4-C ₅ H ₁₁	0	
4-149	H	3,5-Cl ₂	0	
4-150	H	3,5-Cl ₂	1	
4-151	H	3,5-Cl ₂	2	
4-152	H	3,5-(CH ₃) ₂	2	64
4-153	H	2-CN	2	54

Com N°	X	Z	n	p.f (°C)/ ¹ H-NMR
4-154	H	4-terc.-C ₄ H ₉	1	2,50, d,3H, N-CH ₃
4-155	H	4-terc.-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-156	3-F-bencilo	3-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-157	2-F-bencilo	2-F	2	2,61, d,3H, N-CH ₃
4-158	2-Cl-bencilo	2-Cl	2	2,57, d,3H, N-CH ₃
4-159	4-F-bencilo	4-F	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-160	3-Cl-bencilo	3-Cl	2	2,68, d,3H, N-CH ₃
4-161	3-CH ₃ -bencilo	3-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-162	3-OCH ₃ -bencilo	3-OCH ₃	2	2,62, d,3H, N-CH ₃
4-163	2-CH ₃ -bencilo	2-CH ₃	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-164	4-terc.-C ₄ H ₉ -bencilo	4-terc.-C ₄ H ₉	2	2,60, d,3H, N-CH ₃
4-165	H	4-OCF ₃	0	

Tabla 5. Compuestos de la fórmula (Ib-2)



(lb-2)

5

Com Nº	X	Z	n	p f. (°C)/ ¹ H-NMR
5-1	H	H	0	Aceite
5-2	CH ₃	H	0	
5-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
5-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
5-6	CH ₂ CHCH ₂	H	0	
5-7	CH ₂ CCH	H	0	
5-8	C(O)OCH ₃	H	0	
5-9	C(O)CH ₃	H	0	

86
87

Com Nº	X	Z	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
5-10	CH ₂ OCH ₃	H	0	
5-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
5-12	CH ₂ cPr	H	0	
5-13	cPr	H	0	
5-14	CH ₂ Ph	H	0	
5-15	H	H	1	
5-16	CH ₃	H	1	
5-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
5-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
5-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
5-21	CH ₂ CCH	H	1	
5-22	C(O)OCH ₃	H	1	
5-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
5-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
5-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
5-26	CH ₂ cPr	H	1	
5-27	cPr	H	1	
5-28	CH ₂ Ph	H	1	
5-29	H	H	2	
5-30	CH ₃	H	2	
5-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
5-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
5-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
5-35	CH ₂ CCH	H	2	
5-36	C(O)OCH ₃	H	2	
5-37	C(O)CH ₃	H	2	
5-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
5-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
5-40	CH ₂ cPr	H	2	
5-41	cPr	H	2	
5-42	CH ₂ Ph	H	2	
5-43	H	2-Cl	0	
5-44	H	3-Cl	0	
5-45	H	4-Cl	0	
5-46	H	2,5-Cl ₂	0	
5-47	H	2,6-Cl ₂	0	
5-48	H	3,4-Cl ₂	0	
5-49	H	2-F	0	
5-50	H	3-F	0	
5-51	H	4-F	0	

87
08

Com N°	X	Z	n	p f (°C)/ ¹ H-NMR
5-52	H	3,4-F2	0	
5-53	H	2,6-F2	0	
5-54	H	4-Br	0	
5-55	H	4-I	0	
5-56	H	2-CF3	0	
5-57	H	3-CF3	0	
5-58	H	4-CF3	0	
5-59	H	3,5-(CF3)2	0	
5-60	H	4-CF3, 2-Cl	0	
5-61	H	3-CF3, 4-Cl	0	
5-62	H	2-OCH3	0	
5-63	H	3-OCH3	0	
5-64	H	4-OCH3	0	
5-65	H	4-SCH3	0	
5-66	H	4-SCF3	0	
5-67	H	4-SF5	0	
5-68	H	3,4-(OCH3)2	0	
5-69	H	4-Ph	0	
5-70	H	4-I	0	
5-71	H	2-CH3	0	
5-72	H	3-CH3	0	
5-73	H	2,3-(CH3)2	0	
5-74	H	4-CH3	0	
5-75	H	2,5-(CH3)2	0	
5-76	H	2,6-(CH3)2	0	
5-77	H	3,4-(CH3)2	0	
5-78	H	2-Cl	1	
5-79	H	3-Cl	1	
5-80	H	4-Cl	1	
5-81	H	2,5-Cl2	1	
5-82	H	2,6-Cl2	1	
5-83	H	3,4-Cl2	1	
5-84	H	2-F	1	
5-85	H	3-F	1	
5-86	H	4-F	1	
5-87	H	3,4-F2	1	
5-88	H	2,6-F2	1	
5-89	H	4-Br	1	
5-90	H	4-I	1	
5-91	H	2-CF3	1	
5-92	H	3-CF3	1	
5-93	H	4-CF3	1	

88
89

Com Nº	X	Z	n	p.f (°C)/ ¹ H-NMR
5-94	H	3,5-(CF ₃) ₂	1	
5-95	H	4-CF ₃ , 2-Cl	1	
5-96	H	3-CF ₃ , 4-Cl	1	
5-97	H	2-OCH ₃	1	
5-98	H	3-OCH ₃	1	
5-99	H	4-OCH ₃	1	
5-100	H	4-SCH ₃	1	
5-101	H	4-SCF ₃	1	
5-102	H	4-SF ₅	1	
5-103	H	3,4-(OCH ₃) ₂	1	
5-104	H	4-Ph	1	
5-105	H	4-I	1	
5-106	H	2-CH ₃	1	
5-107	H	3-CH ₃	1	
2-108	H	2,3-(CH ₃) ₂	1	
5-109	H	4-CH ₃	1	
5-110	H	2,5-(CH ₃) ₂	1	
5-111	H	2,6-(CH ₃) ₂	1	
5-112	H	3,4-(CH ₃) ₂	1	
5-113	H	2-Cl	2	
5-114	H	3-Cl	2	
5-115	H	4-Cl	2	
5-116	H	2,5-Cl ₂	2	
5-117	H	2,6-Cl ₂	2	
5-118	H	3,4-Cl ₂	2	
5-119	H	2-F	2	
5-120	H	3-F	2	
5-121	H	4-F	2	
5-122	H	3,4-F ₂	2	
5-123	H	2,6-F ₂	2	
5-124	H	4-Br	2	
5-125	H	4-I	2	
5-126	H	2-CF ₃	2	
5-127	H	3-CF ₃	2	
5-128	H	4-CF ₃	2	
5-129	H	3,5-(CF ₃) ₂	2	
5-130	H	4-CF ₃ , 2-Cl	2	
5-131	H	3-CF ₃ , 4-Cl	2	
5-132	H	2-OCH ₃	2	
5-133	H	3-OCH ₃	2	
5-134	H	4-OCH ₃	2	
5-135	H	4-SCH ₃	2	

89
90

Com N°	X	Z	n	p.f (°C)/1H-NMR
5-136	H	4-SCF3	2	
5-137	H	4-SF5	2	
5-138	H	3,4-(OCH3)2	2	
5-139	H	4-Ph	2	
5-140	H	4-I	2	
5-141	H	2-CH3	2	
5-142	H	3-CH3	2	
5-143	H	2,3-(CH3)2	2	
5-144	H	4-CH3	2	
5-145	H	2,5-(CH3)2	2	
5-146	H	2,6-(CH3)2	2	
5-147	H	3,4-(CH3)2	2	
5-148	H	4-C5H11	0	
5-149	H	3,5-Cl2	0	
5-150	H	3,5-Cl2	1	
5-151	H	3,5-Cl2	2	

Tabla 6. Compuestos de la fórmula (Ib) en que R² = Cl, W = C-Cl, R³ = R⁶ = CF₃; m = 1, R⁴ = Y = H; R⁵ = CH₃

5

Com N°	X	R ¹	n	p.f. (°C)/1H-NMR
6-1	H	2-pindilo	0	
6-2	H	3-piridilo	0	2,56, d,3H, N-CH3
6-3	H	3-pindilo	0	
6-4	H	4-piridilo	0	
6-5	H	1-pirimidilo	0	
6-6	H	3-pirimidilo	0	
6-7	H	4-pirimidilo	0	
6-8	H	2-tienilo	0	
6-9	H	3-tienilo	0	
6-10	H	2-furilo	0	
6-11	H	3-furilo	0	
6-12	H	2-tetrahidrofurilo	0	
6-13	H	3-tetrahidrofurilo	0	
6-14	H	3-pirazolilo	0	
6-15	H	4-pirazolilo	0	
6-16	H	5-pirazolilo	0	
6-17	H	2-imidazolilo	0	

Com Nº	X	R ¹	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
6-18	H	4-imidazolilo	0	
6-19	H	5-imidazolilo	0	
6-20	H	2-tiazolilo	0	
6-21	H	4-tiazolilo	0	
6-22	H	5-tiazolilo	0	
6-23	H	2-tetrahidrotienilo	0	
6-24	H	2-pirrolilo	0	
6-25	H	3-pirrolilo	0	
6-26	H	4-pirrolilo	0	
6-27	H	1-tetrazolilo	0	
6-28	H	5-tetrazolilo	0	
6-29	H	3-(1,2,4)-triazolilo	0	
6-30	H	5-(1,2,4)-triazolilo	0	
6-31	CH ₃	2-tienilo	0	
6-32	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-33	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-34	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	0	
6-35	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	0	
6-36	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	0	
6-37	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	0	
6-38	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	0	
6-39	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pindil)-2-tienilo	0	
6-40	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	0	
6-41	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	0	
6-42	H	2-Cl-5-piridilo	0	2,59, d,3H, N-CH ₃
6-43	H	2-pindilo	1	
6-44	H	3-piridilo	1	
6-45	H	3-piridilo	1	
6-46	H	4-piridilo	1	
6-47	H	1-pirimidilo	1	
6-48	H	3-pirimidilo	1	
6-49	H	4-pirimidilo	1	
6-50	H	2-tienilo	1	
6-51	H	3-tienilo	1	
6-52	H	2-furilo	1	
6-53	H	3-furilo	1	
6-54	H	2-tetrahidrofunilo	1	
6-55	H	3-tetrahidrofunilo	1	
6-56	H	3-pirazolilo	1	
6-57	H	4-pirazolilo	1	
6-58	H	5-pirazolilo	1	
6-59	H	2-imidazolilo	1	

91
92

Com N°	X	R ¹	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
6-60	H	4-imidazolilo	1	
6-61	H	5-imidazolilo	1	
6-62	H	2-tiazolilo	1	
6-63	H	4-tiazolilo	1	
6-64	H	5-tiazolilo	1	
6-65	H	2-tetrahidrotienilo	1	
6-66	H	2-pirrolilo	1	
6-67	H	3-pirrolilo	1	
6-68	H	4-pirrolilo	1	
6-69	H	1-tetrazolilo	1	
6-70	H	5-tetrazolilo	1	
6-71	H	3-(1,2,4)-triazolilo	1	
6-72	H	5-(1,2,4)-triazolilo	1	
6-73	CH ₃	2-tienilo	1	
6-74	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-75	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-76	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	1	
6-77	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	1	
6-78	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	1	
6-79	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	1	
6-80	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	1	
6-81	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pindilo)-2-tienilo	1	
6-82	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	1	
6-83	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	1	
6-84	H	2-Cl-5-pindilo	1	2,64, d,3H, N-CH ₃
6-85	H	2-pindilo	2	
6-86	H	3-pindilo	2	
6-87	H	3-pindilo	2	
6-88	H	4-pindilo	2	
6-89	H	1-pirimidilo	2	
6-90	H	3-pirimidilo	2	
6-91	H	4-pirimidilo	2	
6-92	H	2-tienilo	2	
6-93	H	3-tienilo	2	
6-94	H	2-furilo	2	
6-95	H	3-furilo	2	
6-96	H	2-tetrahidrofurilo	2	
6-97	H	3-tetrahidrofurilo	2	
6-98	H	3-pirazolilo	2	
6-99	H	4-pirazolilo	2	
6-100	H	5-pirazolilo	2	
6-101	H	2-imidazolilo	2	

92
43

Com N°	X	R ¹	n	p.f. (°C)/ ¹ H-NMR
6-102	H	4-imidazolilo	2	
6-103	H	5-imidazolilo	2	
6-104	H	2-tiazolilo	2	
6-105	H	4-tiazolilo	2	
6-106	H	5-tiazolilo	2	
6-107	H	2-tetrahidrotienilo	2	
6-108	H	2-pirrolilo	2	
6-109	H	3-pirrolilo	2	
6-110	H	4-pirrolilo	2	
6-111	H	1-tetrazolilo	2	
6-112	H	5-tetrazolilo	2	
6-113	H	3-(1,2,4)-tnazolilo	2	
6-114	H	5-(1,2,4)-triazolilo	2	
6-115	CH ₃	2-tienilo	2	
6-116	CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-117	CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-118	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	2-tienilo	2	
6-119	CH ₂ CHCH ₂	1-metil-4-imidazolilo	2	
6-120	CH ₂ CCH	1-metil-4-imidazolilo	2	
6-121	C(O)OCH ₃	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	2	
6-122	C(O)CH ₃	2,4-dimetil-5-tiazolilo	2	
6-123	CH ₂ OCH ₃	5-(2-pindil)-2-tienilo	2	
6-124	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	2-metil-5-CF ₃ -4-funilo	2	
6-125	CH ₂ cPr	2,5-dimetil-3-tienilo	2	
6-126	H	2-Cl-5-piridilo	2	2,65, d,3H, N-CH3

Tabla 7. Compuestos de la fórmula (Ib) en que R² = Cl; W = C-Cl, R³ = R⁶ = CF₃; m = 2; R⁴ = Y = H; R⁵ = CH₃

5

Com N°	X	R ¹	n	p.f. (°C)
7-1	H	2-pindilo	0	Acete
7-2	H	3-piridilo	0	
7-3	H	3-piridilo	0	
7-4	H	4-pindilo	0	
7-5	H	1-pirimidilo	0	
7-6	H	3-pirimidilo	0	
7-7	H	4-pirimidilo	0	
7-8	H	2-tienilo	0	

98
94

Com Nº	X	R ¹	n	p f (°C)
7-9	H	3-tienilo	0	
7-10	H	2-furilo	0	
7-11	H	3-funlo	0	
7-12	H	2-tetrahidrofunlo	0	
7-13	H	3-tetrahidrofunlo	0	
7-14	H	3-pirazolilo	0	
7-15	H	4-pirazolilo	0	
7-16	H	5-pirazolilo	0	
7-17	H	2-imidazolilo	0	
7-18	H	4-imidazolilo	0	
7-19	H	5-imidazolilo	0	
7-20	H	2-tiazolilo	0	
7-21	H	4-tiazolilo	0	
7-22	H	5-tiazolilo	0	
7-23	H	2-tetrahidrotienilo	0	
7-24	H	2-pirrolilo	0	
7-25	H	3-pirrolilo	0	
7-26	H	4-pirrolilo	0	
7-27	H	1-tetrazolilo	0	
7-28	H	5-tetrazolilo	0	
7-29	H	3-(1,2,4)-triazolilo	0	
7-30	H	5-(1,2,4)-triazolilo	0	
7-31	H	2-tienilo	0	
7-32	H	2-tienilo	0	
7-33	H	2-tienilo	0	
7-34	H	2-tienilo	0	
7-35	H	1-metil-4-imidazolilo	0	
7-36	H	1-metil-4-imidazolilo	0	
7-37	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	0	
7-38	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	0	
7-39	H	5-(2-pindil)-2-tienilo	0	
7-40	H	2-metil-5-CF ₃ -4-furilo	0	
7-41	H	2,5-dimetil-3-tienilo	0	
7-42	H	2-Cl-5-piridilo	0	
7-43	H	2-piridilo	1	
7-44	H	3-piridilo	1	
7-45	H	3-pindilo	1	
7-46	H	4-pindilo	1	
7-47	H	1-pirimidilo	1	
7-48	H	3-pirimidilo	1	
7-49	H	4-pirimidilo	1	
7-50	H	2-tienilo	1	

98/05

Com N°	X	R¹	n	p f (°C)
7-51	H	3-tienilo	1	
7-52	H	2-furilo	1	
7-53	H	3-furilo	1	
7-54	H	2-tetrahidrofurilo	1	
7-55	H	3-tetrahidrofurilo	1	
7-56	H	3-pirazolilo	1	
7-57	H	4-pirazolilo	1	
7-58	H	5-pirazolilo	1	
7-59	H	2-imidazolilo	1	
7-60	H	4-imidazolilo	1	
7-61	H	5-imidazolilo	1	
7-62	H	2-tiazolilo	1	
7-63	H	4-tiazolilo	1	
7-64	H	5-tiazolilo	1	
7-65	H	2-tetrahidrotienilo	1	
7-66	H	2-pirrolilo	1	
7-67	H	3-pirrolilo	1	
7-68	H	4-pirrolilo	1	
7-69	H	1-tetrazolilo	1	
7-70	H	5-tetrazolilo	1	
7-71	H	3-(1,2,4)-triazolilo	1	
7-72	H	5-(1,2,4)-triazolilo	1	
7-73	H	2-tienilo	1	
7-74	H	2-tienilo	1	
7-75	H	2-tienilo	1	
7-76	H	2-tienilo	1	
7-77	H	1-metil-4-imidazolilo	1	
7-78	H	1-metil-4-imidazolilo	1	
7-79	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	1	
7-80	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	1	
7-81	H	5-(2-pindilo)-2-tienilo	1	
7-82	H	2-metil-5-CF3-4-furilo	1	
7-83	H	2,5-dimetil-3-tiofenilo	1	
7-84	H	2-Cl-5-piridilo	1	
7-85	H	2-piridilo	2	
7-86	H	3-pindilo	2	
7-87	H	3-piridilo	2	
7-88	H	4-piridilo	2	
7-89	H	1-pirimidilo	2	
7-90	H	3-pirimidilo	2	
7-91	H	4-pirimidilo	2	
7-92	H	2-tienilo	2	

28
46

Com Nº	X	R¹	n	p.f. (°C)
7-93	H	3-tienilo	2	
7-94	H	2-furilo	2	
7-95	H	3-furilo	2	
7-96	H	2-tetrahidrofurilo	2	
7-97	H	3-tetrahidrofurilo	2	
7-98	H	3-pirazolilo	2	
7-99	H	4-pirazolilo	2	
7-100	H	5-pirazolilo	2	
7-101	H	2-imidazolilo	2	
7-102	H	4-imidazolilo	2	
7-103	H	5-imidazolilo	2	
7-104	H	2-tiazolilo	2	
7-105	H	4-tiazolilo	2	
7-106	H	5-tiazolilo	2	
7-107	H	2-tetrahidrotienilo	2	
7-108	H	2-pirrolilo	2	
7-109	H	3-pirrolilo	2	
7-110	H	4-pirrolilo	2	
7-111	H	1-tetrazolilo	2	
7-112	H	5-tetrazolilo	2	
7-113	H	3-(1,2,4)-triazolilo	2	
7-114	H	5-(1,2,4)-triazolilo	2	
7-115	H	2-tienilo	2	
7-116	H	2-tienilo	2	
7-117	H	2-tienilo	2	
7-118	H	2-tienilo	2	
7-119	H	1-metil-4-imidazolilo	2	
7-120	H	1-metil-4-imidazolilo	2	
7-121	H	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	2	
7-122	H	2,4-dimetil-5-tiazolilo	2	
7-123	H	5-(2-piridil)-2-tienilo	2	
7-124	H	2-metil-5-CF3-4-furilo	2	
7-125	H	2,5-dimetil-3-tienilo	2	
7-126	H	2-Cl-5-piridilo	2	
7-127	CH3	2-piridilo	1	Aceite
7-128	CH3	3-piridilo	0	
7-129	CH3	3-piridilo	0	
7-130	CH3	4-piridilo	0	

De acuerdo con una característica adicional del presente invento se proporciona un método para la represión de plagas en un sitio (locus), que comprende la aplicación de una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales. Con esta finalidad, dicho compuesto se usa normalmente en la forma de una
5 composición plaguicida (es decir en asociación con diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos compatibles apropiados para su uso en composiciones plaguicidas), por ejemplo tal como se describe a continuación

El término "compuesto del invento" tal como se usa seguidamente, abarca un
10 alquilaminopirazol sustituido en la posición 5 de la fórmula (I) como antes se ha definido y una de sus sales aceptables como plaguicidas

Un aspecto del presente invento como antes se ha definido es un método para la represión de plagas en un locus. El locus incluye, por ejemplo, la plaga propiamente
15 dicha, el sitio (planta, campo, bosque, huerta, vía acuática, suelo, producto vegetal, u otros similares) en donde la plaga reside o se alimenta, o un sitio susceptible de futura infestación por la plaga. El compuesto del invento se puede por lo tanto aplicar directamente a la plaga, al sitio donde la plaga reside o se alimenta, o al sitio susceptible de futura infestación por la plaga

20 Como es evidente a partir de los precedentes usos como plaguicidas, el presente invento proporciona compuestos activos como plaguicidas y métodos de uso de dichos compuestos para la represión de un cierto número de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos, o arácnidos, tales como ácaros, o nematodos de plantas. El compuesto del invento se puede por lo tanto emplear
25 ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en plantas cultivadas agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en medicina veterinaria o en la economía ganadera, o en la salud pública

Los compuestos del invento se pueden usar por ejemplo en las siguientes aplicaciones y sobre las siguientes plagas

30 Para la represión de insectos del suelo, tales como gusanos de raíces del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), ceras de raíces, larvas de escarabajos, gorgojos de raíces, perforadores de tallos, agrotis, áfidos de raíces,

- o gorgojos Se pueden usar también para proporcionar actividad contra nematodos patógenos de plantas, tales como nematodos de nudos de raíces, quistes, dagas, lesiones, o de tallos o bulbos, o contra ácaros. Para la represión de plagas del suelo, por ejemplo gusanos de raíces del maíz, los compuestos se aplican
- 5 ventajosamente al, o se incorporan con un régimen efectivo dentro del, suelo en el que las plantas útiles se plantan o se han de plantar o a las semillas o a las raíces de las plantas en crecimiento.
- En el sector de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en la represión de muchos insectos, especialmente moscas de inmundicias u otras plagas
- 10 de Dípteros, tales como moscas domésticas, moscas de establos, moscas de soldados, moscas de los cuernos, moscas de ciervos, moscas de caballos, jejenes, cuticoides (moscas de arena), moscas negras, o mosquitos.
- En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales, inclusive grano o hanna, cacahuets, piensos para animales, madera o mercancías y artículos de uso
- 15 doméstico, p.ej. alfombras y géneros textiles, los compuestos del invento son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, inclusive gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp. (polillas de harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de alfombras), *Tribolium* spp (escarabajos de harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de grano) o *Acarus* spp. (ácaros)
- 20 En la represión de cucarachas, hormigas o termitas o similares plagas de artrópodos en locales domésticos o industriales infestados o en la represión de larvas de mosquitos en vías acuáticas, pozos, depósitos u otras aguas circulantes o estancadas.
- Para el tratamiento de cimientos, de estructuras o del suelo en la prevención del
- 25 ataque a edificaciones por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp , *Heterotermes* spp , *Coptotermes* spp
- En la agricultura contra adultos, larvas y huevos de Lepidópteros (manposas y polillas), p.ej *Heliothis* spp. tales como *Heliothis virescens* (gusano o torcedora del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de Coleópteros
- 30 (escarabajos) p.ej *Anthonomus* spp p ej. *grandis* (gorgojo de cápsulas de algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de patata del Colorado), *Diabrotica* spp. (gusanos de raíces del maíz). Contra Heterópteros (Hemípteros y Homópteros) p.ej.

Psylla spp., *Bemisia* spp., *Tnaleurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltadores de hojas del arroz), *Nilaparvata* spp

Contra Dípteros p ej. *Musca* spp. Contra Tisanópteros tales como *Thrips tabaci*.

- 5 Contra Ortópteros tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos) p ej. *Gryllus* spp., y *Acheta* spp., por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Locusta migratoria migratornoides*, y *Schistocerca gregaria*.
Contra Colémbolos p ej *Periplaneta* spp y *Blattella* spp (cucarachas).

Contra artrópodos de importancia agrícola tales como Acari (ácaros) p ej

- 10 *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.

Contra nematodos que atacan a las plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura u horticultura ya sea directamente o por propagación de enfermedades de las plantas que son causadas por bacterias, virus, micoplasmas u hongos Por ejemplo nematodos de nudos de raíces tales como *Meloidogyne* spp

- 15 (p.ej *M. incognita*)

En el sector de la medicina veterinaria o de la economía ganadera o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parasitarios interna o externamente sobre vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo animales domésticos, p.ej reses de ganado vacuno, ovino, caprino, equino, porcino, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo Acarina, inclusive garrapatas (p.ej garrapatas de cuerpo suave inclusive *Argasidae* spp. p.ej. *Argas* spp y *Omithodorus* spp (p ej. *Omithodorus moubata*); garrapatas de cuerpo duro inclusive *Ixodidae* spp., p.ej. *Boophilus* spp. p.ej *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp. p.ej *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (p.ej.

- 25 *Damalinia* spp.); pulgas (p.ej. *Ctenocephalides* spp p.ej. *Ctenocephalides felis* (pulgas de gatos) y *Ctenocephalides canis* (pulgas de perros)), piojos p.ej. *Menopon* spp., Dípteros (p.ej. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemípteros; Dictiópteros (p ej *Periplaneta* spp, *Blattella* spp); Himenópteros, por ejemplo contra infecciones del tracto gastro-intestinal causadas por gusanos
30 nematodos parasitarios, por ejemplo miembros de la familia de los *Trichostrongylidae*

En un aspecto prefendo del invento, los compuestos de la fórmula (I) se usan para la represión de parásitos de animales. Preferiblemente el animal que se ha de tratar es un animal de compañía doméstico tal como un perro o un gato.

5

En un aspecto adicional del invento, los compuestos de la fórmula (I) o las sales o sus composiciones se usan para la preparación de un medicamento veterinario.

En el uso práctico para la represión de artrópodos, especialmente insectos o arácnidos, tales como ácaros, o plagas de nematodos de plantas, un método, por ejemplo, comprende aplicar, a las plantas o al medio en el que éstas crecen, una cantidad efectiva de un compuesto del invento. Para dicho método, el compuesto del invento consiste generalmente en aplicar al locus en el que se ha de reprimir la infestación por artrópodos o nematodos en un régimen efectivo situado en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea del locus tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga que se haya de reprimir, un régimen más bajo puede ofrecer una protección adecuada. Por otra parte, unas condiciones climáticas adversas, una resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el ingrediente activo se use en regímenes más altos. El régimen óptimo depende usualmente de un cierto número de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se esté reprimiendo, el tipo o la etapa de crecimiento de la planta infestada, la distancia entre hileras o también el método de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de regímenes efectivos del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, con más preferencia de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

Cuando una plaga está alojada en el suelo, el compuesto activo, generalmente en una composición formulada, es distribuido uniformemente sobre la zona que se ha de tratar (a saber, por ejemplo por esparcimiento o tratamiento de franjas) de cualquier manera conveniente y es aplicado a unos regímenes de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha (de ingrediente activo por hectárea), con preferencia de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha. Cuando se aplica a plántulas como una formulación para la inmersión de raíces o a plantas

- como una formulación para riego por goteo, la solución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1.000 mg ia/l (de ingrediente activo por litro), con preferencia de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ia/l. La aplicación puede hacerse, si se desea, al campo o
- 5 la zona en que están creciendo las plantas cultivadas generalmente o en íntima proximidad a la simiente o planta que se ha de proteger con respecto del ataque. El compuesto del invento puede ser introducido por lavado en el suelo mediante rociadura con agua sobre la zona o puede ser dejado a la acción natural de la precipitación de lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado
- 10 puede, si se desea, ser distribuido mecánicamente en el suelo, por ejemplo por cultivación con arado, con grada de discos, o uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede realizarse antes de plantar, al plantar, después de plantar pero antes de que haya tenido lugar el brote, o después del brote.
- El compuesto del invento y los métodos de represión de plagas con él tienen un
- 15 valor particular en la protección de plantas cultivadas del campo, de forraje, de plantación, de invernadero, de huerta o de viña, de plantas ornamentales, o de árboles de plantación o bosque, por ejemplo. cereales (tales como trigo o arroz), algodón, hortalizas (tales como pimientos), plantas cultivadas en el campo (tales como remolachas azucareras, plantas de soja o colza de semilla oleaginosa),
- 20 plantas cultivadas de prado o de forraje (tales como maíz o sorgo), plantas cultivadas de huerto o arboleda (tales como de frutas de hueso o pepita o frutas cítricas), plantas ornamentales, flores u hortalizas o arbustos cultivados en invernadero o en jardines o parques, o árboles de bosque (tanto de hoja caduca como perenne (siempre verde)) en bosques, plantaciones o viveros.
- 25 Ellos son también valiosos en la protección de madera (en pie, derribada, convertida, almacenada o en estructuras) con respecto del ataque, por ejemplo, por moscas de serrería o bien escarabajos o termitas.
- Ellos tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados tales como granos, frutas, nueces, especias o tabaco, ya sea enteros, molidos o formulados o
- 30 confeccionados como productos, con respecto del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de granos. También se protegen productos de animales almacenados tales como pieles, pelos, lana o plumas en forma natural o convertida

(p.ej. como alfombras o géneros textiles) con respecto del ataque de polillas o escarabajos así como carne, pescado o granos almacenados con respecto del ataque de escarabajos, ácaros o moscas

Adicionalmente, el compuesto del invento y los métodos de uso de él tienen un valor

- 5 particular en la represión de artrópodos o helmintos que son dañinos para los animales domésticos, o diseminan, o actúan como vectores de, enfermedades en animales domésticos, por ejemplo los que aquí se han mencionado anteriormente, y más especialmente en la represión de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, jejenes, o moscas mordedoras, molestas o de miasis. Los compuestos del invento son
- 10 particularmente útiles para reprimir artrópodos o helmintos que están presentes en el interior de animales anfitriones domésticos o que se alimentan en o sobre la piel, o chupan la sangre del animal, para cuya finalidad se pueden administrar por vía oral, parenteral, percutánea o tópica.

- Las composiciones seguidamente descritas para su aplicación a plantas cultivadas
- 15 en crecimiento o a sitios (loci) en los que crecen las plantas cultivadas, o como una formulación de desinfección de semillas se pueden emplear, en general, alternativamente en la protección de productos almacenados, mercancías y artículos domésticos, bienes, haciendas o zonas del medio ambiente o entorno general
- Medios apropiados para aplicar los compuestos del invento incluyen:

- 20 a plantas cultivadas en crecimiento como formulaciones para rociadura foliar (por ejemplo como una formulación para rociadura en el surco), polvos para espolvorear, granulados, fumigaciones o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas como tratamientos del suelo o de las raíces por formulaciones líquidas para empapar, polvos para espolvorear,
- 25 granulados, humos o espumas, a semillas de plantas cultivadas por medio de su aplicación como formulaciones de desinfección de semillas por suspensiones líquidas o polvos para espolvorear,

- a animales infestados por, o expuestos a infestación por artrópodos o helmintos, por aplicación parenteral, oral o tópica de composiciones en las que el ingrediente activo
- 30 exhibe una acción inmediata y/o prolongada durante un cierto período de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo por incorporación en piensos, alimentos o apropiadas formulaciones farmacéuticas ingeribles por vía oral, cebos

comestibles, bloques de sal para lamer, suplementos dietéticos, formulaciones para verter por encima, formulaciones para rociar o proyectar, baños, formulaciones para inmersión, formulaciones para ducha, formulaciones para chorros, polvos para espolvorear, grasas, champús, cremas, formulaciones de cera para untar o sistemas de auto-tratamiento por el ganado;

5 al medio ambiente en general o a lugares específicos en donde las plagas pueden esconderse, inclusive productos almacenados, madera, mercancías y artículos de uso doméstico, o locales domésticos o industriales, en forma de formulaciones para rociar, fumigaciones, polvos para espolvorear, humos, formulaciones de cera para untar, barnices, granulados o cebos, o en alimentos para gotear o escurrir en vías acuáticas, pozos, depósitos u otras aguas circulantes o estancadas

10

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente útiles para la represión de parásitos de animales cuando se aplican por vía oral, y en un aspecto prefendo adicionalmente del invento, los compuestos de la fórmula (I) se usan para la represión de parásitos de animales mediante aplicación por vía oral. Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se pueden administrar antes de, durante o después de las comidas. Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se pueden mezclar con un soporte o vehículo y/o un pienso o alimento

15

El compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales, se administra por vía oral en una dosis al animal en un intervalo de dosis situado generalmente entre 0,1 y 500 mg/kg del compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

20

La frecuencia de tratamiento del animal, preferiblemente del animal doméstico que se ha de tratar por el compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales, es en general desde aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez por año, con preferencia de aproximadamente desde una vez cada dos semanas hasta una vez cada tres meses.

25

Los compuestos del invento se pueden administrar de manera sumamente ventajosa junto con otro material efectivo como parasiticida, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tales como avermectinas o

30

milbemicinas p ej , ivermectina, piratel o un agente regulador del crecimiento de animales tal como lufenurón o metopreno.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear también para reprimir
5 organismos perjudiciales en plantas cultivadas de conocidas plantas tratadas por ingeniería genética plantas o plantas tratadas por ingeniería genética que todavía se hayan de desarrollar. Por regla general, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por resistencias a particulares
10 agentes de protección de plantas cultivadas, resistencias a enfermedades de plantas o a patógenos de enfermedades de plantas, tales como insectos o microorganismos particulares tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares conciernen, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, la calidad, las propiedades de almacenamiento, la composición y constituyentes específicos. Así, se conocen plantas transgénicas en
15 las que se ha aumentado el contenido de almidón, o se ha alterado la calidad del almidón, o en las que el material cosechado tiene una diferente composición de ácidos grasos

Se prefiere el uso en plantas cultivadas transgénicas económicamente importantes
20 de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o también plantas cultivadas de remolacha azucarera, algodón, soja, colza de semilla oleaginosa, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de hortalizas.

25 Cuando se usan en plantas cultivadas transgénicas, en particular las que tienen resistencias a insectos, además de los efectos contra organismos perjudiciales que se han de observar en otras plantas cultivadas, se observan frecuentemente efectos que son específicos para la aplicación en la planta cultivada transgénica en cuestión, por ejemplo un espectro alterado o específicamente ampliado de plagas
30 que se pueden reprimir, o regímenes alterados de aplicación, que se pueden emplear para la aplicación

El invento, por lo tanto, también se refiere al uso de compuestos de la fórmula (I) para reprimir organismos perjudiciales en plantas cultivadas transgénicas.

De acuerdo con una característica adicional del presente invento, se proporciona una composición plaguicida que comprende uno o más compuestos del invento como antes se han definido, en asociación con, y con preferencia dispersados homogéneamente en uno o más diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos compatibles aceptables en plaguicidas [es decir, diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica por ser apropiados para su uso en composiciones plaguicidas y que son compatibles con los compuestos del invento]

En la práctica, los compuestos del invento forman parte, con suma frecuencia, de composiciones. Estas composiciones se pueden emplear para reprimir artrópodos, especialmente insectos y arácnidos, tales como ácaros, o helmintos, tales como nematodos de plantas. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica, apropiadas para su aplicación la plaga deseada en cualesquiera locales o zonas de interiores y exteriores. Estas composiciones contienen por lo menos un compuesto del invento como el ingrediente activo en combinación o asociación con uno o más de otros componentes compatibles, que son, por ejemplo, vehículos o diluyentes, adyuvantes, agentes tensioactivos (con actividad superficial) sólidos o líquidos, u otros similares apropiados para el uso pretendido y que son aceptables agronómica o medicinalmente. Estas composiciones, que se pueden preparar de cualquier manera conocida en la técnica, forman similarmente una parte de este invento.

Los compuestos del invento, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como sustancias insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladoras del crecimiento o herbicidas.

108
106

Los plaguicidas incluyen, por ejemplo, ésteres de ácidos fosfóricos, carbamatos, ésteres de ácidos carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

5 Componentes preferidos en mezclas son:

1. entre el conjunto de los compuestos de fósforo

acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, bromofos, bromofos-etilo, cadusafos (F-67825), cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-
10 metilo, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metil sulfona, dialfos, diazinona, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, EPN, etián, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamfos, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofos, fonofos, formotión, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotioato, isoxatión, malatión, metacrfos, metamidofos, metidatión, salitión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato,
15 oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosfolano, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosfamidón, foxima, pirimfos, pirimfos-etilo, pirimfos-metilo, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclofos, pindapentión, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclovinfos, tiometón, triazofos, triclofón, vamidotión;

20

2. entre el conjunto de los carbamatos

alanicarb (OK-135), aldicarb, metilcarbamato de 2-sec-butilfenilo (BPMC), carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-
801, isoprocarb, metomilo, (metil)carbamato de 5-metil-m-cumenilbutirilo, oxamilo,
25 pirnicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, 1-metiltio(etilidenamino)-N-metil-N-(morfolinotio)carbamato (UC 51717), triazamato;

3 entre el conjunto de los ésteres de ácidos carboxílicos

acrinatrina, aletrina, alfametrina, (E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotolan-3-
30 ilidenmetil)ciclopropanocarboxilato de 5-bencil-3-funilmetilo, beta-ciflutrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina (isómero con (S)-ciclopentilo), bioresmetrina, bifentrina, (1RS)-trans-3-(4-terc.-butilfenil)-

- 2,2-dimetilciclopropano-carboxilato de (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metilo (NCI 85193), cicloprotrina, cflutrina, cihalotrina, cititrina, cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitnato, flumetrina, fluvalinato (isómero D), imiprotina (S-41311),
- 5 lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina (isómero ®), praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, teflutrina, tetrametrina, theta-cipermetrina, tralometrina, transflutrina, zeta-cipermetrina (F-56701),
4. entre el conjunto de las amidinas
- 10 amitraz, clordimeform;
- 5 entre el conjunto de los compuestos de estaño
- cihexatina, óxido de fenbutatina;
- 15 6 de otros tipos
- abamectina, ABG-9008, acetamiprida, acequinocilo, Anagrapha falcitera, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadiractina, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, bensultap, bifenazato, binapacnlo, BJL-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezina, camfecloro, cartap, clorobencilato, clorfenapir, clorfluazurón, 2-
- 20 (4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), clorfentezina, clorproxifen, cromafenozida, clotianidina, ciclopropanocarboxilato de 2-naftilmetilo (Ro12-0470), cromazina, diaclofeno (tiametoxam), diafenturón, DBI-3204, 2-cloro-N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)carbamoíl)-2-carboximidato de etilo, DDT, dicofol, diflubenzurón, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden)-2,4-xilidina,
- 25 dihidroximetildihidroxipirrolidina, dinobutón, dinocap, diofenolano, benzoato de emamectina, endosulfano, etiprol (sulfetiprol), etofenprox, etoxazol, fenazaquin, fenoxicarb, fipronilo, fluazurón, flumita (flufenzina, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difenil éter (MTI 800), virus de granulosis y polihedrosis nuclear, fenpiroximato, fentiocarb, fluacripinma, flubencimina, flubrocitrinato,
- 30 fluciclozurón, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, gamma-HCH, halfenozida, halofenprox, hexaflumurón (DE_473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnona (AC 217300), IKI-220, indoxacarb, ivermectina, L-14165,

imidacloprida, indoxacarb (DPX-MP062), kanemita (AKD-2023), lufenurón, M-020, M-020, metoxifenoza, milbemectina, NC-196, neemgard, nidinoterfuran, nitenpiram, 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcarbamalaldehído (WL 108477), novalurón, piridanlo, propargita, protrifenbute, pimetrozine, piridaben, pirimidifeno, piriproxifeno, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novalurón (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofeno, silomadina (CG-177), espinosad, espiroclorfen, SU-9118, tebufenoza, tebufenpirad, teflubenzurón, tetradifón, tetrasul, tiacloprida, tiociclam, tametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiaspinosina A, triflururón, verbutin, vertalec (mikotal), YI-5301.

Los componentes antes mencionados para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de las cuales se describen en la cita de Ch R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual [El Manual de los Plaguicidas], 12ª Edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000

Las dosis de uso efectivo de los compuestos empleados en el invento pueden variar dentro de amplios límites, dependiendo particularmente de la naturaleza de la plaga que se ha de eliminar o del grado de infestación, por ejemplo, de plantas cultivadas con estas plagas. En general, las composiciones de acuerdo con el invento contienen de manera usual de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos de acuerdo con el invento, de aproximadamente 1 a aproximadamente 95% de uno o más vehículos sólidos o líquidos y, de manera opcional, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 50% de uno o más otros componentes compatibles, tales como agentes tensioactivos u otros similares

En el presente contexto, el término "vehículo" designa a un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que el ingrediente activo se combina para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a las semillas o al suelo. Este vehículo es por lo tanto generalmente inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, agronómicamente aceptable, particularmente para la planta tratada).

El vehículo puede ser un material sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales triturados, tales como caolines, arcillas, talco, greda, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra de diatomeas, o minerales sintéticos triturados, tales como sílice, alúmina, o silicatos especialmente silicatos de aluminio o magnesio. Como vehículos sólidos para granulados son apropiados los siguientes: rocas naturales machacadas o fraccionadas tales como calcita, mármol, pómez, sepiolita y dolomita; granulados sintéticos de polvos finos (harinas) inorgánicos u orgánicos, granulados de materiales orgánicos tales como serrín, cáscaras de coco, carozos de maíz, bagazos de maíz o tallos de tabaco, kieselguhr (tierra de infusos), fosfato de tricalcio, corcho pulverizado, o negro de carbono absorbente, polímeros, resinas y ceras solubles en agua; o fertilizantes sólidos. Tales composiciones sólidas pueden contener, si se desea, uno o más agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o colorantes compatibles que, cuando son sólidos, pueden servir también como diluyentes.

El vehículo puede también ser líquido, por ejemplo: agua; alcoholes, particularmente butanol o un glicol, así como sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol; cetonas, particularmente acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, particularmente xilenos o alquil naftalenos, aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, particularmente tricloroetano o cloruro de metileno, hidrocarburos aromáticos clorados, particularmente clorobenzenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetil sulfóxido, o N-metilpirrolidona, gases licuados; u otros similares, o una de sus mezclas.

El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales agentes tensioactivos. Entre éstos se encuentran, p.ej., sales de poli(ácidos acrílicos), sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (particularmente alquilfenoles o anilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taunina

(particularmente alquiltauratos), ésteres de ácidos fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales sulfatos, sulfonatos o fosfatos de los anteriores compuestos. La presencia de por lo menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el ingrediente activo y/o el vehículo inerte son solo ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua y el agente vehículo de la composición para aplicación es agua.

Las composiciones del invento pueden contener además otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Se pueden usar en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en la forma de polvos, granulados o látices, tales como goma arábiga, un poli(alcohol vinílico) o poli(acetato de vinilo), fosfolípidos naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible usar agentes colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o Azul de Prusia; colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizanna, colorantes azoicos o colorantes de metales y ftalocianina; o nutrientes trazas tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o zinc

Para su aplicación en la agricultura, los compuestos del invento están por lo tanto generalmente en la forma de composiciones, que están en diversas formas sólidas o líquidas

Formas sólidas de composiciones que se pueden usar son polvos para espolvorear (con un cierto contenido del compuesto del invento, que fluctúa hasta llegar a un 80%), polvos humectables o granulados (inclusive granulados dispersables en agua), particularmente los obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un vehículo granular, o granulación partiendo de un polvo (estando situado el contenido del compuesto del invento, en estos polvos humectables o granulados, entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 80%). Composiciones homogéneas o heterogéneas sólidas, que contienen uno o más compuestos del invento, por ejemplo granulados, gránulos, brquetas o cápsulas, se pueden usar para tratar un agua estancada o circulante durante un cierto período de tiempo. Se puede conseguir un efecto similar usando alimentaciones por goteo o intermitentes de concentrados dispersables en agua como aquí se describen

- Las composiciones líquidas, por ejemplo, incluyen soluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, materiales capaces de fluir, dispersiones o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas incluyen también, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, materiales capaces de fluir, aerosoles, polvos humectables (o un polvo para proyectar), materiales secos capaces de fluir o pastas como formas de composiciones que son líquidas o están destinadas a formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo como rociadas acuosas (inclusive de volumen bajo y ultra-bajo) o como fumigaciones o aerosoles.
- 5
- 10 Las composiciones líquidas, por ejemplo, en la forma de concentrados emulsionables o solubles comprenden con suma frecuencia de aproximadamente 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones que están prestas para su aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo.
- 15 Junto al disolvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando se requiera, de aproximadamente 2 a aproximadamente 50% de apropiados aditivos, tales como estabilizadores, agentes tensioactivos, agentes de penetración, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Se pueden obtener emulsiones de cualquier concentración requerida, que son particularmente apropiadas para su aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones se incluyen dentro del alcance de las composiciones que se pueden emplear en el presente invento. Las emulsiones pueden estar en la forma de un tipo de agua en aceite o de aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.
- 20
- 25 Las composiciones líquidas de este invento, además de para aplicaciones normales de uso agrícola, se pueden usar por ejemplo para tratar sustratos o sitios infestados o susceptibles de infestación por artrópodos (o por otras plagas reprimidas por compuestos de este invento) inclusive locales, zonas, recipientes o equipos de almacenamiento o tratamiento en exteriores o interiores, o agua estancada o circulante.
- 30
- Todas estas dispersiones o emulsiones o mezclas para proyectar, acuosas, se pueden aplicar, por ejemplo, a plantas cultivadas por cualesquiera medios

apropiados, principalmente por proyección, a unos regímenes que generalmente son del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1 200 litros de mezcla de proyección por hectárea, pero pueden ser más altos o más bajos (p.ej de volumen bajo o ultra-bajo) dependiendo de la necesidad o aplicación técnica. El compuesto o las composiciones de acuerdo con el invento se aplican convenientemente a la vegetación y en particular a raíces u hojas que tienen plagas que se han de eliminar. Otro método de aplicación de los compuestos o de las composiciones de acuerdo con el invento es por quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo a un agua para irrigación. Esta irrigación puede ser una irrigación por aspersión para plaguicidas foliares o puede ser una irrigación por el suelo o una irrigación por el subsuelo para tierra o para plaguicidas sistémicos

Las suspensiones concentradas, que se pueden aplicar por proyección, se preparan de una manera tal que se produzca un producto fluido estable que no se sedimente (en fina trituración) y usualmente contienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de un ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30% de agentes tensioactivos, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10% de agentes tixótrpos, de aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de apropiados aditivos, tales como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizadores, agentes de penetración, adhesivos y, como vehículo, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es escasamente soluble o insoluble. Algunos materiales sólidos orgánicos o sales inorgánicas se pueden disolver en el vehículo para ayudar a evitar la sedimentación o como anticongelantes para el agua.

Los polvos humectables (o polvos para proyectar) se preparan usualmente de una manera tal que contengan de aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de un ingrediente activo, de aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de un vehículo sólido, de aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de un agente humectante, de aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de un agente dispersante y, cuando sea necesario, de aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizadores y/u otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes antiapelmazantes, colorantes, u otros similares.

Para obtener estos polvos humectables, el ingrediente activo se mezcla a fondo en un apropiado mezclador con sustancias adicionales que se pueden impregnar en el relleno poroso, y se tntura usando un molino u otro apropiado triturador. Esto produce polvos humectables, cuya humectabilidad y suspendibilidad son ventajosas

5 Éstos se pueden suspender en agua para dar cualquier concentración deseada y esta suspensión se puede emplear muy ventajosamente en particular para la aplicación al follaje de las plantas

Los "granulados dispersables en agua (WG)" (granulados que son fácilmente dispersables en agua) tienen unas composiciones que son sustancialmente

10 próximas a las de los polvos humectables. Éstos se pueden preparar por granulación de formulaciones descritas para los polvos humectables, ya sea por una vía húmeda (poniendo en contacto un ingrediente activo finamente dividido con el relleno inerte y con un poco de agua, p.ej. de 1 a 20% en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o un aglutinante, seguido por una desecación y un

15 tamizado), o por una vía seca (una compactación seguida por una trituración y un tamizado).

Los regímenes y las concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar de acuerdo con el método de aplicación o la naturaleza de las composiciones o su uso. Hablando en términos generales, las composiciones para su aplicación a

20 la represión de plagas de artrópodos o nematodos de plantas contienen de manera usual de aproximadamente 0,00001% a aproximadamente 95%, con más particularidad de aproximadamente 0,0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos del invento, o de los ingredientes activos totales (es decir, los compuestos del invento, junto con otras sustancias que sean tóxicas para

25 artrópodos o nematodos de plantas, agentes sinérgicos, elementos trazas (oligoelementos) o estabilizadores) Las composiciones reales empleadas y su régimen de aplicación se seleccionarán para conseguir el o los efecto(s) deseado(s) por el agncultor, el ganadero, el profesional médico o veterinario, el operano para la represión de plagas u otra persona experta en la técnica.

30 Las composiciones sólidas o líquidas para aplicación por vía tópica a animales, madera, productos almacenados o mercancías o artículos de uso doméstico contienen de manera usual de aproximadamente 0,00005% a aproximadamente

90%, con más particularidad de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos del invento Para la administración a animales por vía oral o parenteral, inclusive la vía percutánea de composiciones sólidas o líquidas, éstas contienen de manera normal de aproximadamente 0,1% a

5 aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos del invento. Los piensos medicados contienen de manera normal de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 3% en peso de uno o más compuestos del invento. Los concentrados o suplementos para mezclarse con piensos contienen de manera normal de aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, con preferencia de

10 aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, en peso de uno o más compuestos del invento Los bloques de sales minerales para lamer contienen de manera normal de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de la fórmula (I) o de una de sus sales aceptables como plaguicidas

Los polvos para espolvorear o las composiciones líquidas para su aplicación al

15 ganado, a mercancías, a locales o a zonas de exteriores pueden contener de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 15%, de manera más especial de aproximadamente 0,005% a aproximadamente 2,0%, en peso, de uno o más compuestos del invento. Las apropiadas concentraciones en aguas tratadas están situadas entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, con más

20 particularidad entre aproximadamente 0,001 ppm y aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos del invento, y se pueden usar de una manera terapéutica en piscicultura con apropiados períodos de tiempo de exposición. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, con preferencia de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 1,0%, en peso, de

25 uno o más compuestos del invento

Cuando se administran a vertebrados por vía parenteral, por vía oral o por vía percutánea o por otros medios, la dosificación de compuestos del invento dependerá de la especie, la edad, o la salud del vertebrado y de la naturaleza y del grado de su infestación real o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Una

30 única dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, con preferencia de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg, por kg de peso corporal del animal, o unas dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, con

preferencia de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg, por kg de peso corporal del animal por día, para medicación prolongada, es o son generalmente apropiadas por administración por vía oral o parenteral. Por uso de formulaciones o dispositivos de liberación prolongada, las dosis diarias requeridas durante un

5 período de tiempo de varios meses se pueden combinar y administrar a animales en una única ocasión

Los siguientes EJEMPLOS 2A - 2M de composiciones ilustran composiciones para usarse contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos de

10 plantas, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos del invento, tales como los que se describen en ejemplos de preparación. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A - 2M se pueden diluir cada una de ellas para dar una composición proyectable a unas concentraciones apropiadas para su uso en el campo. Descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para los que la

15 totalidad de los siguientes porcentajes están en tantos por ciento en peso), usados en los EJEMPLOS 2A - 2M de composiciones ejemplificados seguidamente, son como sigue

Nombre Comercial	Descripción Química
Ethylan BCP	Condensado de nonilfenol y óxido de etileno
20 Soprophor BSU	Condensado de triestrilfenol y óxido de etileno
Arylan CA	Una solución al 70% p/v de dodecibencenosulfonato de calcio
Solvesso 150	Disolvente aromático C10 ligero
Arylan S	Dodecibencenosulfonato de sodio
Darvan NO ₂	Lignosulfonato de sodio
25 Celite PF	Vehículo de silicato de magnesio sintético
Sopropon T36	Sales de sodio de poli(ácidos carboxílicos)
Rhodigel 23	Polisacárido goma de xantano
Bentone 38	Derivado orgánico de magnesio y montmorillonita
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

EJEMPLO 2A

Se prepara un concentrado soluble en agua con la siguiente composición

Ingrediente activo	7%
Ethylan BCP	10%
N-metilpirrolidona	83%

A una solución de Ethylan BCP disuelto en una porción de N-metilpirrolidona se le añade el ingrediente activo con calentamiento y agitación hasta que se disuelva. La

- 5 solución resultante se completa hasta el volumen deseado con el resto del disolvente

EJEMPLO 2B

Se prepara un concentrado emulsionable (EC) con la siguiente composición:

10	Ingrediente activo	25%(max)
	Soprophor BSU	10%
	Arylan CA	5%
	N-metilpirrolidona	50%
	Solvesso 150	10%

- 15 Los primeros tres componentes se disuelven en N-metilpirrolidona y a esto se le añade el Solvesso 150 para dar el volumen final

EJEMPLO 2C

Se prepara un polvo humectable (WP) con la siguiente composición:

Ingrediente activo	40%
Arylan S	2%
Darvan NO ₂	5%
Celite PF	53%

- 20 Los ingredientes se mezclan y trituran en un molino de martillos para dar un polvo con un tamaño de partículas de menos que 50 micrómetros.

116
117

EJEMPLO 2D

Se prepara una formulación acuosa capaz de fluir con la siguiente composición.

Ingrediente activo	40,00%
Ethylan BCP	1,00%
Sopropon T360	0,20%
Etilen glicol	5,00%
Rhodigel 230.	0,15%
Agua	53,65%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se trituran en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño medio de partículas de menos que 3 micrómetros

5

EJEMPLO 2E

Se prepara un concentrado para suspensión emulsionable con la siguiente composición:

Ingrediente activo	30,0%
Ethylan BCP	10,0%
Bentone 38	0,5%
Solvesso 150	59,5%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se trituran en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño medio de partículas de menos que 3 micrómetros.

10

EJEMPLO 2F

Se prepara un granulado dispersable en agua con la siguiente composición:

Ingrediente activo	30%
Darvan No 2	15%
Arylan S	8%
Celite PF	47%

Los ingredientes se mezclan, se reducen a un tamaño de micrómetros en un molino con energía de fluido y luego se granulan en un granulador rotatono por proyección con agua (hasta un 10%) Los granulados resultantes se secan en un secador de lecho fluidizado para eliminar el agua en exceso.

15

EJEMPLO 2G

Se prepara un polvo para espolvorear con la siguiente composición:

Ingrediente activo	de 1 a 10%
Polvo de talco superfino	de 99 a 90%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se trituran adicionalmente en lo necesario para conseguir un polvo fino Este polvo se puede aplicar a un locus de

- 5 infestación por artrópodos, por ejemplo vertederos de basura, productos almacenados, o mercancías o artículos de uso doméstico o animales infestados por, o en riesgo de infestación por, artrópodos para reprimir los artrópodos por ingestión oral Medios apropiados para distribuir el polvo para espolvorear en el locus de
- 10 dispositivos para el autotratamiento por el ganado.

EJEMPLO 2H

Se prepara un cebo comestible con la siguiente composición:

Ingrediente activo	de 0,1 a 1,0%
Harina de trigo	80%
Melaza	de 19,9 a 19%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se conforman como se requiere para dar una forma de cebo Este cebo comestible puede ser distribuido en un locus, por

15 ejemplo locales domésticos o industriales, p.ej. cocinas, hospitales o almacenes, o zonas de exteriores, infestadas por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para reprimir a los artrópodos por ingestión oral.

20 **EJEMPLO 2I**

Se prepara una formulación en solución con la siguiente composición:

Ingrediente activo	15%
Dimetil sulfóxido	85%

El ingrediente activo se disuelve en dimetil sulfóxido con mezclamiento y/o calentamiento como se requiera. Esta solución se puede aplicar por vía percutánea como una aplicación para verter por encima de animales domésticos infestados por

25 artrópodos o, después de una esterilización por filtración a través de una membrana

de poli(tetrafluoroetileno) (tamaño de poros 0,22 micrómetros), mediante inyección por vía parenteral, en un régimen de aplicación de desde 1,2 hasta 12 ml de solución por 100 kg de peso corporal del animal.

5 EJEMPLO 2J

Se prepara un polvo humectable con la siguiente composición

Ingrediente activo	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

- 10 El Ethylan BCP se absorbe sobre el Aerosil que luego se mezcla con los otros ingredientes y se tritura en un molino de martillos para dar un polvo humectable, que se puede diluir con agua hasta una concentración de desde 0,001% hasta 2% en peso del compuesto activo y aplicar a un locus de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas de dípteros o nematodos de plantas, por proyección, o a animales domésticos infestados por, o en nesgo de infestación por artrópodos, por proyección o inmersión, o mediante administración por vía oral en el agua para beber, para reprimir a los artrópodos

15

EJEMPLO 2K

Una composición de bolo con liberación lenta se forma a partir de granulados que contienen los siguientes componentes en porcentajes variables (similares a los descritos para las precedentes composiciones) dependiendo de las necesidades.

- Ingrediente activo
- Agente conferidor de densidad
- Agente de liberación lenta
- Aglutinante

- 20 Los ingredientes mezclados íntimamente se conforman como granulados, que son comprimidos a la forma de un bolo con un peso específico de 2 o más. Éste puede ser administrado por vía oral a animales domésticos rumiantes para retención dentro del retículo-rumen para dar una liberación lenta continua del compuesto activo

119
18

durante un período de tiempo prolongado para repnmir la infestación de los animales domésticos rumiantes por artrópodos.

EJEMPLO 2L

- 5 Se puede preparar una composición de liberación lenta en la forma de granulados, gránulos, briquetas u otros similares, con las siguientes composiciones:

Ingrediente activo de 0,5 a 25%
Poli(cloruro de vinilo) de 75 a 99,5%
Ftalato de dietilo (plastificante)

- Los componentes se mezclan y luego se conforman a apropiadas configuraciones mediante extrusión de masas fundidas o moldeo. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para la adición a un agua estancada o para su fabricación a la forma de collares o marbetes de orejas para su fijación a animales domésticos con el fin de repnmir plagas por liberación lenta.
- 10

EJEMPLO 2M

Se prepara un granulado dispersable en agua con la siguiente composición:

Ingrediente activo	85%(max)
Poli(vinilpirrolidona)	5%
Arcilla attapulgita	6%
Launi sulfato de sodio	2%
Glicerol	2%

- 15 Los ingredientes se mezclan como una suspensión al 45% con agua y se muelen en húmedo hasta un tamaño de partículas de 4 micrómetros, y luego se secan por atomización para eliminar el agua

MÉTODOS DE USO DE PLAGUICIDAS

- 20 Se realizaron los siguientes procesos de ensayo representativos, usando compuestos del invento, para determinar las actividades parasitcidas y plaguicidas de ciertos compuestos del invento

MÉTODO A Método de exploración para ensayar el carácter sistémico de compuestos contra *Ctenocephalides felis* (pulgas de gatos)

Se llenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Un cilindro de vidrio se cerró en un extremo con Parafilm y se colocó sobre la parte superior del recipiente de ensayo. La solución del compuesto de ensayo se introdujo luego con pipeta en una sangre de bovino y se añadió al cilindro de vidrio. Las *Ctenocephalides felis* tratadas se mantuvieron en este ensayo artificial con perros (sangre a 37°C, humedad relativa 40-60 %; *Ctenocephalides felis* a 20-22°C, humedad relativa 40-60 %) y se realizó una comprobación a las 24 y 48 horas después de la aplicación.

Los compuestos activos dieron una represión de por lo menos 90% de *Ctenocephalides felis* en una concentración de ensayo de 5 ppm o menos.

MÉTODO B Exploración de *Diabrotica undecimpunctata* (gusano de raíces de maíz del Sur)

Dos días antes de la aplicación, semillas de maíz se empaparon en agua en condiciones moderadamente calientes para provocar una germinación rápida. Un día antes de la aplicación, se transfirieron huevos de *Diabrotica undecimpunctata* a una mitad de un papel de filtro de Japón colocado en una cápsula de Petri de material plástico. Después de esto, una semilla brotada de maíz se colocó sobre una almohadilla humedecida situada junto al papel de filtro. Tres gotas de 200 microlitros de la solución del compuesto de ensayo se añadieron cuidadosamente con una pipeta sobre el huevo. El resto de la solución se colocó sobre el maíz y luego se cerró la cápsula de Petri. Los huevos tratados en las cápsulas de Petri se mantuvieron en una cámara climatizada durante 6 días. La eficacia del compuesto (porcentaje de huevos y/o larvas que habían muerto en comparación con un testigo sin tratar) se comprobó 6 días después de la aplicación usando un microscopio binocular.

Los compuestos activos dieron una represión de por lo menos 90% de *Diabrotica undecimpunctata* en una concentración de ensayo de 10 ppm.

MÉTODO C Exploración de Nephrotettix Cincticeps (saltador de las hojas del arroz)

Las hojas de 12 plantas de arroz que tenían una longitud de tallo de 8 cm se sumergieron durante 5 segundos en una solución acuosa del compuesto de ensayo formulado. Después de que la solución se hubo escurrido, las plantas de arroz

- 5 tratadas de esta manera se colocaron en una cápsula de Petri y se poblaron con aproximadamente 20 larvas (en la etapa L3) de Nephrotettix cincticeps. La cápsula de Petri se cerró y luego se almacenó en una cámara climatizada (16 horas de luz/día, 25°C, humedad relativa 40-60%). Después de un almacenamiento durante 6 días, se determinó el porcentaje de mortalidad de las larvas del saltador de las
- 10 hojas

Los compuestos activos dieron una mortalidad de por lo menos 98% de larvas de Nephrotettix cincticeps en una concentración de ensayo de 100 ppm.

MÉTODO D Método de exploración para ensayar la actividad por contacto contra

- 15 Ctenocephalides felis (pulga de gatos)

Soluciones de los compuestos de ensayo se dejaron caer gota a gota sobre un papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó dentro de tubos de ensayo y se infestó con 10 adultos de Ctenocephalides felis. Las Ctenocephalides felis tratadas se mantuvieron en una cámara climatizada (26°C, HR (humedad relativa)

20 80%) y se comprobó el porcentaje de eficacia a las 24 horas y 48 horas después de la aplicación en comparación con el testigo sin tratar.

Los compuestos activos dieron una represión por contacto de por lo menos 70% de Ctenocephalides felis en una concentración de ensayo de 1 000 ppm.

- 25 **MÉTODO E Método de exploración para ensayar la actividad por contacto contra Rhipicephalus sanguineus (garrapata parda de perros)**

Soluciones de los compuestos de ensayo se dejaron caer gota a gota sobre un papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó dentro de tubos de ensayo y se infestó con 20-30 larvas (L1) de Rhipicephalus sanguineus y los tubos se

30 cerraron con una pinza. Las Rhipicephalus sanguineus tratadas se mantuvieron en una cámara climatizada (25°C, HR 90%) y se comprobó el porcentaje de eficacia a las 24 horas después de la aplicación en comparación con el testigo sin tratar

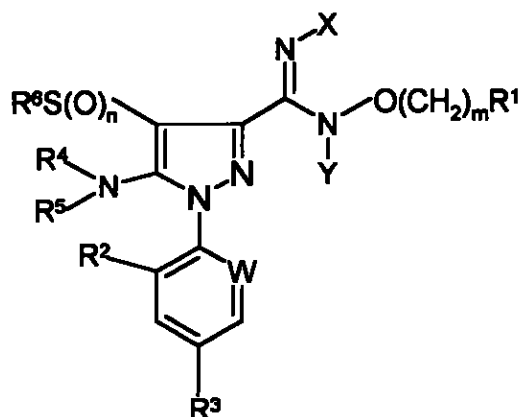
Los compuestos activos dieron una represión por contacto de por lo menos 70% de *Rhipicephalus sanguineus* en una concentración de ensayo de 100 ppm.

5 Los siguientes números de Compuestos fueron activos en uno o más de los anteriores ensayos:

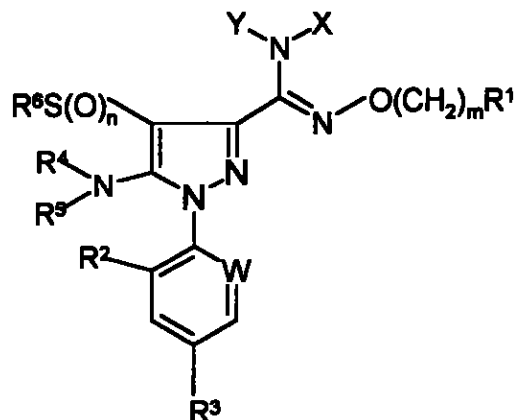
1-49, 3-25, 4-82, 4-93, 4-101, 4-114, 4-115, 4-117, 4-121, 4-128, 4-136, 4-144, 4-152, 4-153, 5-1, 6-2, 6-42, 7-1, 7-127.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (Ia) o (Ib).



(Ia)



(Ib)

5 en las que.

R^1 es anilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{15} ; o es R^{10} ó R^{19} ;

X e Y son, cada uno independientemente, H, alquenilo (C_3-C_6), haloalquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), haloalquinilo (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), $CONR^7R^8$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^7$,

10 $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 , SO_2R^{13} ó COR^{17} , o alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

W es N, C- CH_3 ó C-halógeno;

R^2 es hidrógeno, CH_3 o halógeno,

R^3 es halo, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), $S(O)_p$ -haloalquilo (C_1-C_3) ó SF_5 ;

15 R^4 es H, alquenilo (C_3-C_6), haloalquenilo (C_3-C_6), alquinilo (C_3-C_6), haloalquinilo (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), $-CO_2$ -cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2$ -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2$ -alquenilo (C_3-C_6), $-CO_2-(CH_2)_qR^7$, $CONR^8R^9$, $-CO_2-(CH_2)_qR^{10}$, $-(CH_2)_qR^7$, $-(CH_2)_qR^{10}$, COR^8 ó $COCH_2O$ -alquilo (C_1-C_4), o alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{11} ;

20 R^5 es H, alquinilo (C_2-C_6), $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) ó $-SO_2R^{12}$, o alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o CO -alquilo (C_1-C_6) cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{11} ;

R^8 y R^{13} son, cada uno independientemente, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6), haloalquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), haloalquinilo (C_2-C_6) o cicloalquilo (C_3-C_7);

- 5 R^7 es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$ y NR^9R^{14} ,

R^8 es H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7), $-(CH_2)_qR^7$ ó $-(CH_2)_qR^{10}$,

- 10 R^8 y R^{14} son, cada uno independientemente, H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) o -alquil (C_1-C_4)-cicloalquilo (C_3-C_7); o

R^8 y R^9 conjuntamente con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene en el anillo un heteroátomo adicional que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo

- 15 (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y halógeno;

R^{10} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), $S(O)_pR^{13}$, OH y oxo;

- 20 R^{11} es halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_pR^{13}$, $-CO_2$ -alquilo (C_1-C_6), $-O(C=O)$ -alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6), CO-haloalquilo (C_1-C_6), NR^8R^9 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, CN, NO_2 , OR^7 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$ ó OR^{10} ,

- 25 R^{12} es cicloalquilo (C_3-C_7), alquenilo (C_2-C_6), haloalquenilo (C_2-C_6) o R^{10} ; o fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre R^{15} , o es alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alqueniloxi (C_3-C_6), haloalqueniloxi (C_3-C_6), alquiniloxi (C_3-C_6), haloalquiniloxi (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_pR^7$, $S(O)_pR^{10}$, $S(O)_pR^{13}$, CN, NO_2 , OH, COR^8 , NR^8COR^{14} , $NR^8SO_2R^{13}$, $CONR^8R^9$, NR^8R^9 , OR^7 , OR^{10} , R^{16} , R^{10} y CO_2R^8 ;

- 30 R^{15} es halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, R^7 , SF_5 , OH, OR^7 , R^{18} , OR^{18} , SO_3H o alquiliden (C_1-C_6)-imino;

R^{16} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, SO_3H y alquiliden (C_1-C_6)-imino;

- 5 R^{17} es alquilo (C_1-C_6) que está sustituido con alcoxi (C_1-C_6), $S(O)_p$ -alquilo (C_1-C_6) o $S(O)_p$ -haloalquilo (C_1-C_6),

R^{18} es un radical heteroaromático seleccionado entre el conjunto que consiste en pindilo, pinmidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, funilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos
10 están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6),

R^{19} es un radical heteroaromático seleccionado entre el conjunto que consiste en piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo,
15 oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6), y cuyo radical heteroaromático está sustituido con R^7 , R^{18} ó OR^7 ;

m es 1 ó 2;

- 20 n y p son, cada uno independientemente, cero, uno o dos;

q es cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el conjunto que consiste en N, O y S;

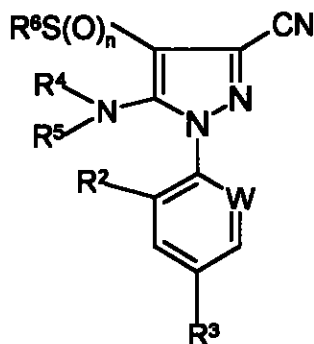
- 25 o una de sus sales aceptables como plaguicidas

2. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1, en el o la que R^1 es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre el conjunto que consiste en halógeno, alquilo (C_1-C_6),
30 haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{13}$, NR^8R^9 , COR^{13} y $CONR^8R^9$; y en que

126
127

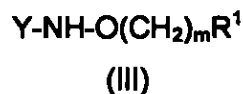
- R⁸ y R⁹ son, cada uno independientemente, H o alquilo (C₁-C₆), o R⁸ y R⁹ conjuntamente con el átomo de N unido, forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que opcionalmente contiene en el anillo un heteroátomo adicional que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más**
- 5 radicales alquilo (C₁-C₃);**
y R¹³ es alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃).
- 3. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1 ó 2, en el o la que X e Y son, cada uno independientemente, H, alquilo (C₁-C₆) o CO-**
- 10 alquilo (C₁-C₆).**
- 4 Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1, 2 o 3, en el o la que W es C-Cl**
- 15 5. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el o la que R² es Cl**
- 6. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el o la que R³ es CF₃.**
- 20 7. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el o la que R⁴ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆), -alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₇), COCH₂O-alquilo (C₁-C₄), -alquil (C₁-C₆)-S(O)_p-alquilo (C₁-C₆) o -CH₂R⁷, en**
- 25 que R⁷ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados entre halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), CN, NO₂ y S(O)_pR¹³, y R¹³ es alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃).**
- 8. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el o la que R⁵ es H, alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₃-C₆), alquinilo (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-alquilo (C₁-C₆) o -alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₇).**
- 30**

- 9 Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en el o la que R^6 es CF_3
- 5 10 Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el o la que m es 1
- 11 Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el o la que R^1 es fenilo,
- 10 X e Y son, cada uno independientemente, H, metilo o acetilo,
W es C-Cl,
 R^2 es Cl,
 R^3 y R^6 son cada uno CF_3 ;
 R^4 y R^5 son, cada uno independientemente, H, metilo, etilo, alilo, propargilo,
15 ciclopropilo, bencilo, ciclopropilmetilo, metiltioetilo, etoxiacetilo o etoxycarbonilo, y
m es 1
12. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales como se han definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a
20 11, cuyo procedimiento comprende
- a) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es H, m y R^1 son como se han definido en la reivindicación 1, Y es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II).



(II)

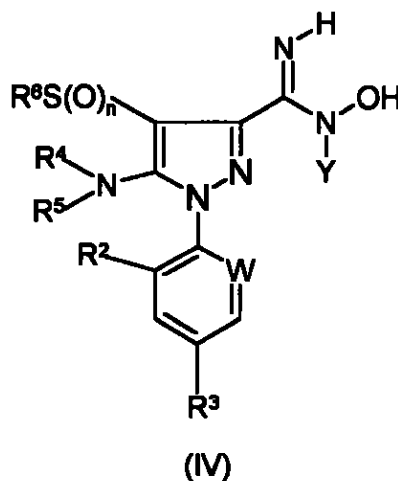
en la que R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W y n son como se han definido en la reivindicación 1, con un compuesto de la fórmula (III):



5 en la que R^1 y m son como se han definido en la reivindicación 1, e Y es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H ; o

b) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es H , m y R^1 son como se han definido en la reivindicación 1, Y es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H , y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, hacer

10 reaccionar un compuesto de la fórmula (IV):



en la que los diversos símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, con un compuesto de la fórmula (V):



en la que R^1 y m son como se han definido en la reivindicación 1 y L es un grupo lábil; o

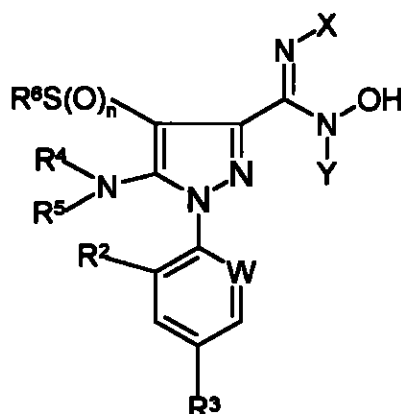
c) cuando (I) es una fórmula (Ia), X es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H , y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de la fórmula (Ia) en la que X es H , usando un compuesto de la fórmula (VI):



en la que X es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H , y L^1 es un grupo lábil; o

25

d) cuando (I) es una fórmula (Ia), X, Y y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, la reacción de un compuesto de la fórmula (VII):



(VII)

- 5 en la que los diversos símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, con un compuesto de la fórmula (V) como antes se ha definido; o
- e) cuando (I) es una fórmula (Ib), X e Y son cada uno H, y m, R^1 y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, la reacción de un compuesto de la fórmula (II) como se ha definido en la reivindicación 1, con un
- 10 compuesto de la fórmula (VIII):



(VIII)

en la que R^1 y m son como se han definido en la reivindicación 1; o

- f) cuando (I) es una fórmula (Ib), X es H, Y es como se ha definido en la
- 15 reivindicación 1, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del correspondiente compuesto de la fórmula (Ib) en la que Y es H, usando un compuesto de la fórmula (IX):



- 20 en la que Y es como se ha definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H, y L^2 es un grupo lábil, o

g) cuando (I) es una fórmula (Ib), X e Y son como se han definido en la reivindicación 1, con la exclusión de H, y los otros símbolos son como se han definido en la reivindicación 1, la alquilación, acilación o sulfonilación del

correspondiente compuesto de la fórmula (Ib) en la que X es H, usando un compuesto de la fórmula (VI) como se ha definido en la reivindicación 1, o

h) cuando R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , W, X, Y y m son como se han definido en la reivindicación 1, y n es 1 ó 2, oxidar un correspondiente compuesto en el que n es 0

5 ó 1; y

i) si se desea, convertir un resultante compuesto de la fórmula (I) en una de sus sales aceptables como plaguicidas

13. Una composición plaguicida que comprende un compuesto de la fórmula (I) o
10 una de sus sales aceptables como plaguicidas como se han definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en asociación con un diluyente o vehículo y/o agente tensioactivo aceptable como plaguicida.

14. El uso de un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales de acuerdo con
15 una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición de acuerdo con la reivindicación 13, para la preparación de un medicamento veterinario.

15 El uso de un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición de acuerdo con
20 la reivindicación 13, para la preparación de un medicamento veterinario para reprimir plagas

16 Un método para la represión de plagas en un locus, que comprende la aplicación de una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula (I) o una de sus
25 sales como se reivindican en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 o de una composición como se reivindica en la reivindicación 13.

PCT

ANTRAG

Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird

PCT/EP 03/14620

Internationales Aktenzeichen

12 NOV 2003

Internationales Anmeldedatum

(12 11 2003)

EUROPEAN PATENT OFFICE

Name des Erfinders und des Anmelders "PCT INTERNATIONAL APPLICATION"

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts (falls gewünscht)
(max 12 Zeichen) BCS 02-1005

Feld Nr. I BEZEICHNUNG DER ERFINDUNG

Pesticidal Compositions of Matter

Feld Nr. II ANMELDER

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

Bayer CropScience S A
55 avenue René Cassin
69009 Lyon
Frankreich

☐ Diese Person ist gleichzeitig Erfinder

Telefonnr (069) 305-7427

Telefaxnr (069) 305 2200

Fernschreiber

Staatsangehörigkeit (Staat)

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

FR

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ alle Bestimmungsstaaten☒ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☐ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

DÖLLER, Uwe
Christian-Morgenstern-Straße 11
63110 Rodgau
Deutschland

Diese Person ist

☐ nur Anmelder☒ Anmelder und Erfinder☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat)

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ Alle Bestimmungsstaaten☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten☒ Weitere Anmelder und/oder (weitere) Erfinder sind auf einem Fortsetzungsblatt angegeben

Feld Nr. IV ANWALT ODER GEMEINSAMER VERTRETER; ODER ZUSTELLANSCHRIFT

Die folgende Person wird hiermit bestellt/ist bestellt worden, um für den (die) Anmelder vor den zuständigen internationalen Behörden in folgender Eigenschaft zu handeln als

☒ Anwalt☐ gemeinsamer Vertreter

Name und Anschrift

(Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben.)

RIPPEL, Hans Christoph
Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung
Industriepark Höchst, Gebäude K 607
D-65926 Frankfurt
Deutschland

Telefonnr

(069) 305-7427

Telefaxnr

(069) 305 2200

Fernschreiber

☐ Zustellanschrift: Dieses Kästchen ist anzukreuzen, wenn kein Anwalt oder gemeinsamer Vertreter bestellt ist und statt dessen im obigen Feld eine spezielle Zustellanschrift angegeben ist

Fortsetzung von Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER

Wird keines der folgenden Felder benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

HOBALD, Klaus Dieter
Kolwitzweg 29
64546 Morfelden-Waldorf
Deutschland

Diese Person ist

- ☐ nur Anmelder
- ☒ Anmelder und Erfinder
- ☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig)

Staatsangehörigkeit (Staat)

DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ Alle Bestimmungsstaaten☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

MAIER, Michael
Neu Zeilsheim 78
69331 Frankfurt am Main
Deutschland

Diese Person ist

- ☐ nur Anmelder
- ☒ Anmelder und Erfinder
- ☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig)

Staatsangehörigkeit (Staat)

DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ Alle Bestimmungsstaaten☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

KUHLMANN, Anke
Bern 12
799 Leichlingen
Deutschland

Diese Person ist

- ☐ nur Anmelder
- ☒ Anmelder und Erfinder
- ☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig)

Staatsangehörigkeit (Staat)

DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ Alle Bestimmungsstaaten☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

Name und Anschrift (Familienname, Vorname, bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

SEEGER, Karl
Schwalbenweg 9
65719 Hofheim, Ts.
Deutschland

Diese Person ist

- ☐ nur Anmelder
- ☒ Anmelder und Erfinder
- ☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig)

Staatsangehörigkeit (Staat)

DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat)

DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten

☐ Alle Bestimmungsstaaten☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten☐ Weitere Anmelder und/oder (weitere) Erfinder sind auf einem zusätzlichen Fortsetzungsblatt angegeben

Feld Nr. V BESTIMMUNG VON STAATEN Bitte die entsprechenden Kästchen ankreuzen, wenigstens ein Kästchen muß angekreuzt werden

Die folgenden Bestimmungen nach Regel 4.9 Absatz a werden hiermit vorgenommen

Regionales Patent

- ☒ AP ARIPO-Patent: GH Ghana, GM Gambia, KE Kenia, LS Lesotho, MW Malawi, MZ Mosambik, SD Sudan, SL Sierra Leone, SZ Swasiland, TZ Vereinigte Republik Tansania, UG Uganda, ZM Sambia, ZW Simbabwe und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Harare-Protokolls und des PCT ist (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben)
- ☒ EA Eurasisches Patent: AM Armenien, AZ Aserbaidschan, BY Belarus, KG Kirgisistan, KZ Kasachstan, MD Republik Moldau, RU Russische Föderation, TJ Tadschikistan, TM Turkmenistan und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Eurasischen Patentabkommens und des PCT ist
- ☒ EP Europäisches Patent: AT Österreich, BE Belgien, BG Bulgarien, CH & LI Schweiz und Liechtenstein, CY Zypern, CZ Tschechische Republik, DE Deutschland, DK Dänemark, EE Estland, ES Spanien, FI Finnland, FR Frankreich, GB Vereinigtes Königreich, GR Griechenland, HU Ungarn, IE Irland, IT Italien, LU Luxemburg, MC Monaco, NL Niederlande, PT Portugal, RO Rumänien, SE Schweden, SI Slowenien, SK Slowakei, TR Türkei und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Europäischen Patentabkommens und des PCT ist
- ☒ OA OAPI-Patent: BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Zentralafrikanische Republik, CG Kongo, CI Côte d'Ivoire, CM Kamerun, GA Gabun, GN Guinea, GQ Äquatorialguinea, GW Guinea-Bissau, ML Mali, MR Mauretanien, NE Niger, SN Senegal, TD Tschad, TG Togo und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat der OAPI und des PCT ist (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben)

Nationales Patent (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben)

- | | | |
|---|--|---|
| ☒ AE Vereinigte Arabische Emirate | ☒ HR Kroatien | ☒ OM Oman |
| ☒ AG Antigua und Barbuda | ☐ HU Ungarn | ☒ PG Papua-Neuguinea |
| ☒ AL Albanien | ☒ ID Indonesien | ☒ PH Philippinen |
| ☒ AM Armenien | ☒ IL Israel | ☒ PL Polen |
| ☐ AT Österreich | ☒ IN Indien und "Black Box" | ☐ PT Portugal |
| ☒ AU Australien | ☒ IS Island | ☐ RO Rumänien |
| ☒ AZ Aserbaidschan | ☒ JP Japan | ☒ RU Russische Föderation |
| ☒ BA Bosnien-Herzegowina | ☐ KE Kenia | ☒ SC Seychellen |
| ☒ BB Barbados | ☒ KG Kirgisistan | ☐ SD Sudan |
| ☐ BG Bulgarien | ☒ KP Demokratische Volksrepublik Korea | ☐ SE Schweden |
| ☒ BR Brasilien | ☒ KR Republik Korea | ☒ SG Singapur |
| ☒ BY Belarus | ☒ KZ Kasachstan | ☐ SK Slowakei |
| ☒ BZ Belize | ☒ LC Saint Lucia | ☐ SL Sierra Leone |
| ☒ CA Kanada | ☒ LK Sri Lanka | ☒ SY Arabische Republik Syrien |
| ☐ CH & LI Schweiz und Liechtenstein | ☒ LR Liberia | ☒ TJ Tadschikistan |
| ☒ CN China | ☐ LS Lesotho | ☒ TM Turkmenistan |
| ☒ CO Kolumbien | ☒ LT Litauen | ☒ TN Tunesien |
| ☒ CR Costa Rica | ☐ LU Luxemburg | ☐ TR Türkei |
| ☒ CU Kuba | ☒ LV Lettland | ☒ TT Trinidad und Tobago |
| ☐ CZ Tschechische Republik | ☒ MA Marokko | ☐ TZ Vereinigte Republik Tansania |
| ☐ DE Deutschland | ☒ MD Republik Moldau | ☒ UA Ukraine |
| ☐ DK Dänemark | ☒ MG Madagaskar | ☐ UG Uganda |
| ☒ DM Dominica | ☒ MK Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien | ☒ US Vereinigte Staaten von Amerika |
| ☒ DZ Algerien | ☒ MN Mongolei | ☒ UZ Usbekistan |
| ☒ EC Ecuador | ☐ MW Malawi | ☒ VC St. Vincent und die Grenadinen |
| ☐ EE Estland | ☒ MX Mexiko | ☒ VN Vietnam |
| ☐ ES Spanien | ☐ MZ Mosambik | ☒ YU Serbien und Montenegro |
| ☐ FI Finnland | ☒ NI Nicaragua | ☒ ZA Südafrika |
| ☐ GB Vereinigtes Königreich | ☒ NO Norwegen | ☐ ZM Sambia |
| ☒ GD Grenada | ☒ NZ Neuseeland | ☐ ZW Simbabwe |
| ☒ GE Georgien | | |
| ☐ GH Ghana | | |
| ☐ GM Gambia | | |

Kästchen für die Bestimmung von Staaten, die dem PCT nach der Veröffentlichung dieses Formblatts beigetreten sind

- ☒ EG Ägypten ☐ ☐

Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen. Zusätzlich zu den oben genannten Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der im Zusatzfeld genannten Bestimmungen, die von dieser Erklärung ausgenommen sind. 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 (Die Bestätigung (einschließlich der Gebühren) muß beim Anmeldeamt innerhalb der Frist von 15 Monaten eingehen.)

Feld Nr. VI PRIORITÄTSANSPRUCH

☐ Weitere Prioritätsansprüche sind im Zusatzfeld angegeben

Anmeldedatum der früheren Anmeldung (Tag/Monat/Jahr)	Aktenzeichen der früheren Anmeldung	Ist der frühere Anmeldung eine		
		nationale Anmeldung Staat	regionale Anmeldung * regionales Amt	internationale Anmeldung Anmeldeamt
Zeile(1) 13. Dezember 2002 (13.12.02)	02027064 1	EP		
Zeile(2)				
Zeile(3)				

☐ Das Anmeldeamt wird ersucht, eine beglaubigte Abschrift der oben in der (den) Zeile(n) _____ bezeichneten früheren Anmeldung(en) zu erstellen und dem internationalen Büro zu übermitteln (nur falls die frühere Anmeldung(en) bei dem Amt eingereicht worden ist(sind), das für die Zwecke dieser internationalen Anmeldung Anmeldeamt ist)

* Falls es sich bei der früheren Anmeldung um eine ARIPO-Anmeldung handelt, so muß in dem Zusatzfeld mindestens ein Staat angegeben werden, der Mitgliedstaat der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung eingereicht wurde

Feld Nr. VII INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

Wahl der internationalen Recherchenbehörde (ISA)
(falls zwei oder mehr als zwei internationale Recherchen-
behörden für die Ausführung der internationalen Recherche
zuständig sind, geben Sie die von Ihnen gewählte Behörde an,
der Zweibuchstaben-Code kann benutzt werden)

ISA /

Antrag auf Nutzung der Ergebnisse einer früheren Recherche; Bezugnahme auf diese frühere Recherche (falls eine frühere Recherche bei der internationalen Recherchenbehörde beantragt oder von ihr durchgeführt worden ist)

Datum (Tag/Monat/Jahr)
28.05.2003

Aktenzeichen
02027064

Staat(oder regionales Amt)
EP

Feld Nr. VIII KONTROLLISTE; EINREICHUNGSSPRACHE

Diese internationale Anmeldung enthält die folgende Anzahl von Blättern:	Dieser internationalen Anmeldung liegen die nachstehend angekreuzten Unterlagen bei:
Antrag 4	1 ☒ Blatt für die Gebührenberechnung
Beschreibung(ohne Sequenzprotokollteil) 88	2 ☒ Gesonderte unterzeichnete Vollmacht
Ansprüche 8	3 ☐ Kopie der allgemeinen Vollmacht, Aktenzeichen (falls vorhanden)
Zusammenfassung 1	4 ☐ Begründung für das Fehlen einer Unterschrift
Zeichnungen Sequenzprotokollteil der Beschreibung	5 ☒ Prioritätsbeleg(e), in Feld Nr. VI durch folgende Zeilennummer gekennzeichnet
Blattzahl insgesamt: 81	6 ☐ Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache
Abbildung der Zeichnungen, die mit der Zusammenfassung veröffentlicht werden soll (Nr.)	7 ☐ Gesonderte Angaben zu hinterlegten Mikroorganismen oder anderem biologischen Material
	8 ☐ Protokoll der Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzen in computerlesbarer Form
	9 ☐ Sonstige (einzeln auflisten)
	Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht wird, Englisch

Feld Nr. IX UNTERSCHRIFT DES ANMELDERS ODER DES ANWALTS

Der Name jeder unterzeichnenden Person ist neben der Unterschrift zu wiederholen, und es ist anzugeben, sofern sich dies nicht eindeutig aus dem Antrag ergibt, in welcher Eigenschaft die Person unterzeichnet


Dr. Rippel
(Anwalt)

Vom Anmeldeamt auszufüllen

1 Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung	12 NOV 2003	12.11.03	2 Zeichnungen ☐ eingegangen ☐ nicht eingegangen
3 Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingegangener Unterlagen oder Zeichnungen zur Vervollständigung dieser internationalen Anmeldung			
4 Datum des fristgerechten Eingangs der angeforderten Richtigstellungen nach Artikel 11(2) PCT			
5 Internationale Recherchenbehörde (falls zwei oder mehr zuständig sind) ISA/	6 ☐ Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben		

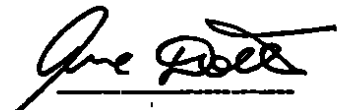
Vom Internationalen Büro auszufüllen

Datum des Eingangs des Aktenexemplars
beim Internationalen Büro

Zusatzfeld Wird dieses Zusatzfeld nicht benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden

- 1 Wenn der Platz in einem Feld nicht für alle Angaben ausreicht In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. . " [Nummer des Feldes angeben] und machen die Angaben entsprechend der in dem Feld, in dem der Platz nicht ausreicht, vorgeschriebenen Art und Weise, insbesondere:
- (i) Wenn mehr als zwei Anmelder und/oder Erfinder vorhanden sind und kein "Fortsetzungsblatt" zur Verfügung steht In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. III" und machen für jede weitere Person die in Feld Nr. III vorgeschriebenen Angaben Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist
 - (ii) Wenn in Feld Nr. II oder III die Angabe "die im Zusatzfeld angegebenen Staaten" angekreuzt ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Anmelders oder die Namen der Anmelder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Anmelder ist.
 - (iii) Wenn der in Feld Nr. II oder III genannte Erfinder oder Erfinder/Anmelder nicht für alle Bestimmungsstaaten oder für die Vereinigten Staaten von Amerika als Erfinder benannt ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Erfinders oder die Namen der Erfinder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Erfinder ist
 - (iv) Wenn zusätzlich zu dem Anwalt oder den Anwälten, die in Feld Nr. IV angegeben sind, weitere Anwälte bestellt sind In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. IV" und machen für jeden weiteren Anwalt die entsprechenden, in Feld Nr. IV vorgeschriebenen Angaben.
 - (v) Wenn in Feld Nr. V bei einem Staat (oder bei OAPI) die Angabe "Zusatzpatent" oder "Zusatzzertifikat," oder wenn in Feld Nr. V bei den Vereinigten Staaten von Amerika die Angabe "Fortsetzung" oder "Teilfortsetzung" hinzugefügt wird In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. V" und geben den Namen des betreffenden Staats (oder OAPI) an und nach dem Namen jedes solchen Staats (oder OAPI) das Aktenzeichen des Hauptschutzrechts oder der Hauptschutzrechtsanmeldung und das Datum der Erteilung des Hauptschutzrechts oder der Einreichung der Hauptschutzrechtsanmeldung
 - (vi) Wenn in Feld Nr. VI die Priorität von mehr als drei früheren Anmeldungen beansprucht wird In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und machen für jede weitere frühere Anmeldung die entsprechenden, in Feld Nr. VI vorgeschriebenen Angaben
 - (vii) Wenn in Feld Nr. VI die frühere Anmeldung eine ARIPO Anmeldung ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und geben, unter Angabe der Nummer der Zeile, in der die die frühere Anmeldung betreffenden Angaben gemacht sind, mindestens einen Staat an, der Mitglied der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung erfolgte
- 2 Wenn, im Hinblick auf die Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen in Feld Nr. V, der Anmelder Staaten von dieser Erklärung ausnehmen möchte. In diesem Fall schreiben Sie "Bestimmung(en), die von der Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen ausgenommen ist(sind)" und geben den Namen oder den Zweibuchstaben-Code jedes so ausgeschlossenen Staates an.
- 3 Wenn der Anmelder für irgendein Bestimmungsamt die Vorteile nationaler Vorschriften betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit in Anspruch nimmt: In diesem Fall schreiben Sie "Erklärung betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit" und geben im folgenden die entsprechende Erklärung ab.

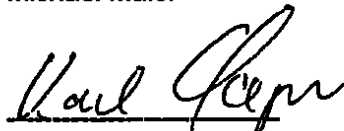
Fortsetzung von Feld Nr. IX


Uwe Döller


Klaus Dieter Höbald

Michael Maier

Anke Kuhlmann


Karl Seeger

Zusatzfeld Wird dieses Zusatzfeld nicht benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden.

- 1 Wenn der Platz in einem Feld nicht für alle Angaben ausreicht In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr .." [Nummer des Feldes angeben] und machen die Angaben entsprechend der in dem Feld, in dem der Platz nicht ausreicht, vorgeschriebenen Art und Weise, insbesondere
 - (i) Wenn mehr als zwei Anmelder und/oder Erfinder vorhanden sind und kein "Fortsetzungsblatt" zur Verfügung steht In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. III" und machen für jede weitere Person die in Feld Nr III vorgeschriebenen Angaben Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist
 - (ii) Wenn in Feld Nr II oder III die Angabe "die im Zusatzfeld angegebenen Staaten" angekreuzt ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr II", "Fortsetzung von Feld Nr III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr III" und geben den Namen des Anmelders oder die Namen der Anmelder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Anmelder ist.
 - (iii) Wenn der in Feld Nr II oder III genannte Erfinder oder Erfinder/Anmelder nicht für alle Bestimmungsstaaten oder für die Vereinigten Staaten von Amerika als Erfinder benannt ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Erfinders oder die Namen der Erfinder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Erfinder ist
 - (iv) Wenn zusätzlich zu dem Anwalt oder den Anwälten, die in Feld Nr IV angegeben sind, weitere Anwälte bestellt sind In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr IV" und machen für jeden weiteren Anwalt die entsprechenden, in Feld Nr IV vorgeschriebenen Angaben
 - (v) Wenn in Feld Nr V bei einem Staat (oder bei OAPI) die Angabe "Zusatzpatent" oder "Zusatzzertifikat," oder wenn in Feld Nr V bei den Vereinigten Staaten von Amerika die Angabe "Fortsetzung" oder "Teilfortsetzung" hinzugefügt wird In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr V" und geben den Namen des betreffenden Staats (oder OAPI) an und nach dem Namen jedes solchen Staats (oder OAPI) das Aktenzeichen des Hauptschutzrechts oder der Hauptschutzrechtsanmeldung und das Datum der Erteilung des Hauptschutzrechts oder der Einreichung der Hauptschutzrechtsanmeldung
 - (vi) Wenn in Feld Nr VI die Priorität von mehr als drei früheren Anmeldungen beansprucht wird. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr VI" und machen für jede weitere frühere Anmeldung die entsprechenden, in Feld Nr. VI vorgeschriebenen Angaben
 - (vii) Wenn in Feld Nr VI die frühere Anmeldung eine ARIPO Anmeldung ist In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr VI" und geben, unter Angabe der Nummer der Zeile, in der die die frühere Anmeldung betreffenden Angaben gemacht sind, mindestens einen Staat an, der Mitglied der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung erfolgte
- 2 Wenn, im Hinblick auf die Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen in Feld Nr V, der Anmelder Staaten von dieser Erklärung ausnehmen möchte In diesem Fall schreiben Sie "Bestimmung(en), die von der Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen ausgenommen ist(sind)" und geben den Namen oder den Zweibuchstaben-Code jedes so ausgeschlossenen Staates an
- 3 Wenn der Anmelder für irgendein Bestimmungsamt die Vorteile nationaler Vorschriften betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit in Anspruch nimmt In diesem Fall schreiben Sie "Erklärung betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit" und geben im folgenden die entsprechende Erklärung ab.

Fortsetzung von Feld Nr. IX

Uwe Döller

Klaus Dieter Höbald

Michael Maier

Anke
A. Kuhlmann

Anke Kuhlmann

Karl Seeger

Zusatzfeld Wird dieses Zusatzfeld nicht benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden.

- 1 Wenn der Platz in einem Feld nicht für alle Angaben ausreicht. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. [Nummer des Feldes angeben]" und machen die Angaben entsprechend der in dem Feld, in dem der Platz nicht ausreicht, vorgeschriebenen Art und Weise, insbesondere
- (i) Wenn mehr als zwei Anmelder und/oder Erfinder vorhanden sind und kein "Fortsetzungsblatt" zur Verfügung steht: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. III" und machen für jede weitere Person die in Feld Nr. III vorgeschriebenen Angaben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist
 - (ii) Wenn in Feld Nr. II oder III die Angabe "die im Zusatzfeld angegebenen Staaten" angekreuzt ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Anmelders oder die Namen der Anmelder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf. ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Anmelder ist
 - (iii) Wenn der in Feld Nr. II oder III genannte Erfinder oder Erfinder/Anmelder nicht für alle Bestimmungsstaaten oder für die Vereinigten Staaten von Amerika als Erfinder benannt ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. II", "Fortsetzung von Feld Nr. III" bzw. "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr. III" und geben den Namen des Erfinders oder die Namen der Erfinder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf. ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Erfinder ist
 - (iv) Wenn zusätzlich zu dem Anwalt oder den Anwälten, die in Feld Nr. IV angegeben sind, weitere Anwälte bestellt sind: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. IV" und machen für jeden weiteren Anwalt die entsprechenden, in Feld Nr. IV vorgeschriebenen Angaben
 - (v) Wenn in Feld Nr. V bei einem Staat (oder bei OAPI) die Angabe "Zusatzpatent" oder "Zusatzzertifikat," oder wenn in Feld Nr. V bei den Vereinigten Staaten von Amerika die Angabe "Fortsetzung" oder "Teilfortsetzung" hinzugefügt wird: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. V" und geben den Namen des betreffenden Staats (oder OAPI) an und nach dem Namen jedes solchen Staats (oder OAPI) das Aktenzeichen des Hauptschutzrechts oder der Hauptschutzrechtsanmeldung und das Datum der Erteilung des Hauptschutzrechts oder der Einreichung der Hauptschutzrechtsanmeldung
 - (vi) Wenn in Feld Nr. VI die Priorität von mehr als drei früheren Anmeldungen beansprucht wird: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und machen für jede weitere frühere Anmeldung die entsprechenden, in Feld Nr. VI vorgeschriebenen Angaben
 - (vii) Wenn in Feld Nr. VI die frühere Anmeldung eine ARIPO-Anmeldung ist: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. VI" und geben, unter Angabe der Nummer der Zeile, in der die frühere Anmeldung betreffenden Angaben gemacht sind, mindestens einen Staat an, der Mitglied der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung erfolgte.
- 2 Wenn, im Hinblick auf die Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen in Feld Nr. V, der Anmelder Staaten von dieser Erklärung ausnehmen möchte. In diesem Fall schreiben Sie "Bestimmung(en), die von der Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen ausgenommen ist(sind)" und geben den Namen oder den Zweibuchstaben-Code jedes so ausgeschlossenen Staates an
3. Wenn der Anmelder für irgendein Bestimmungsamt die Vorteile nationaler Vorschriften betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit in Anspruch nimmt: In diesem Fall schreiben Sie "Erklärung betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit" und geben im folgenden die entsprechende Erklärung ab

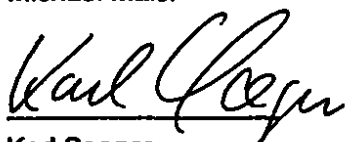
Fortsetzung von Feld Nr. IX

Uwe Döller

Klaus Dieter Höbald

Michael Maier

Anke Kuhlmann


Karl Seeger

Zusatzfeld Wird dieses Zusatzfeld nicht benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden

- 1 Wenn der Platz in einem Feld nicht für alle Angaben ausreicht In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr [Nummer des Feldes angeben] und machen die Angaben entsprechend der in dem Feld, in dem der Platz nicht ausreicht, vorgeschriebenen Art und Weise, insbesondere
 - (i) Wenn mehr als zwei Anmelder und/oder Erfinder vorhanden sind und kein "Fortsetzungsblatt" zur Verfügung steht. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr III" und machen für jede weitere Person die in Feld Nr III vorgeschriebenen Angaben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist
 - (ii) Wenn in Feld Nr II oder III die Angabe "die im Zusatzfeld angegebenen Staaten" angekreuzt ist. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr II", "Fortsetzung von Feld Nr III" bzw "Fortsetzung von Feld Nr. II und Nr III" und geben den Namen des Anmelders oder die Namen der Anmelder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Anmelder ist
 - (iii) Wenn der in Feld Nr. II oder III genannte Erfinder oder Erfinder/Anmelder nicht für alle Bestimmungsstaaten oder für die Vereinigten Staaten von Amerika als Erfinder benannt ist. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr II", "Fortsetzung von Feld Nr III" bzw "Fortsetzung von Feld Nr II und Nr III" und geben den Namen des Erfinders oder die Namen der Erfinder an und neben jedem Namen den Staat oder die Staaten (und/oder ggf ARIPO-, eurasisches, europäisches oder OAPI-Patent), für die die bezeichnete Person Erfinder ist
 - (iv) Wenn zusätzlich zu dem Anwalt oder den Anwälten, die in Feld Nr IV angegeben sind, weitere Anwälte bestellt sind In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr. IV" und machen für jeden weiteren Anwalt die entsprechenden, in Feld Nr. IV vorgeschriebenen Angaben
 - (v) Wenn in Feld Nr V bei einem Staat (oder bei OAPI) die Angabe "Zusatzpatent" oder "Zusatzzertifikat," oder wenn in Feld Nr V bei den Vereinigten Staaten von Amerika die Angabe "Fortsetzung" oder "Teilfortsetzung" hinzugefügt wird In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr V" und geben den Namen des betreffenden Staats (oder OAPI) an und nach dem Namen jedes solchen Staats (oder OAPI) das Aktenzeichen des Hauptschutzrechts oder der Hauptschutzrechtsanmeldung und das Datum der Erteilung des Hauptschutzrechts oder der Einreichung der Hauptschutzrechtsanmeldung
 - (vi) Wenn in Feld Nr VI die Priorität von mehr als drei früheren Anmeldungen beansprucht wird: In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr VI" und machen für jede weitere frühere Anmeldung die entsprechenden, in Feld Nr. VI vorgeschriebenen Angaben
 - (vii) Wenn in Feld Nr VI die frühere Anmeldung eine ARIPO Anmeldung ist. In diesem Fall schreiben Sie "Fortsetzung von Feld Nr VI" und geben, unter Angabe der Nummer der Zeile, in der die die frühere Anmeldung betreffenden Angaben gemacht sind, mindestens einen Staat an, der Mitglied der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung erfolgte
- 2 Wenn, im Hinblick auf die Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen in Feld Nr V, der Anmelder Staaten von dieser Erklärung ausnehmen möchte In diesem Fall schreiben Sie "Bestimmung(en), die von der Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen ausgenommen ist(sind)" und geben den Namen oder den Zweibuchstaben-Code jedes so ausgeschlossenen Staates an.
- 3 Wenn der Anmelder für irgendein Bestimmungsamt die Vorteile nationaler Vorschriften betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit in Anspruch nimmt: In diesem Fall schreiben Sie "Erklärung betreffend unschädliche Offenbarung oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit" und geben im folgenden die entsprechende Erklärung ab.

Fortsetzung von Feld Nr. IX

Michael Maier

Michael Maier

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT
(PCT Article 36 and Rule 70)139
140

Applicant's or agent's file reference BCS 02-1005	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/PEA416)	
International application No PCT/EP 03/12620	International filing date (day/month/year) 12.11.2003	Priority date (day/month/year) 13.12.2002
International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC C07D231/44		
Applicant BAYER CROPSCIENCE S A.		
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 4 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 opinion II ☐ Priority III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV ☐ Lack of unity of invention V ☒ Reasoned statement under Rule 66.2(a)(ii) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement VI ☐ Certain documents cited VII ☐ Certain defects in the international application VIII ☐ Certain observations on the international application		
Date of submission of the demand 12.06.2004	Date of completion of this report 11.02.2005	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority  European Patent Office - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel +31 70 340 - 2040 Tx 31 651 epo nl Fax +31 70 340 - 3016	Authorized Officer De Jong, B Telephone No +31 70 340-2833 	

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No PCT/EP 03/12620

I. Basis of the report

1. With regard to the **elements** of the international application (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rules 70.16 and 70.17):*

Description, Pages

1-68 as originally filed

Claims, Numbers

1-16 as originally filed

2. With regard to the **language**, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language: , which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of the international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b))
- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished

4. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages:
- ☐ the claims, Nos :
- ☐ the drawings, sheets:

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed (Rule 70.2(c))

(Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report)

- 6 Additional observations, if necessary:

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement			
Novelty (N)	Yes:	Claims	1-16
	No:	Claims	
Inventive step (IS)	Yes:	Claims	
	No:	Claims	1-16
Industrial applicability (IA)	Yes:	Claims	1-16
	No:	Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Re Item V

**Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;
citations and explanations supporting such statement**

Reference is made to the following document:

D1: WO 97 28126 A (AKAYAMA ATSUKO ;KANDO YASUYUKI (JP); KIJU
TOSHIYUKI (JP); NOGUCHI M) 7 August 1997 (1997-08-07)

1) The present application does not meet the criteria of Article 33(1) PCT, because the subject-matter of claims 1-16 does not involve an inventive step in the sense of Article 33(3) PCT:

The compounds of the present application represent a novel selection from the insecticidal compounds disclosed in claim 1 of D1. This selection can only be considered as inventive in case there is proof that the use of the compounds of the present application is associated with an unexpected effect. Since there is no proof for such an unexpected effect, the compounds of the present application and their use as pesticide cannot be considered as inventive.

2) The following points need attention for clarity reasons:

On page 7, lines 9-10 of the description it is stated that cycloalkyl groups are optionally substituted by halogen or alkyl. This should also be mentioned in the claims.

On page 7, lines 29-page 8, line 4 of the description it is stated that heterocyclyl groups may be substituted by several radicals. However the radicals mentioned here are not the same as the ones mentioned in the definitions of "heterocyclyl" in the claims. Therefore the definition of these radicals for "heterocyclyl" in the description should be deleted.

243
144

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

Referencia de archivo del solicitante o agente

BCS-02-1005

PARA ACCIÓN ADICIONAL

Ver Notificación de Transmisión del Reporte de
Examen Preliminar Internacional (Forma
PCT/IPEA/416)

Solicitud internacional No. PCT/EP 03/12620

Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 12.11.2003

Fecha de prioridad (día/mes/año) 13.12.2002

Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o tanto clasificación nacional como IPC
C07D231/44

Solicitante

BAYER CROPSCIENCE S. A.

1. Este reporte de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Autoridad Internacional de Examen Preliminar y es transmitida al solicitante de acuerdo con el Artículo 36.

2. Este REPORTE consiste de un total de 4 hojas, incluyendo esta hoja de cubierta

Este reporte también está acompañado por ANEXOS, es decir, hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos que ha sido corregidos y son la base para este reporte y/o hojas que contienen rectificaciones hechas ante esta Autoridad (ver Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones Administrativas bajo el PCT).

Estos anexos consisten de un total de hojas.

3. Este reporte contiene indicaciones relacionadas con los siguientes ítems:

- | | | |
|------|---|---|
| I | X | Base de la opinión |
| II | | Prioridad |
| III | | No establecimiento de opinión con respecto a novedad, paso inventivo y aplicabilidad industrial |
| IV | | Falta de unidad de invención |
| V | X | Declaración motivada bajo el Artículo 35.2 con respecto a novedad, paso inventivo o aplicabilidad industrial: citas y explicaciones que soportan cada declaración |
| VI | | Algunos documentos citados |
| VII | | Algunos defectos en la solicitud internacional |
| VIII | | Algunas observaciones sobre la solicitud internacional |

Fecha de presentación de la solicitud 12.06.2004

Fecha de completado este reporte 11.02.2005

Nombre y dirección de envío de la autoridad de examen preliminar internacional

Oficina Europea de Patentes – P. B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk – Holanda
Tel +31 70 340-2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340-3016

Fecha de envío de este reporte 11.02.2005

Funcionario autorizado
De Jong. B
Teléfono No. +31 70 340-2833

Forma PCT/IPEA/409 (Hoja de cubierta) (Enero 2004)

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud Internacional No. PCT/EP 03/12620

1. Con respecto a los elementos de la solicitud internacional (Se hace referencia a las hojas de reemplazo que ha sido suministradas a la Oficina receptora como respuesta a una invitación bajo el Artículo 14 en este reporte como “presentadas originalmente” y no se anexan a este reporte puesto que no contienen correcciones (Reglas 70.16 y 70.17)),

Descripción, Páginas
1-68 como se presentaron originalmente

Reivindicaciones, Números
1-16 como se presentaron originalmente

2. Con respecto al idioma, todos los elementos marcados arriba estaban disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el idioma en el cual fue presentada la solicitud internacional, a menos que se indique de otra forma bajo este ítem.

Estos elementos estaban disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el siguiente idioma: , el cual es:

el idioma de una traducción suministrada para el propósito de la búsqueda internacional (bajo la Regla 23.1(b)),

el idioma de la publicación de la solicitud internacional (bajo la Regla 48.3(b)),

el idioma de una traducción suministrada para el propósito del examen preliminar internacional (bajo la Regla 55.2 y/o 55.3),

3. Con respecto a cualquier nucleótido y/o secuencia de aminoácidos divulgados en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional se llevó a cabo en la base del listado de secuencias:

contenido en la solicitud internacional en forma escrita

presentado conjuntamente con la solicitud internacional en forma leíble por computador,

suministrado subsecuentemente a esta Autoridad en forma escrita,

suministrado subsecuentemente a esta Autoridad en forma leíble por computador,

Se ha suministrado la declaración de que el listado de secuencias escrito suministrado subsecuentemente no entra más allá de la divulgación en la solicitud internacional como se presentó.

Se ha suministrado la declaración de que la información registrada en forma leíble por computador subsecuentemente es idéntica al listado de secuencias escrito.

4. Las correcciones han dado como resultado la cancelación de la descripción, páginas:
las reivindicaciones, Nos.:
los dibujos, hojas:
5. Este reporte ha sido establecido como si (algunas de) las correcciones no se hayan hecho, pues han sido consideradas como más allá de las divulgaciones como se presentaron (Regla 70.2(c)).
(Se debe hacer referencia a cualesquiera hojas de reemplazo que contiene dichas correcciones como bajo el ítem 1 y anexas a este reporte)

6. Observaciones adicionales, si es necesario:

Forma PCT/IPEA/409 (Enero 2004)

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional No. PCT/EP 03/12620

V. Declaración con razones bajo el Artículo 35(2) con respecto a la novedad, el paso inventivo o la aplicabilidad industrial; citaciones y explicaciones que sustentan dicha declaración

1. Declaración

Novedad (N)	Si:	Reivindicaciones	1-16
	No:	Reivindicaciones	
Paso inventivo (IS)	Si:	Reivindicaciones	
	No:	Reivindicaciones	1-16
Aplicabilidad Industrial (IA)	Si:	Reivindicaciones	1-16
	No:	Reivindicaciones	

2. Citaciones y explicaciones
ver hoja separada

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL – HOJA SEPARADA
Solicitud internacional No. PCT/EP 03/12620

RE Ítem V

Declaración motivada con respecto a la novedad, la altura inventiva o la aplicabilidad industrial: citas y explicaciones que sustentan dicha declaración.

Se hace referencia al siguiente documento:

D1: WO 97 28126 A (AKAYAMA ATSUO KANDO YASUYUKI (JP); KJI TOSHIYUKI (JP); NOGUCHI M) 7 Agosto 1997 (1997-08-07)

- 1) La presente solicitud no cumple con los criterios del Artículo 33(1) PCT, debido a que la materia sujeto de las reivindicaciones 1-16 no involucran una altura inventiva en el sentido del Artículo 33(3) PCT.

Los compuestos de la presente solicitud representan una selección novedosa de los compuestos insecticidas divulgados en la reivindicación 1 de D1. Esta selección puede ser considerada solo como inventiva en el caso donde se pruebe que el uso de los compuestos de la presente invención estén asociados

con un efecto inesperado. Puesto que no hay prueba de un efecto inesperado tal, los compuestos de la presente invención y su uso como pesticidas no pueden considerarse como inventivos.

- 2) Los siguientes puntos requieren atención debido a razones de claridad:
- En la página 7, líneas 9-10 de la descripción se dice que grupos cicloalquilo se sustituyen opcionalmente por halógeno o alquilo. Esto puede mencionarse también en las reivindicaciones.
- En la página 7, línea 29, página 8, línea 4 de la descripción se dice que los grupos heterocicli pueden sustituirse por varios radicales. Sin embargo los radicales mencionados no son los mismos mencionados en las definiciones de "heterocicli" en las reivindicaciones. Consecuentemente la definición de estos radicales por "heterocicli" en la descripción debe eliminarse.

Forma PCT/ Hoja separada/409 (Hoja 1)) (EPO-Abril 1997)

PATENT COOPERATION TREATY

147
148

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To

RIPPER, Hans, Christoph
Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung
Industriepark Höchst, Gebäude K 607
65926 Frankfurt
Germany

Date of mailing (day/month/year)

06 July 2004 (06.07.2004)

Applicant's or agent's file reference

BCS 02-1005

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP2003/012620

International filing date (day/month/year)

12 November 2003 (12.11 2003)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address

KUHLMANN, Anke
Bern 12
42799 Leichlingen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address

KUHLMANN, Anke
Blankenburg 30
51381 Leverkusen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☒ the elected Offices concerned
☒ the International Preliminary Examining Authority ☐ otherThe International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 338 89.75

Authorized officer

A. ZOLTANSKI (Fax : 338 89 75)

Telephone No. (41-22) 338 8608

PATENT COOPERATION TREATY

148
149

PCT

NOTIFICATION RELATING TO PRIORITY CLAIM

(PCT Rules 26bis.1 and 26bis 2 and
Administrative Instructions, Sections 402 and 409)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

RIPPER, Hans, Christoph
Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung
Industriepark Höchst, Gebäude K 607
65926 Frankfurt
Germany

Date of mailing (day/month/year)

18 February 2004 (18.02.2004)

Applicant's or agent's file reference

BCS 02-1005

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No

PCT/EP2003/012620

International filing date (day/month/year)

12 November 2003 (12.11.2003)

Applicant

BAYER CROPSCIENCE S.A. et al

The applicant is hereby notified of the following in respect of the priority claim(s) made in the international application.

1. ☒ **Correction of priority claim.** In accordance with the applicant's notice received on 20 January 2004 (20.01.2004), the following priority claim has been corrected to read as follows:

EP 03 December 2002 (03.12.2002) 02027064.1

- ☐ even though the indication of the number of the earlier application is missing.
☐ even though the following indication in the priority claim is not the same as the corresponding indication appearing in the priority document:

2. ☐ **Addition of priority claim.** In accordance with the applicant's notice received on , the following priority claim has been added.

- ☐ even though the indication of the number of the earlier application is missing
☐ even though the following indication in the priority claim is not the same as the corresponding indication appearing in the priority document.

3. ☒ **As a result of the correction and/or addition of (a) priority claim(s) under items 1 and/or 2, the (earliest) priority date is.**
03 December 2002 (03.12.2002)

4. ☐ **Priority claim considered not to have been made.**

- ☐ The applicant failed to respond to the invitation under Rule 26bis 2(a) (Form PCT/IB/316) within the prescribed time limit
☐ The applicant's notice was received after the expiration of the prescribed time limit under Rule 26bis 1(a)
☐ The applicant's notice failed to correct the priority claim so as to comply with the requirements of Rule 4 10.

The applicant may, before the technical preparations for international publication have been completed and subject to the payment of a fee, request the International Bureau to publish, together with the international application, information concerning the priority claim. See Rule 26bis 2(c) and the PCT Applicant's Guide, Volume I, Annex B2(IB)

5. ☒ **In case where multiple priorities have been claimed, the above item(s) relate to the following priority claim(s):**

EP 03 December 2002 (03.12.2002) 02027064.1

6. A copy of this notification has been sent to the receiving Office and

- ☒ to the International Searching Authority (where the international search report has not yet been issued)
☒ the designated Offices (which have already been notified of the receipt of the record copy).

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. (41-22) 338 89 75

Authorized officer

Alison OSBORNE (Fax : 338 89 75)

Telephone No. (41-22) 338 8472

449
150

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
~~PATENTE DE INVENCION~~	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesion 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 ()

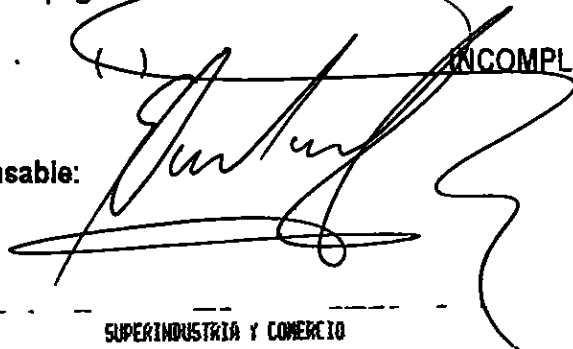
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenia la solicitud.	()	()
- Representación gráfica o fotografica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()

COMPLETA () INCOMPLETA ()

ESQUEMA DE TRAZADO ()

- Indicacion de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()
- Datos de Identificacion del solcitante o de la persona que presenta La solicitud	()	()
- Representación grafica del esquema de trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()

COMPLETA () INCOMPLETA ()

Firma Responsable: 

Fecha: _____
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacon : 05052702 00000000 Folios: 148
Fecha (AMD): 2005-05-31 16:24:59
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE HACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D C.,

Doctor:
GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO
Apoderado
BAYER CROPSCIENCE S.A.

Oficio N° .. **05374**

ASUNTO: Radicación N° 05-52702
Solicitud internacional PCT/EP2003/012620
Fecha inicio fase nacional 05/07/2005
Trámite 011
Evento 379
Actuación 430
Folios 001

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

- La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante (Art 26-k) Decisión 486)

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

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


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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha, 18 JUL. 2005

202030

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia