

[Handwritten mark]



[Handwritten mark]

Industria y Comercio

S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-32149

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

2-CIANOBENCENOSULFONAMIDAS PARA COMBATIR PLAGAS

ANIMALES

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

Ludwigshafen, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 06432149 00000000

Folios: 172:ón

Fecha (AMB): 2005-03-31 17:50:24

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☐ Capítulo I.

☒ Capítulo II.

2

S LICITANTE
(71)

Nombre: **BASF AKTIENGESSELLSCHAFT**
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de la Republica Federal de Alemania

Dirección: 67056 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **EMILIO FERRERO**
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@camvd.com.
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual

Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)
(72)

1. **Wolfgang VON DEYN**
An der Bleiche 24,
67435 Neustadt,
República Federal de Alemania.
- 3- **Michael HOFMAN**
Lutherstrasse 2,
67059 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania.
5. **Michael PUHL**
Bürstädter Strasse 95,
68623 Lampertheim,
República Federal de Alemania.
7. **Livio TEDESCHI**
Kleinfeldstrasse 48a,
68165 Mannheim,
República Federal de Alemania.
9. **Toni BUCCI**
2629 Hidden Meadow Drive,
Fuquay Varina, North Carolina 27526,
Estados Unidos de América.
11. **Henry VAN TUYL COTTER**
8329 Lakewood Drive,
Raleigh, North Carolina 27613,
Estados Unidos de América.

2. **Ernst BAUMANN**
Falkenstrasse 8a,
67373 Dudenhofen,
República Federal de Alemania
4. **Markus KORDES**
Bensheimer Ring 13 d,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania
6. **Thomas SCHMIDT**
Pfarrgasse 8,
67433 Neustadt,
República Federal de Alemania.
8. **Michael RACK**
Sandwingert 87,
69123 Heidelberg,
República Federal de Alemania.
10. **Deborah L. CULBERTSON**
6400 Vintage Ridge Lane,
Fuquay Varina, North Carolina 27526,
Estados Unidos de América.
12. **Hassan OLOUMI-SADEGHI**
12105 Pawley's Mill Circle,
Raleigh, North Carolina 27614,
Estados Unidos de América.

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2004/011004

Publicación Internacional No. WO 2005/035486 A1

Fecha: 1º. de octubre de 2004

Fecha: 21 de abril de 2005

6

TÍTULO (54) 2- CIANOBOENCENOSULF NAMIDAS PARA COMBATIR PLAGAS ANIMALES

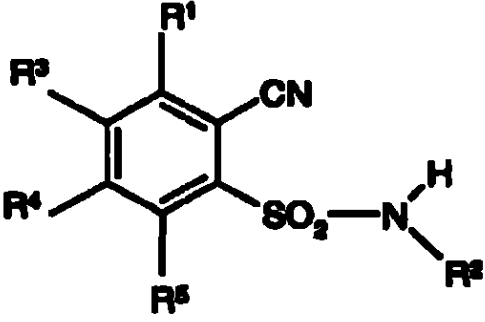
7

Clasificación Internacional (51) C07C 311/16

8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	SI ☒ NO ☐	<u>US.</u>	<u>2 de octubre de 2003</u>	<u>60/507.507</u>

9	Comprobante de pago No: <u>06 – 19.919</u>	Fecha: <u>13 de marzo de 2006</u>
----------	---	--

10	Anexos:
☒	Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00.
☐	Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
☒	Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
☒	Poderes, si fuere el caso.
☐	Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
☐	Declaraciones.
☒	Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☒	Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☒	Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
☐	Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
☐	De ser el caso, copia del contrato de acceso.
☐	De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
☐	De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
☒	Arte final 12x12
☐	De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
☒	Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11	FIGURA CARACTERÍSTICA
 (I)	

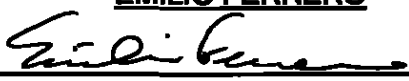
12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :


C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

ZCA/mmm-Id-4428

REPRESENTACION Y PODER

Unterschrift

U R Nr 1407/89

Ich beglaube hiermit die Echtheit der vorstehend
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein
handelnden Herren

- 1 Dr Gunther W e l z e l , Chemiker in
Ludwigshafen am Rhein,
- 2 Dr Peter R i c h t e r s , Chemiker in
Ludwigshafen am Rhein

Die Herren Dr Welzel und Dr Richters sind mir persönlich
bekannt

Aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister
beim Amtsgericht Ludwigshafen am Rhein HR B 3000 be-
scheine ich, daß die Herren Dr Welzel und Dr Richters
als Prokuristen gemeinschaftlich zur Vertretung und
Zeichnung der Firma BASF Aktiengesellschaft mit dem
Sitz in Ludwigshafen am Rhein berechtigt sind

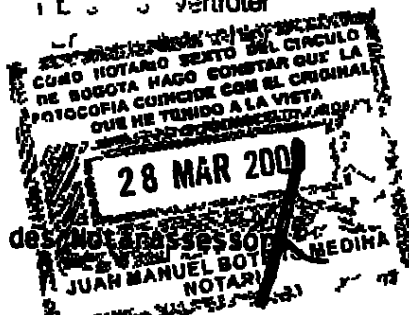
Ludwigshafen am Rhein, den 17 März 1989



[Handwritten signature]

Thomas Walter

als amtlich bestellter Vertreter
des Notars



Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notars
Thomas Walter

als amtlich bestellter Vertreter des Notars Justizrat Dr Kohler
in Ludwigshafen am Rhein und die Echtheit des beigedruckten
Dienststempels werden hiermit bestätigt Zugleich wird bescheinigt,
daß der Vorgenannte zur Vornahme der Amtshandlung befugt war

Frankenthal (Pfalz) den einundzwanzigsten März neunzehnhundert-
neunundachtzig

Präsident des Landgerichts

[Handwritten signature: Franz Serfas]
(Franz Serfas)



Kostenvermerk Gebühr 20 -- DM

LUZ ARRIAGA DE ARRIAGA
INDUSTRIA
Revolution No 556 N. 1000000

El suscrito Consul General de Colombia en Frankfurt
am Main, República Federal de Alemania, vistos los
documentos presentados por los interesados,

C E R T I F I C A

Que el señor Thomas Walter-----
quien como Notario en Ludwigshafen am Rhein-----
autenticó la(s) firma(s) del(os) signatario(s) del
Poder precedente, ejercía las funciones indicadas y
su firma corresponde a la registrada ante el Tribunal Re-
gional de Frankenthal (Pfalz)-----
que la compañía BASF Aktiengesellschaft-----
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes
de la República Federal de Alemania y cumple su objeto
conforme a las mismas, que el(los) señor(es) Dr Gunther
WELZEL y el Dr Peter RICHTERS-----
quien(es) en sus carácter(es) de apoderados-----
----- y cuya(s) firma(s) fué
(fueron) autenticada(s) ante el Notario Thomas Walter-----

te(s) legal(es) en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad por el con-
tenido del documento.

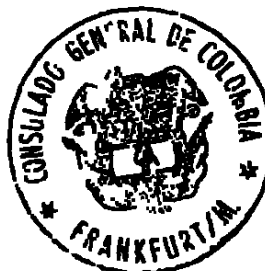
Esta Certificación se expide en Frankfurt am Main,
el seis de Abril de mil novecientos ochenta y nueve

Frankfurt a M 06 APR 1989

N-0077

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Don \$US 6 - del Law 84 M R



Martha Niño de Stand
Martha Niño de Stand
Cónsul General de Colombia

100-07872

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES

Boletín No. 85116-1
12 ABR 1988
1988

Of. el 1988
Martha Nino
cuyo texto...
documento, ...
la ...

28 MAR 2006

ACUNA
JUAN MANUEL SOTERO MEDINA
NOTARIO



6

COMO NOTARIO SEKTO DEL CINCULO
DE BOGOTA HAGO CONSTAR QU LA
FOTOCOPIA CUINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 MAR 2006
JUAN MANI EL BOTERO MEDINA
NOTARIO

GENERAL

~~1100 GFC~~

TRADUCCION OFICIAL NO 2056

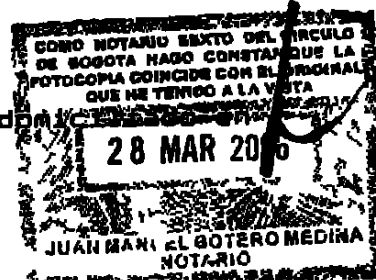
de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente -

(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra 4 No 72-35, Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen, RFA:)

Protocolo notarial No 1407/89

Certifico la autenticidad de las firmas anteriores puestas ante mí, por los señores:

- 1 Dr Gunther W e l z e l , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein,
- 2 Dr Peter R i c h t e r s , químico, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein



A los doctores Welzel y Richters los conozco en persona

LUZ ARRIAGA DE HERBES
TRADUCTORA E INTERPRETE
Resolución No. 599 Ministerio

Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Wizel y Richters, en su calidad de apoderados, están facultados para representar conjuntamente y firmar por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, con sede en Ludwigshafen

Ludwigshafen am Rhein, 17 de marzo de 1989

(sello redondo:)

Dr Siegfried Kohler

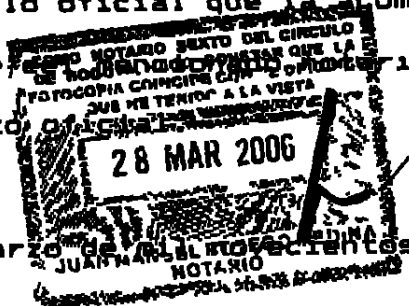
Fdo : firma ilegible

Notario de Ludwigshafen

Th Walter

Asesor del notario como representante oficialmente designado del notario Dr Siegfried Kohler

Se certifica la autenticidad de la firma anterior del asesor del notario, consejero de justicia Dr Kohler, domiciliado en Ludwigshafen am Rhein, y la del sello oficial que la acompaña. Al mismo tiempo se certifica que el asesor del notario estaba facultado para realizar ese acto.



Frankenthal (Pfalz), veintiuno de marzo de ochenta y nueve

LUZ ARIAGA DE HERBEN
TRADUCTORA INTERPRETE S.R.L.
No al cob No 599 M nistiale

9

El Presidente del Tribunal Regional

Fdp : firma ilegible (sello redondo:)

(Franz Serfas)

El Presidente del Tribunal Regional

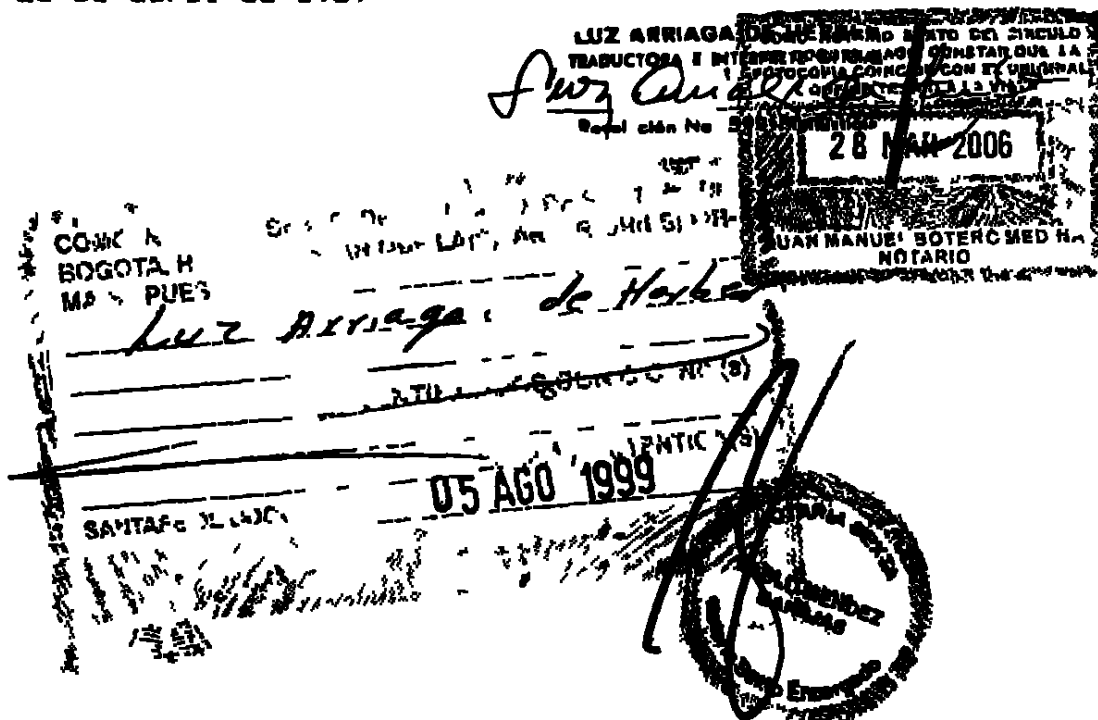
de Frankenthal (Pfalz)

Nota: Derrechos 20,-- DM

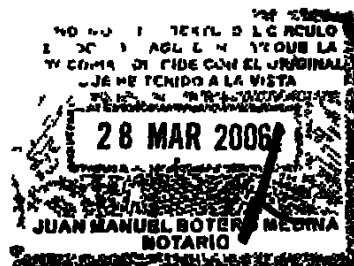
EN ESPAÑOL La legalización de las firmas anteriores por el
Consulado de General de Colombia en Frankfurt, bajo el No
0077 (Certificación consular) del 6 de abril de 1989 y del
Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia bajo el No
85061 del 24 de abril de 1989

Pagado impuesto de timbre US\$ 6,00

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en
los archivos de estas oficinas para su confrontación
Bogotá, 26 de abril de 1989



MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES
LEGALIZACIONES
 Bogota 28 MAR 1983 No. 8901
 HICE CONSTAR
 Que el señor Luz DE Heredia
 cuya firma aparece al pie del presente
 documento, desempeña en esa fecha
 las funciones así indicadas



UNA
 JUES
 Encargado

EN LAS INSTRUCCIONES QUE
ACOMPANAN ESTE FORMULARIO.

RESPALDO DEL NOTARIO DE ESTE FORMULARIO.
SE DEBEN ESTAR ULTIMANDO CON ALGUN VALOR EN CASO CONTRARIO, DEBE SER CERO (0)

881051599954



DECLARACION Y PAGO DEL

IMPUESTO D

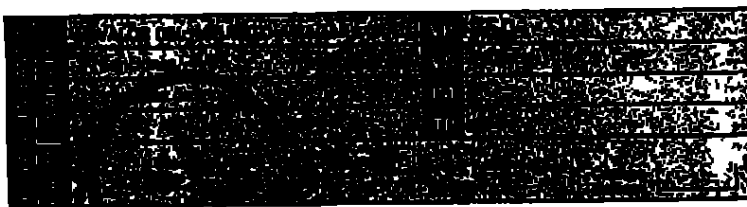
16 013 01 000045 1

TIMBR NACIONAL

16 013 01 000045 1

1 Administración de Impuestos de		Código	2 Teléfono
BOGOTA		0,3	2120100
2 Documento de identificación (marque X)		4 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (incluya 80 caracteres).	
C.C. & T.J. ☐ C ☐ NIT ☐ A ☒ Y No.	D.V. ☐ 3	CAVELIER ABOGADOS	
850041367			
3		5 Apellidos y Nombres o Razón Social de las partes (incluya 80 caracteres).	
C.C. & T.J. ☐ C ☒ NIT ☐ A ☐ Y No.	D.V. ☐ 1	BORERO ROCHA JAIME	
19'301 629			
6 Dirección (de la persona o entidad identificada en la celda 4)		Municipio	Departamento
Cra 4a No 72-35		BOGOTA	CUNDINAMARCA
7 Número de identificación		8	
1			
9 Relación oficial tipográfica de documentos, incluyendo número, fecha, valor y naturaleza de la transacción.			
TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No 2056 DE ABRIL 26 DE 1989			
PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER			
COLO 0361-52-218-8			
REVISADO			
JUAN MANUEL SANCHEZ MEDINA			
28-MAR-2006			

Responsable del pago
Nombre
C.C. No. 1930162



Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E S D

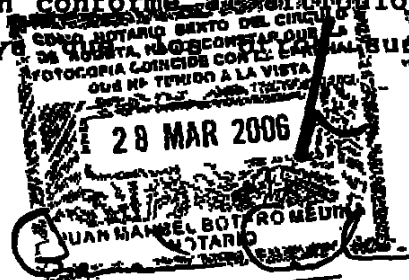
Poderdante BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el 17-03-89

Yo GERMAN CAVELIER obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, solemnemente manifiesto a Usted que sustituyo el poder conferido en el doctor EMILIO FERRERO Abogado con Tarjeta Profesional No 31 929 con todas las facultades que me fueron conferidas

Hago la anterior sustitucion conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los requisitos sustitutos faltan en este momento

Señor Jefe



GERMAN CAVELIER

T P A No 832

C C No 2 877 924 de Bogota

Acepto

EMILIO FERRERO

T P A No 31 929

C C No 438 019 de Usaquen

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACIÓN DE FIRMA
CON PRESENTACIÓN PERSONAL

(Art. 1º del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá compareció el Doctor EMILIO FERRAZ

quien exhibió su cedula de ciudadanía número 43999
expedida en VIAGUERA y la tarjeta profesional
número 21 929 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a R.D. HUARIN (Aguirre)
y declaro que la firma que aparece en el es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

- 6 OCT. 1993

Santafé de Bogotá D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DILIGENCIA DE AUTENTICACIÓN DE FIRMA
CON PRESENTACIÓN PERSONAL

(Art. 1º del Decreto 2782 de 1989)

Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de
Bogotá compareció el Doctor GERARDO GARCIA

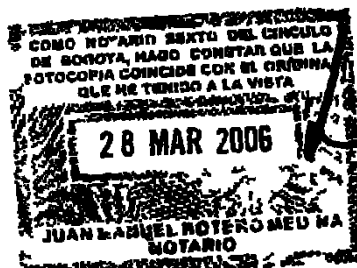
quien exhibió la cedula de ciudadanía número 297774
expedida en BOGOTÁ y la tarjeta profesional
número 677 del Ministerio de Justicia con
el presente documento dirigido a Dr. Gerardo García
y declaro que la firma que aparece en el es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

01 OCT. 1993

Santafé de Bogotá D. C.

AUTORIZO LA ANTERIOR



DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/035486 A1**

Descripción:

Páginas 61 en el idioma original

Páginas 71 en español

Reivindicaciones: Número (17)

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**

3. ☒ **Traducción de los anexos del Reporte Preliminar Internacional sobre Patentabilidad**

4. ☒ **Extracto de publicación.**

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
21 April 2005 (21.04.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/035486 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07C 311/16,
311/29, A01N 41/06

Van Tuyt [US/US]; 8329 Lakewood Drive, Raleigh, NC
27613 (US). OLOUMI-SADEGHI, Hassan [US/US];
12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614 (US).

(21) International Application Number:
PCT/EP2004/011004

(74) Agent: REISTÖTTER-KINZEBACH & PARTNER
(GBR); Ludwigsplatz 4, 67059 Ludwigshafen (DE).

(22) International Filing Date: 1 October 2004 (01.10.2004)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/507,507 2 October 2003 (02.10.2003) US

(71) Applicant (for all designated States except US): BASF
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Lud-
wigshafen (DE).

(72) Inventors; and

(73) Inventors/Applicants (for US only): VON-DEYN, Wolf-
gang [DE/DE]; An der Bleiche 24, 67435 Neustadt (DE).
BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, 67373
Dudenhofen (DE). HOFMANN, Michael [DE/DE];
Lutherstr.2, 67059 Ludwigshafen (DE). KORDES,
Markus [DE/DE]; Bensheimer Ring 13 d, 67227 Franken-
thal (DE). PUHL, Michael [DE/DE]; Büttelstr. 95,
68623 Lampertheim (DE). SCHMIDT, Thomas [DE/DE];
Pfarrgasse 8, 67433 Neustadt (DE). TEDESCHI, Livio
[IT/DE]; Kleinfeldstrasse 48a, 68165 Mannheim (DE).
RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123
Heidelberg (DE). BUCCI, Todd [US/US]; 2629 Hidden
Meadow Drive, Fuquay Varina, NC 27526 (US). CUL-
BERTSON, Deborah, L. [US/US]; 6400 Vintage Ridge
Lane, Fuquay-Varina, NC 27526 (US). COTTER, Henry,

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
FR, GB, GR, GU, HK, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MY, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

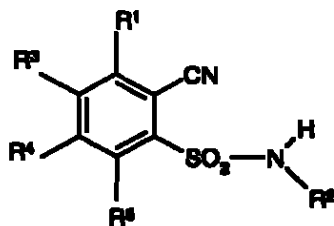
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC,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

Published:

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

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: 2-CYANO BENZENE SULFONAMIDES FOR COMBATING ANIMAL PESTS



(I)

(57) Abstract: The invention relates to 2-cyanobenzene-
sulfonamide compounds of the formula (I) where the vari-
ables R¹ to R⁵ are as defined in claim 1 and/or to their agri-
culturally useful salts. Moreover, the present invention re-
lates to the use of compounds (I) and/or their salts for com-
bating animal pests; agricultural compositions comprising
such an amount of at least one compound of the general
formula (I) and/or at least one agriculturally useful salt of
I and at least one inert liquid and/or solid agronomically
acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if de-
sired, at least one surfactant; and a method of combating

animal pests which comprises contacting the animal pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material
or environment in which the animal pests are growing or may grow, or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be pro-
tected from animal attack or infestation with a pesticidally effective amount of at least one 2-cyanobenzene-sulfonamide compound
of the general formula I and/or at least one agriculturally acceptable salt thereof.

WO 2005/035486 A1

2-Cyanobenzenesulfonamides for combating animal pests

The present invention relates to 2-cyanobenzenesulfonamide compounds and to the agriculturally useful salts thereof and to compositions comprising such compounds.

5 The invention also relates to the use of the 2-cyanobenzenesulfonamide compounds, of their salts or of compositions comprising them for combating animal pests.

Animal pests destroy growing and harvested crops and attack wooden dwelling and commercial structures, causing large economic loss to the food supply and to property.

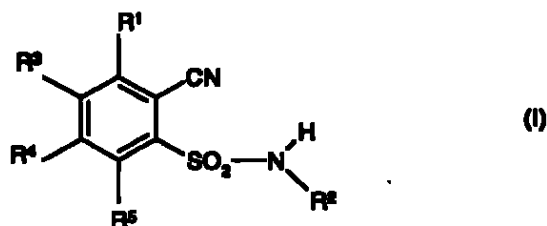
10 While a large number of pesticidal agents are known, due to the ability of target pests to develop resistance to said agents, there is an ongoing need for new agents for combating animal pests. In particular, animal pests such as insects and acaridae are difficult to be effectively controlled.

15 EP 0033984 describes substituted 2-cyanobenzenesulfonamide compounds having an aphicidal activity. The benzenesulfonamide compounds preferably carry a fluorine atom or chlorine atom in the 3-position of the phenyl ring. However, the pesticidal activity of said compounds is unsatisfactory and they are only active against aphids.

20 It is therefore an object of the present invention to provide compounds having a good pesticidal activity, especially against difficult to control insects and acaridae.

It has been found that these objects are solved by 2-cyanobenzenesulfonamide compounds of the general formula I

25



where

30 R^1 is C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or C_1 - C_4 -haloalkoxy;

R^2 is hydrogen, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkinyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, wherein the five last-mentioned radicals may be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or may carry one, two, or three radicals selected from the group consisting of C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -haloalkylthio, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, cyano, amino, $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, C_3 - C_8 -cycloalkyl and phenyl, it being possible for phenyl to be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or to carry one, two or three substituents selected from the group consisting of C_1 -

35

C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-haloalkoxy; and

5 R³, R⁴ and R⁵ are independently of one another selected from the group consisting of hydrogen, halogen, cyano, nitro, C₁-C₈-alkyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₄-haloalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₁-C₄-haloalkoxy, C₁-C₄-haloalkylthio, C₂-C₈-alkenyl, C₂-C₈-alkynyl, C₁-C₄-alkoxycarbonyl, amino, (C₁-C₄-alkyl)amino, di-(C₁-C₄-alkyl)amino, aminocarbonyl, (C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl and di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl;

10 and by their agriculturally acceptable salts. The compounds of the formula I and their agriculturally acceptable salts have a high pesticidal activity, especially against difficult to control insects and acaridae.

15 Accordingly, the present invention relates to 2-cyanobenzenesulfonamide compounds of the general formula I and to their agriculturally useful salts.

Moreover, the present invention relates to

- the use of compounds I and/or their salts for combating animal pests;
- agricultural compositions comprising such an amount of at least one
20 2-cyanobenzenesulfonamide compound of the formula I and/or at least one agriculturally useful salt of I and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant; and
- a method of combating animal pests which comprises contacting the animal
25 pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material or environment in which the animal pests are growing or may grow, or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from animal attack or infestation with a pesticidally effective amount of at least one 2-cyanobenzenesulfonamide compound of the general formula I and/or at least one agri-
30 culturally acceptable salt thereof.

35 In the substituents R¹ to R⁵ the compounds of the general formula I may have one or more centers of chirality, in which case they are present as mixtures of enantiomers or diastereomers. The present invention provides both the pure enantiomers or diastereomers or mixtures thereof.

40 Salts of the compounds of the formula I which are suitable for the use according to the invention are especially agriculturally acceptable salts. They can be formed in a customary method, e.g. by reacting the compound with an acid of the anion in question.

Suitable agriculturally useful salts are especially the salts of those cations or the acid addition salts of those acids whose cations and anions, respectively, do not have any adverse effect on the action of the compounds according to the present invention, which are useful for combating harmful insects or arachnids. Thus, suitable cations are

- in particular the ions of the alkali metals, preferably lithium, sodium and potassium, of the alkaline earth metals, preferably calcium, magnesium and barium, and of the transition metals, preferably manganese, copper, zinc and iron, and also the ammonium ion which may, if desired, carry one to four C₁-C₄-alkyl substituents and/or one phenyl or benzyl substituent, preferably diisopropylammonium, tetramethylammonium, tetrabutylammonium, trimethylbenzylammonium, furthermore phosphonium ions, sulfonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium, and sulfoxonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium.
- 10 Anions of useful acid addition salts are primarily chloride, bromide, fluoride, hydrogen sulfate, sulfate, dihydrogen phosphate, hydrogen phosphate, phosphate, nitrate, hydrogen carbonate, carbonate, hexafluoroarsenate, hexafluorophosphate, benzoate, and the anions of C₁-C₄-alkanoic acids, preferably formate, acetate, propionate and butyrate. They can be formed by reacting the compounds of the formulae Ia and Ib with
- 15 an acid of the corresponding anion, preferably of hydrochloric acid, hydrobromic acid, sulfuric acid, phosphoric acid or nitric acid.

- The organic moieties mentioned in the above definitions of the variables are - like the term halogen - collective terms for individual listings of the individual group members.
- 20 The prefix C_n-C_m indicates in each case the possible number of carbon atoms in the group.

The term halogen denotes in each case fluorine, bromine, chlorine or iodine.

- 25 Examples of other meanings are :

- The term "C₁-C₄-alkyl" as used herein and the alkyl moieties of alkylamino and dialkylamino refer to a saturated straight-chain or branched hydrocarbon radical having 1 to 4 carbon atoms, i.e., for example methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl or 1,1-dimethylethyl.
- 30

- The term "C₁-C₆-alkyl" as used herein refers to a saturated straight-chain or branched hydrocarbon radical having 1 to 6 carbon atoms, for example one of the radicals mentioned under C₁-C₄-alkyl and also n-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, n-hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl, 1-ethyl-2-methylpropyl.
- 35

- 40 The term "C₁-C₄-haloalkyl" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl radical having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above), where some or all of the hydrogen atoms in these radicals may be replaced by fluorine, chlorine, bromine and/or iodine, i.e., for example chloromethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoro-

5 methyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chloro-
difluoromethyl, 2-fluoroethyl, 2-chloroethyl, 2-bromoethyl, 2-iodoethyl, 2,2-difluoroethyl,
2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-
fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, pentafluoroethyl, 2-fluoropropyl, 3-fluoropropyl, 2,2-
difluoropropyl, 2,3-difluoropropyl, 2-chloropropyl, 3-chloropropyl, 2,3-dichloropropyl, 2-
bromopropyl, 3-bromopropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 3,3,3-trichloropropyl, 2,2,3,3,3-
pentafluoropropyl, heptafluoropropyl, 1-(fluoromethyl)-2-fluoroethyl, 1-(chloromethyl)-2-
chloroethyl, 1-(bromomethyl)-2-bromoethyl, 4-fluorobutyl, 4-chlorobutyl, 4-bromobutyl
or nonafluorobutyl.

10

The term "C₁-C₂-fluoroalkyl" as used herein refers to a C₁-C₂-alkyl radical which carries
1, 2, 3, 4, or 5 fluorine atoms, for example difluoromethyl, trifluoromethyl, 1-fluoroethyl,
2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 1,1,2,2-tetrafluoroethyl or penta-
fluoroethyl.

15

The term "C₁-C₄-alkoxy" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated
alkyl radical having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via an
oxygen atom, i.e., for example methoxy, ethoxy, n-propoxy, 1-methylethoxy, n-butoxy,
1-methylpropoxy, 2-methylpropoxy or 1,1-dimethylethoxy.

20

The term "C₁-C₄-haloalkoxy" as used herein refers to a C₁-C₄-alkoxy radical as men-
tioned above which is partially or fully substituted by fluorine, chlorine, bromine and/or
iodine, i.e., for example, chloromethoxy, dichloromethoxy, trichloromethoxy, fluoro-
methoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, chlorofluoromethoxy, dichlorofluorometh-
oxy, chlorodifluoromethoxy, 2-fluoroethoxy, 2-chloroethoxy, 2-bromoethoxy, 2-
iodoethoxy, 2,2-difluoroethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, 2-chloro-2-fluoroethoxy, 2-chloro-
2,2-difluoroethoxy, 2,2-dichloro-2-fluoroethoxy, 2,2,2-trichloroethoxy, pentafluoroeth-
oxy, 2-fluoropropoxy, 3-fluoropropoxy, 2,2-difluoropropoxy, 2,3-difluoropropoxy, 2-
chloropropoxy, 3-chloropropoxy, 2,3-dichloropropoxy, 2-bromopropoxy, 3-
bromopropoxy, 3,3,3-trifluoropropoxy, 3,3,3-trichloropropoxy, 2,2,3,3,3-
pentafluoropropoxy, heptafluoropropoxy, 1-(fluoromethyl)-2-fluoroethoxy, 1-
(chloromethyl)-2-chloroethoxy, 1-(bromomethyl)-2-bromoethoxy, 4-fluorobutoxy, 4-
chlorobutoxy, 4-bromobutoxy or nonafluorobutoxy.

35

The term "C₁-C₄-alkylthio (C₁-C₄-alkylsulfanyl: C₁-C₄-alkyl-S-)" as used herein refers to
a straight-chain or branched saturated alkyl radical having 1 to 4 carbon atoms (as
mentioned above) which is attached via a sulfur atom, i.e., for example methylthio,
ethylthio, n-propylthio, 1-methylethylthio, butylthio, 1-methylpropylthio, 2-
methylpropylthio or 1,1-dimethylethylthio.

40

The term "C₁-C₄-alkylsulfinyl" (C₁-C₄-alkyl-S(=O)-), as used herein refers to a straight-
chain or branched saturated hydrocarbon radical (as mentioned above) having 1 to 4
carbon atoms bonded through the sulfur atom of the sulfinyl group at any bond in the
alkyl radical, i.e., for example SO-CH₃, SO-C₂H₅, n-propylsulfinyl, 1-methylethyl-

sulfinyl, n-butylsulfinyl, 1-methylpropylsulfinyl, 2-methylpropylsulfinyl, 1,1-dimethylethylsulfinyl, n-pentylsulfinyl, 1-methylbutylsulfinyl, 2-methylbutylsulfinyl, 3-methylbutylsulfinyl, 1,1-dimethylpropylsulfinyl, 1,2-dimethylpropylsulfinyl, 2,2-dimethylpropylsulfinyl or 1-ethylpropylsulfinyl.

5

The term "C₁-C₄-alkylsulfonyl" (C₁-C₄-alkyl-S(=O)₂) as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl radical having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above) which is bonded via the sulfur atom of the sulfonyl group at any bond in the alkyl radical, i. e., for example SO₂-CH₃, SO₂-C₂H₅, n-propylsulfonyl, SO₂-CH(CH₃)₂, n-butylsulfonyl, 1-methylpropylsulfonyl, 2-methylpropylsulfonyl or SO₂-C(CH₃)₃.

10

The term "C₁-C₄-haloalkylthio" as used herein refers to a C₁-C₄-alkylthio radical as mentioned above which is partially or fully substituted by fluorine, chlorine, bromine and/or iodine, i.e., for example, fluoromethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, chlorodifluoromethylthio, bromodifluoromethylthio, 2-fluoroethylthio, 2-chloroethylthio, 2-bromoethylthio, 2-iodoethylthio, 2,2-difluoroethylthio, 2,2,2-trifluoroethylthio, 2,2,2-trichloroethylthio, 2-chloro-2-fluoroethylthio, 2-chloro-2,2-difluoroethylthio, 2,2-dichloro-2-fluoroethylthio, pentafluoroethylthio, 2-fluoropropylthio, 3-fluoropropylthio, 2-chloropropylthio, 3-chloropropylthio, 2-bromopropylthio, 3-bromopropylthio, 2,2-difluoropropylthio, 2,3-difluoropropylthio, 2,3-dichloropropylthio, 3,3,3-trifluoropropylthio, 3,3,3-trichloropropylthio, 2,2,3,3,3-pentafluoropropylthio, heptafluoropropylthio, 1-(fluoromethyl)-2-fluoroethylthio, 1-(chloromethyl)-2-chloroethylthio, 1-(bromomethyl)-2-bromoethylthio, 4-fluorobutylthio, 4-chlorobutylthio, 4-bromobutylthio or nonafluorobutylthio.

20

The term "C₁-C₄-alkoxycarbonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched alkoxy radical (as mentioned above) having 1 to 4 carbon atoms attached via the carbon atom of the carbonyl group, i.e., for example methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, n-propoxycarbonyl, 1-methylethoxycarbonyl, n-butoxycarbonyl, 1-methylpropoxycarbonyl, 2-methylpropoxycarbonyl or 1,1-dimethylethoxycarbonyl.

30

The term "(C₁-C₄-alkylamino)carbonyl" as used herein refers to, for example, methylaminocarbonyl, ethylaminocarbonyl, propylaminocarbonyl, 1-methylethylaminocarbonyl, butylaminocarbonyl, 1-methylpropylaminocarbonyl, 2-methylpropylaminocarbonyl or 1,1-dimethylethylaminocarbonyl.

35

The term "di-(C₁-C₄-alkyl)aminocarbonyl" as used herein refers to, for example, N,N-dimethylaminocarbonyl, N,N-diethylaminocarbonyl, N,N-di-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N,N-dipropylaminocarbonyl, N,N-dibutylaminocarbonyl, N,N-di-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-di-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-di-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-ethyl-N-methylaminocarbonyl, N-methyl-N-propylaminocarbonyl, N-methyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-butyl-N-methylaminocarbonyl, N-methyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-methyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl, N-ethyl-N-

40

propylaminocarbonyl, N-ethyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-butyl-N-ethylaminocarbonyl, N-ethyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-ethyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-methylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-butyl-N-propylaminocarbonyl, N-(1-methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(2-methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-butyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-(1-methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-butyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-butyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl or N-(1,1-dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl.

The term " C_2-C_6 -alkenyl" as used herein refers to a straight-chain or branched mono-unsaturated hydrocarbon radical having 2 to 6 carbon atoms and a double bond in any position, i.e., for example ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methyl-ethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl.

The term " C_2-C_6 -alkynyl" as used herein refers to a straight-chain or branched aliphatic hydrocarbon radical which contains a C-C triple bond and has 2 to 6 carbons atoms: for example ethynyl, prop-1-yn-1-yl, prop-2-yn-1-yl, n-but-1-yn-1-yl, n-but-1-yn-3-yl, n-but-1-yn-4-yl, n-but-2-yn-1-yl, n-pent-1-yn-1-yl, n-pent-1-yn-3-yl, n-pent-1-yn-4-yl, n-pent-1-yn-5-yl, n-pent-2-yn-1-yl, n-pent-2-yn-4-yl, n-pent-2-yn-5-yl, 3-methylbut-1-yn-3-yl, 3-methylbut-1-yn-4-yl, n-hex-1-yn-1-yl, n-hex-1-yn-3-yl, n-hex-1-yn-4-yl, n-hex-1-yn-5-yl, n-hex-1-yn-6-yl, n-hex-2-yn-1-yl, n-hex-2-yn-4-yl, n-hex-2-yn-5-yl, n-hex-2-yn-6-yl, n-hex-3-yn-1-yl, n-hex-3-yn-2-yl, 3-methylpent-1-yn-1-yl, 3-methylpent-1-yn-3-yl, 3-methylpent-1-yn-4-yl, 3-methylpent-1-yn-5-yl, 4-methylpent-1-yn-1-yl, 4-methylpent-2-yn-4-yl or 4-methylpent-2-yn-5-yl and the like.

The term "C₃-C₈-cycloalkyl" as used herein refers to a monocyclic hydrocarbon radical having 3 to 8 carbon atoms, for example cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl or cyclooctyl.

5

Among the 2-cyanobenzenesulfonamide compounds of the general formula I, preference is given to those in which the variables R¹ and R², independently of one another, but in particular in combination, have the meanings given below:

- 10 R¹ is C₁-C₂-alkyl, especially methyl, or C₁-C₂-alkoxy, especially methoxy;
R² is hydrogen or a linear, cyclic or branched-chain hydrocarbon radical having from 1 to 4 carbon atoms e.g. C₁-C₄-alkyl, in particular methyl, ethyl, n-propyl, 1-methylethyl, cyclopropyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, in particular 2-methoxyethyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, in particular 2-methylthioethyl or C₂-C₄-alkynyl, in particular prop-2-yn-1-yl (propargyl). Most preferred are compounds I wherein R² is selected from methyl, ethyl, 1-methylethyl and prop-2-yn-1-yl.

15

- Preference is also given to 2-cyanobenzenesulfonamide compounds of the general formula I, wherein R¹ is C₁-C₄-haloalkoxy, in particular C₁-haloalkoxy, especially trifluoromethoxy, difluoromethoxy or chlorodifluoromethoxy. In these compounds R² has the meanings given above, preferably hydrogen or a linear, cyclic or branched-chain hydrocarbon radical having from 1 to 4 carbon atoms e.g. C₁-C₄-alkyl, in particular methyl, ethyl, n-propyl, 1-methylethyl, cyclopropyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, in particular 2-methoxyethyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, in particular 2-methylthioethyl or C₂-C₄-alkynyl, in particular prop-2-yn-1-yl (propargyl). Most preferred are compounds I wherein R² is selected from methyl, ethyl, 1-methylethyl and prop-2-yn-1-yl.

20

25

- A preferred embodiment of the present invention relates to 2-cyanobenzene-sulfonamide compounds of the general formula I where the variables R¹ and R² have the meanings mentioned above and in particular the meanings given as being preferred and at least one of the radicals R³, R⁴ or R⁵ is different from hydrogen. Preferably one or two of the radicals R³, R⁴ and R⁵ represent hydrogen. Amongst these compounds preference is given to those compounds wherein R³ is different from hydrogen and preferably represents halogen, especially chlorine or fluorine, and the other radicals R⁴ and R⁵ are hydrogen.

30

35

- Another preferred embodiment of the present invention relates to 2-cyanobenzene-sulfonamide compounds of the general formula I where the variables R¹ and R² have the meanings mentioned above and in particular the meanings given as being preferred and each of the radicals R³, R⁴ and R⁵ represent hydrogen.

40

Examples of preferred compounds of the formula I of the present invention comprise those compounds which are given in the following tables A1 to A16, wherein R³, R⁴, R⁵ are as defined in the tables and wherein R¹ and R² are given in the rows of table A:

- Table A1: Compounds of the formula I, wherein each of R³, R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 5 Table A2: Compounds of the formula I, wherein R³ is chlorine R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A3: Compounds of the formula I, wherein R³ is fluorine R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 10 Table A4: Compounds of the formula I, wherein R³ is bromine R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A5: Compounds of the formula I, wherein R³ is iodine, R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 15 Table A6: Compounds of the formula I, wherein R³ is CH₃, R⁴ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A7: Compounds of the formula I, wherein R⁴ is chlorine R³ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 20 Table A8: Compounds of the formula I, wherein R⁴ is fluorine R³ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A9: Compounds of the formula I, wherein R⁴ is bromine R³ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 25 Table A10: Compounds of the formula I, wherein R⁴ is iodine, R³ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 30 Table A11: Compounds of the formula I, wherein R⁴ is CH₃, R³ and R⁵ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A12: Compounds of the formula I, wherein R⁵ is chlorine R³ and R⁴ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 35 Table A13: Compounds of the formula I, wherein R⁵ is fluorine R³ and R⁴ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- Table A14: Compounds of the formula I, wherein R⁵ is bromine R³ and R⁴ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A
- 40

Table A15: Compounds of the formula I, wherein R⁵ is iodine, R³ and R⁴ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A

5 Table A16: Compounds of the formula I, wherein R⁶ is CH₃, R³ and R⁴ are hydrogen and R¹ and R² are as defined in one row of table A

Table A:

	R ¹	R ²
1.	CH ₃	H
2.	CH ₃	CH ₃
3.	CH ₃	CH ₃ CH ₂ -
4.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-
5.	CH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
6.	CH ₃	n-C ₄ H ₉
7.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-
8.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
9.	CH ₃	n-C ₆ H ₁₁
10.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
11.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
12.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
13.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
14.	CH ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
15.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
16.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
17.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
18.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
19.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
20.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
21.	CH ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
22.	CH ₃	cyclopropyl
23.	CH ₃	cyclopropyl-CH ₂ -
24.	CH ₃	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
25.	CH ₃	cyclobutyl
26.	CH ₃	cyclopentyl
27.	CH ₃	cyclohexyl
28.	CH ₃	HC≡C-CH ₂ -
29.	CH ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
30.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
31.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
32.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
33.	CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
34.	CH ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-

	R ¹	R ²
35.	CH ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
36.	CH ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
37.	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
38.	CH ₃	4-(CH ₃) ₂ -C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
39.	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
40.	CH ₃	4-(CH ₃) ₂ -C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
41.	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
42.	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
43.	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
44.	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
45.	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
46.	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
47.	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
48.	CH ₃	NC-CH ₂ -
49.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
50.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
51.	CH ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
52.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃ -
53.	CH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
54.	CH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
55.	CH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
56.	CH ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
57.	CH ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
58.	CH ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
59.	CH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
60.	CH ₃	F ₂ C-CH ₂ -
61.	CH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
62.	CH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
63.	CH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
64.	CH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
65.	CH ₃	F ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
66.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
67.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
68.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
69.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
70.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
71.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
72.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
73.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
74.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
75.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
76.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
77.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
78.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
79.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
80.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
81.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
82.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
83.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
84.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
85.	CH ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
86.	CH ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
87.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
88.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
89.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
90.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
91.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
92.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
93.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
94.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
95.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
96.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
97.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
98.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
99.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
100.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
101.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
102.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
103.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
104.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
105.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
106.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
107.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
108.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
109.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
110.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
111.	CH ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
112.	CH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₃

	R ¹	R ²
113.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂
114.	CH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
115.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
116.	CH ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
117.	CH ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
118.	C ₂ H ₅	H
119.	C ₂ H ₅	CH ₃
120.	C ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ -
121.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-
122.	C ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
123.	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
124.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-
125.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
126.	C ₂ H ₅	n-C ₆ H ₁₁
127.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
128.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
129.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
130.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
131.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
132.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
133.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
134.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
135.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
136.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
137.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
138.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
139.	C ₂ H ₅	cyclopropyl
140.	C ₂ H ₅	cyclopropyl-CH ₂ -
141.	C ₂ H ₅	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
142.	C ₂ H ₅	cyclobutyl
143.	C ₂ H ₅	cyclopentyl
144.	C ₂ H ₅	cyclohexyl
145.	C ₂ H ₅	HC≡C-CH ₂ -
146.	C ₂ H ₅	HC≡C-CH(CH ₃)-
147.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
148.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-

	R ¹	R ²
149.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₇)-
150.	C ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂ -
151.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
152.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
153.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
154.	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
155.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
156.	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
157.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
158.	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
159.	C ₂ H ₅	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
160.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
161.	C ₂ H ₅	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
162.	C ₂ H ₅	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
163.	C ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
164.	C ₂ H ₅	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
165.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -
166.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -
167.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
168.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
169.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
170.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -
171.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -
172.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -
173.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
174.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
175.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
176.	C ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -
177.	C ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -
178.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
179.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
180.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
181.	C ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
182.	C ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
183.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
184.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
185.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
186.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
187.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
188.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
189.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
190.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
191.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
192.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
193.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
194.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
195.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
196.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
197.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
198.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
199.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
200.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
201.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
202.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
203.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
204.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
205.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
206.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
207.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
208.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
209.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
210.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
211.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
212.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
213.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
214.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
215.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
216.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
217.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
218.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
219.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
220.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -

	R ¹	R ²
221.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
222.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
223.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
224.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
225.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
226.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
227.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
228.	C ₂ H ₅	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
229.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
230.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
231.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
232.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
233.	C ₂ H ₅	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
234.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
235.	OCH ₃	H
236.	OCH ₃	CH ₃
237.	OCH ₃	CH ₃ CH ₂ -
238.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-
239.	OCH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
240.	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
241.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-
242.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
243.	OCH ₃	n-C ₆ H ₁₁
244.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
245.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
246.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
247.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
248.	OCH ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
249.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
250.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
251.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
252.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
253.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
254.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
255.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
256.	OCH ₃	cyclopropyl

	R ¹	R ²
257.	OCH ₃	cyclopropyl-CH ₂ -
258.	OCH ₃	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
259.	OCH ₃	cyclobutyl
260.	OCH ₃	cyclopentyl
261.	OCH ₃	cyclohexyl
262.	OCH ₃	HC≡C-CH ₂ -
263.	OCH ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
264.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
265.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
266.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
267.	OCH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
268.	OCH ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
269.	OCH ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
270.	OCH ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
271.	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
272.	OCH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
273.	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
274.	OCH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
275.	OCH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
276.	OCH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
277.	OCH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
278.	OCH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
279.	OCH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
280.	OCH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
281.	OCH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
282.	OCH ₃	NC-CH ₂ -
283.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
284.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
285.	OCH ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
286.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
287.	OCH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
288.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
289.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
290.	OCH ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
291.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
292.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-

	R ¹	R ²
293.	OCH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
294.	OCH ₃	F ₃ C-CH ₂ -
295.	OCH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
296.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
297.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
298.	OCH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
299.	OCH ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
300.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
301.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
302.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
303.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
304.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
305.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
306.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
307.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
308.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
309.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
310.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
311.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
312.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
313.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
314.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
315.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
316.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
317.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
318.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
319.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
320.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
321.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
322.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
323.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
324.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
325.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
326.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
327.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
328.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
329.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
330.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
331.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
332.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
333.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
334.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
335.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
336.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
337.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
338.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
339.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
340.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
341.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
342.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
343.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
344.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
345.	OCH ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
346.	OCH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
347.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
348.	OCH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
349.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
350.	OCH ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
351.	OCH ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
352.	OC ₂ H ₅	H
353.	OC ₂ H ₅	CH ₃
354.	OC ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ -
355.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-
356.	OC ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
357.	OC ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
358.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-
359.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
360.	OC ₂ H ₅	n-C ₈ H ₁₇
361.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
362.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
363.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
364.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
365.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
366.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
367.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
368.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
369.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
370.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
371.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
372.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
373.	OC ₂ H ₅	cyclopropyl
374.	OC ₂ H ₅	cyclopropyl-CH ₂ -
375.	OC ₂ H ₅	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
376.	OC ₂ H ₅	cyclobutyl
377.	OC ₂ H ₅	cyclopentyl
378.	OC ₂ H ₅	cyclohexyl
379.	OC ₂ H ₅	HC≡C-CH ₂ -
380.	OC ₂ H ₅	HC≡C-CH(CH ₃)-
381.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
382.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
383.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
384.	OC ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂ -
385.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
386.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
387.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
388.	OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
389.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
390.	OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
391.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
392.	OC ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
393.	OC ₂ H ₅	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
394.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
395.	OC ₂ H ₅	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
396.	OC ₂ H ₅	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
397.	OC ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
398.	OC ₂ H ₅	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
399.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -
400.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -

20

	R ¹	R ²
401.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
402.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
403.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
404.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -
405.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -
406.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -
407.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
408.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
409.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
410.	OC ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -
411.	OC ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -
412.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
413.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
414.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
415.	OC ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
416.	OC ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
417.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
418.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
419.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
420.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
421.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
422.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
423.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
424.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
425.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
426.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
427.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
428.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
429.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
430.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
431.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
432.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
433.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
434.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
435.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
436.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -

	R ¹	R ²
437.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
438.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
439.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
440.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
441.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
442.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
443.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
444.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
445.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
446.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
447.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
448.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
449.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
450.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
451.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
452.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
453.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
454.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
455.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
456.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
457.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
458.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
459.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
460.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
461.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
462.	OC ₂ H ₅	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
463.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
464.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
465.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
466.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
467.	OC ₂ H ₅	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
468.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
469.	CF ₃	H
470.	CF ₃	CH ₃
471.	CF ₃	CH ₃ CH ₂ -
472.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-

	R ¹	R ²
473.	CF ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
474.	CF ₃	n-C ₄ H ₉
475.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-
476.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
477.	CF ₃	n-C ₈ H ₁₇
478.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
479.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
480.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
481.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
482.	CF ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
483.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
484.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
485.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
486.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
487.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
488.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
489.	CF ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
490.	CF ₃	cyclopropyl
491.	CF ₃	cyclopropyl-CH ₂ -
492.	CF ₃	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
493.	CF ₃	cyclobutyl
494.	CF ₃	cyclopentyl
495.	CF ₃	cyclohexyl
496.	CF ₃	HC≡C-CH ₂ -
497.	CF ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
498.	CF ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
499.	CF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
500.	CF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
501.	CF ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
502.	CF ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
503.	CF ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
504.	CF ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
505.	CF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
506.	CF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
507.	CF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
508.	CF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
509.	CF ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
510.	CF ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
511.	CF ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
512.	CF ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
513.	CF ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
514.	CF ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
515.	CF ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
516.	CF ₃	NC-CH ₂ -
517.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
518.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
519.	CF ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
520.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
521.	CF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
522.	CF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
523.	CF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
524.	CF ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
525.	CF ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
526.	CF ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
527.	CF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
528.	CF ₃	F ₃ C-CH ₂ -
529.	CF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
530.	CF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
531.	CF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
532.	CF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
533.	CF ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
534.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
535.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
536.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
537.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
538.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
539.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
540.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
541.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
542.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
543.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
544.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-

	R ¹	R ²
545.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
546.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
547.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
548.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
549.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
550.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
551.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
552.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
553.	CF ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
554.	CF ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
555.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
556.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
557.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
558.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
559.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
560.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
561.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
562.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
563.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
564.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
565.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
566.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
567.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
568.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
569.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
570.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
571.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
572.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
573.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
574.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
575.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
576.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
577.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
578.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
579.	CF ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
580.	CF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -

25

	R ¹	R ²
581.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂
582.	CF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
583.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
584.	CF ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
585.	CF ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
586.	OCHF ₂	H
587.	OCHF ₂	CH ₃
588.	OCHF ₂	CH ₃ CH ₂ -
589.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-
590.	OCHF ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
591.	OCHF ₂	n-C ₄ H ₉
592.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-
593.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
594.	OCHF ₂	n-C ₅ H ₁₁
595.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
596.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
597.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
598.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
599.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
600.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
601.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
602.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
603.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
604.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
605.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
606.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
607.	OCHF ₂	cyclopropyl
608.	OCHF ₂	cyclopropyl-CH ₂ -
609.	OCHF ₂	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
610.	OCHF ₂	cyclobutyl
611.	OCHF ₂	cyclopentyl
612.	OCHF ₂	cyclohexyl
613.	OCHF ₂	HC≡C-CH ₂ -
614.	OCHF ₂	HC≡C-CH(CH ₃)-
615.	OCHF ₂	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
616.	OCHF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-

	R ¹	R ²
617.	OCHF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
618.	OCHF ₂	CH ₂ =CH-CH ₂ -
619.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
620.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
621.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
622.	OCHF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
623.	OCHF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
624.	OCHF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
625.	OCHF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
626.	OCHF ₂	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
627.	OCHF ₂	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
628.	OCHF ₂	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
629.	OCHF ₂	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
630.	OCHF ₂	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
631.	OCHF ₂	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
632.	OCHF ₂	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
633.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -
634.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -
635.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
636.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
637.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
638.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -
639.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -
640.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -
641.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
642.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
643.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
644.	OCHF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -
645.	OCHF ₂	F ₃ C-CH ₂ -
646.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
647.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
648.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
649.	OCHF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
650.	OCHF ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
651.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
652.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
653.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
654.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
655.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
656.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
657.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
658.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
659.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
660.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
661.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
662.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
663.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
664.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
665.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
666.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
667.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
668.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
669.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
670.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
671.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
672.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
673.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
674.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
675.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
676.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
677.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
678.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
679.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
680.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
681.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
682.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
683.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
684.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
685.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
686.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
687.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
688.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -

	R ¹	R ²
689.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
690.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
691.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
692.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
693.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
694.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
695.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
696.	OCHF ₂	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
697.	OCHF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
698.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
699.	OCHF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
700.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
701.	OCHF ₂	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
702.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
703.	OCF ₃	H
704.	OCF ₃	CH ₃
705.	OCF ₃	CH ₃ CH ₂ -
706.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-
707.	OCF ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
708.	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
709.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-
710.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
711.	OCF ₃	n-C ₆ H ₁₁
712.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
713.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
714.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
715.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
716.	OCF ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
717.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
718.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
719.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
720.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
721.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
722.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
723.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
724.	OCF ₃	cyclopropyl

	R ¹	R ²
725.	OCF ₃	cyclopropyl-CH ₂ -
726.	OCF ₃	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
727.	OCF ₃	cyclobutyl
728.	OCF ₃	cyclopentyl
729.	OCF ₃	cyclohexyl
730.	OCF ₃	HC≡C-CH ₂ -
731.	OCF ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
732.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
733.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
734.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
735.	OCF ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
736.	OCF ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
737.	OCF ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
738.	OCF ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
739.	OCF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
740.	OCF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
741.	OCF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
742.	OCF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
743.	OCF ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
744.	OCF ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
745.	OCF ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
746.	OCF ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
747.	OCF ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
748.	OCF ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
749.	OCF ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
750.	OCF ₃	NC-CH ₂ -
751.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
752.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
753.	OCF ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
754.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
755.	OCF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
756.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
757.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
758.	OCF ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
759.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
760.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-

	R ¹	R ²
761.	OCF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
762.	OCF ₃	F ₃ C-CH ₂ -
763.	OCF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
764.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
765.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
766.	OCF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
767.	OCF ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
768.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
769.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
770.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
771.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
772.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
773.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
774.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
775.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
776.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
777.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
778.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
779.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
780.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
781.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
782.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
783.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
784.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
785.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
786.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
787.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
788.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
789.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
790.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
791.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
792.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
793.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
794.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
795.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
796.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
797.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
798.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
799.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
800.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
801.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
802.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
803.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
804.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
805.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
806.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
807.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
808.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
809.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
810.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
811.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
812.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
813.	OCF ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
814.	OCF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
815.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
816.	OCF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
817.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
818.	OCF ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
819.	OCF ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
820.	OCCF ₂	H
821.	OCCF ₂	CH ₃
822.	OCCF ₂	CH ₃ CH ₂ -
823.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-
824.	OCCF ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
825.	OCCF ₂	n-C ₄ H ₉
826.	OCCF ₂	(CH ₃) ₃ C-
827.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
828.	OCCF ₂	n-C ₆ H ₁₁
829.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
830.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
831.	OCCF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
832.	OCCF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -

X

	R ¹	R ²
833.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
834.	OCCF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
835.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
836.	OCCF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
837.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
838.	OCCF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
839.	OCCF ₂	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
840.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
841.	OCCF ₂	cyclopropyl
842.	OCCF ₂	cyclopropyl-CH ₂ -
843.	OCCF ₂	cyclopropyl-CH(CH ₃)-
844.	OCCF ₂	cyclobutyl
845.	OCCF ₂	cyclopentyl
846.	OCCF ₂	cyclohexyl
847.	OCCF ₂	HC≡C-CH ₂ -
848.	OCCF ₂	HC≡C-CH(CH ₃)-
849.	OCCF ₂	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
850.	OCCF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
851.	OCCF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
852.	OCCF ₂	CH ₂ =CH-CH ₂ -
853.	OCCF ₂	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
854.	OCCF ₂	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
855.	OCCF ₂	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
856.	OCCF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
857.	OCCF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
858.	OCCF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
859.	OCCF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
860.	OCCF ₂	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
861.	OCCF ₂	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
862.	OCCF ₂	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
863.	OCCF ₂	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
864.	OCCF ₂	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
865.	OCCF ₂	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
866.	OCCF ₂	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
867.	OCCF ₂	NC-CH ₂ -
868.	OCCF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -

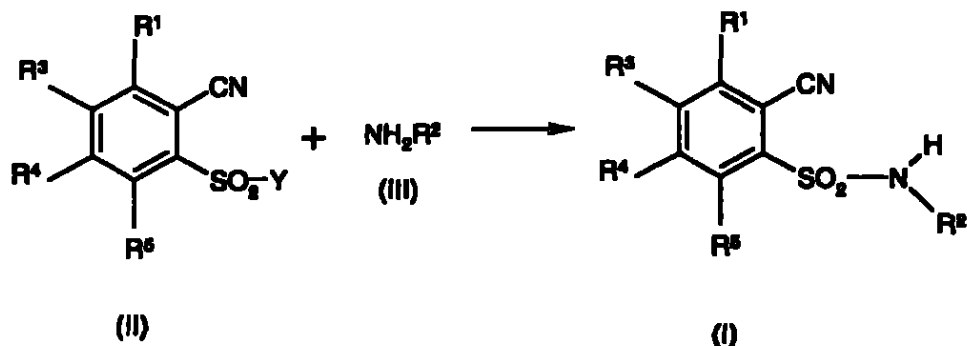
	R ¹	R ²
869.	OCCF ₂	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
870.	OCCF ₂	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
871.	OCCF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
872.	OCCF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -
873.	OCCF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -
874.	OCCF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -
875.	OCCF ₂	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
876.	OCCF ₂	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
877.	OCCF ₂	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
878.	OCCF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -
879.	OCCF ₂	F ₃ C-CH ₂ -
880.	OCCF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
881.	OCCF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
882.	OCCF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
883.	OCCF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
884.	OCCF ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
885.	OCCF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
886.	OCCF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
887.	OCCF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
888.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
889.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
890.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
891.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
892.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
893.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
894.	OCCF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
895.	OCCF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
896.	OCCF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
897.	OCCF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
898.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
899.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
900.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
901.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
902.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
903.	OCCF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
904.	OCCF ₂	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -

	R ¹	R ²
905.	OCCF ₂	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
906.	OCCF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
907.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
908.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
909.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
910.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
911.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
912.	OCCF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
913.	OCCF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
914.	OCCF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
915.	OCCF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
916.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
917.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
918.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
919.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
920.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
921.	OCCF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
922.	OCCF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
923.	OCCF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
924.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
925.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
926.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
927.	OCCF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
928.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
929.	OCCF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
930.	OCCF ₂	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
931.	OCCF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
932.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
933.	OCCF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
934.	OCCF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
935.	OCCF ₂	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
936.	OCCF ₂	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -

The 2-cyanobenzenesulfonamide compounds of the formula I can be prepared, for example, by reacting a 2-cyanobenzenesulfonylhalide II with ammonia or a primary

amine (III), similarly to a process described in J. March, 4th edition 1992, p. 499 (see Scheme 1).

Scheme 1:



In Scheme 1 the variables R¹ to R⁵ are as defined above and Y is halogen, especially chlorine or bromine. The reaction of a sulfonylhalide II, especially a sulfonylchloride, with an amine III is usually carried out in the presence of a solvent. Suitable solvents are polar solvents which are inert under the reaction conditions, for example C₁-C₄-alkanols such as methanol, ethanol, n-propanol or isopropanol, dialkyl ethers such as diethyl ether, diisopropyl ether or methyl tert-butyl ether, cyclic ethers such as dioxane or tetrahydrofuran, acetonitrile, carboxamides such as N,N-dimethyl formamide, N,N-dimethyl acetamide or N-methylpyrrolidinone, water, (provided the sulfonylhalide II is sufficiently resistant to hydrolysis under the reaction conditions used) or a mixture thereof.

In general, the amine III is employed in an at least equimolar amount, preferably at least 2-fold molar excess, based on the sulfonylhalide II, to bind the hydrogen halide formed. It may be advantageous to employ the primary amine III in an up to 6-fold molar excess, based on the sulfonylhalide II.

It may be advantageous to carry out the reaction in the presence of an auxiliary base. Suitable auxiliary bases include organic bases, for example tertiary amines, such as aliphatic tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine or diisopropylamine, cycloaliphatic tertiary amines such as N-methylpiperidine or aromatic amines such as pyridine, substituted pyridines such as 2,3,5-collidine, 2,4,6-collidine, 2,4-lutidine, 3,5-lutidine or 2,6-lutidine and inorganic bases for example alkali metal carbonates and alkaline earth metal carbonates such as lithium carbonate, potassium carbonate and sodium carbonate, calcium carbonate and alkaline metal hydrogencarbonates such as sodium hydrogen carbonate. The molar ratio of auxiliary base to sulfonylhalide II is preferably in the range of from 1:1 to 4:1, preferably 1:1 to 2:1. If the reaction is carried out in the presence of an auxiliary base, the molar ratio of primary amine III to sulfonylhalide II usually is 1:1 to 1.5:1.

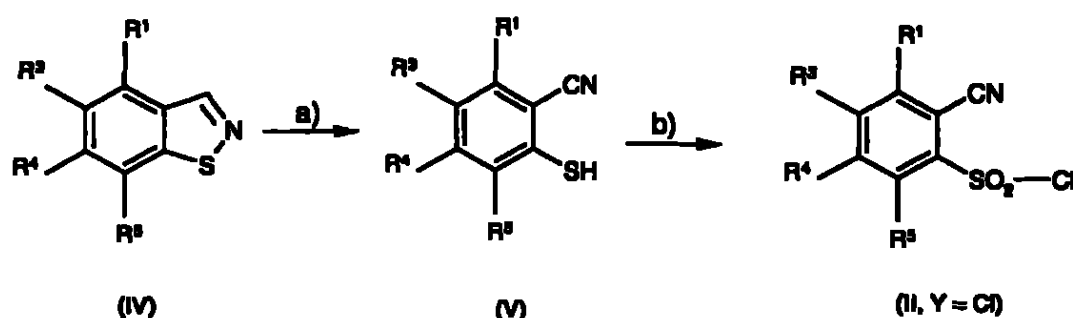
The reaction is usually carried out at a reaction temperature ranging from 0°C to the boiling point of the solvent, preferably from 0 to 30°C.

If not commercially available, the sulfonylhalide compounds II may be prepared, for example by one of the processes as described below.

The preparation of the sulfonylchloride compound II can be carried out, for example, according to the reaction sequence shown in Scheme 2 where the variables R¹, R³ to R⁵ are as defined above:

10

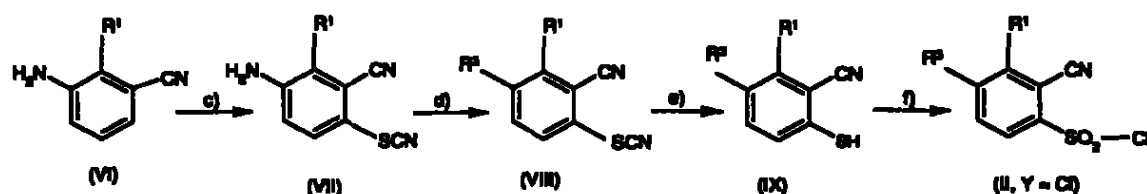
Scheme 2:



- a) conversion of a benzisothiazole IV to a thiol V, for example, in analogy to a process described in Liebigs Ann. Chem. 1980, 768-778, by reacting IV with a base such as an alkali metal hydroxide and alkaline earth metal hydroxide such as sodium hydroxide, potassium hydroxide and calcium hydroxide, an alkali metal hydride such as sodium hydride or potassium hydride or an alkoxide such as sodium methoxide, sodium ethoxide and the like in an inert organic solvent, for example an ether such as diethyl ether, diisopropyl ether, tetrahydrofuran, dioxane, or in a alcohol such as methanol, ethanol, propanol, isopropanol, butanol, 1,2-ethanediol, diethylene glycol, or in a carboxamide such as N,N-dimethyl formamide, N,N-dimethyl acetamide or N-methylpyrrolidinone or in dimethylsulfoxide or in a mixture of the above mentioned solvents; and acidification to yield the thiol V. The benzisothiazole IV can be prepared in analogy to a process described in Liebig Ann. Chem 729, 148-151 (1989); and subsequent
- b) oxidation of the thiol V to the sulfonylchloride II (Y = Cl), for example, by reacting the thiol V with chlorine in water or a water-solvent mixture, e.g. a mixture of water and acetic acid, in analogy to a process described in Jerry March, 3rd edition, 1985, reaction 9-27, page 1087.

Compounds II (where Y is chlorine and R⁴ and R⁵ are hydrogen) may be prepared by the reaction sequence shown in Scheme 3 where the variable R¹ has the meanings given above and R³ is H, Cl, Br, I or CN:

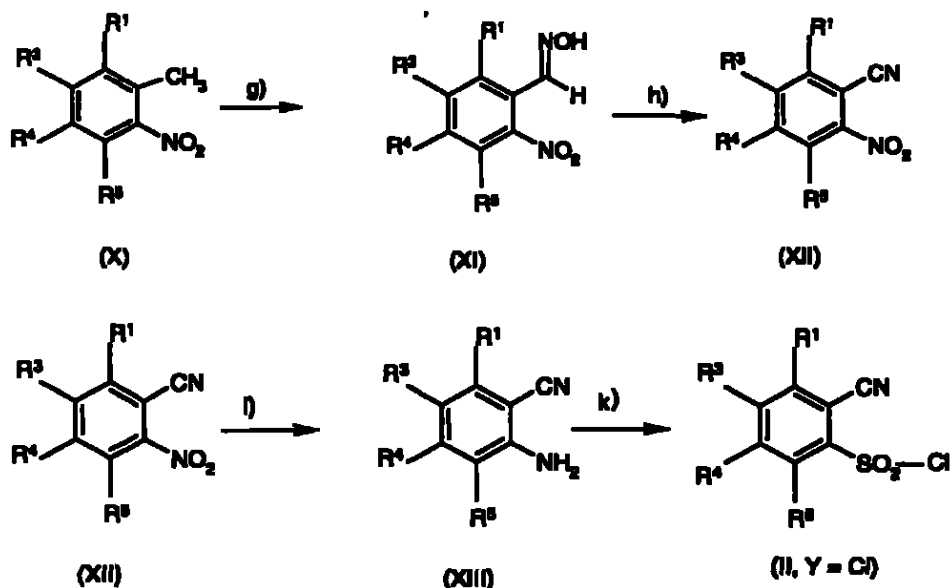
Scheme 3:



- 5 c) preparing a thiocyanato compound VII by thiocyanation of the aniline VI with thiocyanogen, for example, in analogy to a process described in EP 945 449, in Jerry March, 3rd edition, 1985, p. 476, in *Neuere Methoden der organischen Chemie*, Vol. 1, 237 (1944) or in J.L. Wood, *Organic Reactions*, vol. III, 240 (1946); the thiocyanogen is usually prepared in situ by reacting, for example, sodium thiocyanate with bromine in an inert solvent. Suitable solvents include alkanols such as methanol or ethanol or carboxylic acids such as acetic acid, propionic acid or isobutyric acid and mixtures thereof. Preferably, the inert solvent is methanol to which some sodium bromide may have been added for stabilization.
- 10
- 15 d) conversion of the amino group in VII into a diazonium group by a conventional diazotation followed by conversion of the diazonium group into hydrogen, chlorine, bromine or iodine or cyano. Suitable nitrosating agents are nitrosylum tetrafluoroborate, nitrosyl chloride, nitrosyl sulfuric acid, alkyl nitrites such as *t*-butyl nitrite, or salts of nitrous acid such as sodium nitrite. The conversion of the resulting diazonium salt into the corresponding compound VIII where R² = cyano, chlorine, bromine or iodine may be carried out by treatment of VII with a solution or suspension of a copper(I) salt, such as copper(I) cyanide, chloride, bromide or iodide or with a solution of an alkali metal salt (cf., for example, Houben-Weyl, *Methoden der organischen Chemie* [Methods of Organic Chemistry], Georg Thieme Verlag Stuttgart, Vol. 5/4, 4th edition 1960, p. 438 ff.) The conversion of the resulting diazonium salt into the corresponding compound VIII where R² = H, for example, may be carried out by treatment with hypophosphorous acid, phosphorous acid, sodium stannite or in non-aqueous media by treatment with tributyltin hydride or (C₂H₅)₃SnH or with sodium borohydride (cf., for example, Jerry March, 3rd edition, 1985, 646f).
- 20
- 25
- 30 e) reduction of the thiocyanate VIII to the corresponding thiol compound IX by treatment with zinc in the presence of sulfuric acid or by treatment with sodium sulfide; and subsequent
- 35 f) oxidation of the thiol IX to obtain the sulfonylchloride II in analogy to step b) of scheme 2.

Furthermore, the benzenesulfonylchloride II (Y = Cl) may be prepared by the reaction sequence shown in Scheme 4 where the variables R¹, R², R³ and R⁵ are as defined above.

5 Scheme 4:



- 10 (g) transformation of nitrotoluene X into the benzaldoxime compound XI, for example in analogy to a process described in WO 00/29394. The transformation of X into XI is e.g. achieved by reacting nitro compound X with an organic nitrite R-ONO, wherein R is alkyl in the presence of a base. Suitable nitrites are C₂-C₈-alkyl nitrites such as n-butyl nitrite or (iso)amyl nitrite. Suitable bases are alkali metal alkoxides such as sodium methoxide, potassium methoxide or potassium tert-butoxide, alkali metal hydroxides such as NaOH or KOH or organo magnesium compounds such as Grignard reagents of the formula R'MgX (R' = alkyl, X = halogen). The reaction is usually carried out in an inert solvent, which preferably comprises a polar aprotic solvent. Suitable polar aprotic solvents include carboxamides such as N,N-dialkylformamides, e.g. N,N-dimethylformamide, N,N-dialkylacetamides, e.g. N,N-dimethylacetamide or N-alkyl lactams e.g. N-methylpyrrolidone or mixtures thereof or mixtures thereof with non-polar solvents such as alkanes, cycloalkanes and aromatic solvents e.g. toluene and xylenes. When using sodium bases, 1-10 mol % of an alcohol may be added, if appropriate. The stoichiometric ratios are, for example, as follows: 1-4 equivalents of base, 1-2 equivalents of R-ONO; preferably 1.5-2.5 equivalents of base and 1-1.3 equivalents of R-ONO; equally preferably: 1-2 equivalents of base and 1-1.3 equivalents of R-ONO. The reaction is usually carried out in the range from -60°C to room temperature, preferably -50°C to -20°C, in particular from -35°C to -25°C.
- 15
- 20
- 25
- 30

- (h) dehydration of the aldoxime XI to the nitrile XII, for example by treatment with a dehydrating agent such as acetic anhydride, ethyl orthoformate and H^+ , $(C_6H_5)_3P-CCl_4$, trichloromethyl chloroformate, methyl (or ethyl) cyanoformate, trifluoromethane sulfonic anhydride in analogy to a procedure described in Jerry March, 4th edition, 1992, 1038f;
- (i) reduction of compound XII to the aniline XIII, for example by reacting the nitro compound XII with a metal, such as iron, zinc or tin or with $SnCl_2$, under acidic conditions, with a complex hydride, such as lithium aluminium hydride and sodium. The reduction may be carried out without dilution or in a solvent or diluent. Suitable solvents are – depending on the reduction reagent chosen – for example water, alkanols, such as methanol, ethanol and isopropanol, or ethers, such as diethyl ether, methyl tert-butyl ether, dioxane, tetrahydrofuran and ethylene glycol dimethyl ether.
- The nitro group in compound XII may also be converted into an amino group by catalytic hydrogenation (see, for example, Houben Weyl, Vol. IV/1c, p. 506 ff or WO 00/29394). Catalysts being suitable are, for example, platinum or palladium catalysts, wherein the metal may be supported on an inert carrier such as activated carbon, clays, celite, silica, alumina, alkaline or earth alkaline carbonates etc. The metal content of the catalyst may vary from 1 to 20% by weight, based on the support. In general, from 0.001 to 1% by weight of platinum or palladium, based on the nitro compound XII, preferably from 0.01 to 1% by weight of platinum or palladium are used. The reaction is usually carried out either without a solvent or in an inert solvent or diluent. Suitable solvents or diluents include aromatics such as benzene, toluene, xylenes, carboxamides such as N,N-dialkylformamides, e.g. N,N-dimethylformamide, N,N-dialkylacetamides, e.g. N,N-dimethylacetamide or N-alkyl lactams e.g. N-methylpyrrolidone, tetraalkylureas, such as tetramethylurea, tetrabutylurea, N,N'-dimethylpropylene urea and N,N'-dimethylethylene urea, alkanols such as methanol, ethanol, isopropanol, or n-butanol, ethers, such as diethyl ether, methyl tert-butyl ether, dioxane, tetrahydrofuran and ethylene glycol dimethyl ether, carboxylic acids such as acetic acid or propionic acid, carbonic acid ester such as ethyl acetate. The reaction temperature is usually in the range from $-20^\circ C$ to $100^\circ C$, preferably $0^\circ C$ to $50^\circ C$. The hydrogenation may be carried out under atmospheric hydrogen pressure or elevated hydrogen pressure.
- (k) conversion of the amino group of compound XIII into the corresponding diazonium group followed by reacting the diazonium salt with sulfur dioxide in the presence of copper(II) chloride to afford the sulfonylchloride II. The diazonium salt may be prepared as described in step d) of scheme 3. Preferably, sodium nitrite is used as alkyl nitrite. In general, the sulfur dioxide is dissolved in glacial acetic acid.

The compounds of formula XIII may also be prepared according to methods described in WO 94/18980 using ortho-nitroanilines as precursors or WO 00/059868 using isatin precursors.

- 5 If individual compounds cannot be obtained via the above-described routes, they can be prepared by derivatization of other compounds I or by customary modifications of the synthesis routes described.

- 10 The reaction mixtures are worked up in the customary manner, for example by mixing with water, separating the phases and, if appropriate, purifying the crude products by chromatography, for example on alumina or silica gel may be employed. Some of the intermediates and end products may be obtained in the form of colorless or pale brown viscous oils which are freed or purified from volatile components under reduced pressure and at moderately elevated temperature. If the intermediates and end products
15 are obtained as solids, they may be purified by recrystallisation or digestion.

- Due to their excellent activity, the compounds of the general formula I may be used for controlling animal pests. Animal pests include harmful insects and acaridae. Accordingly, the invention further provides an agriculturally composition for combating animal
20 pests, especially insects and/or acaridae which comprises such an amount of at least one compound of the general formula I and/or at least one agriculturally useful salt of I and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant.

- 25 Such a composition may contain a single active compound of the general formula I or a mixture of several active compounds I according to the present invention. The composition according to the present invention may comprise an individual isomer or mixtures of isomers.

- 30 The 2-cyanobenzenesulfonamide compounds I and the pesticidal compositions comprising them are effective agents for controlling animal pests. Animal pests controlled by the compounds of formula I include for example:

- 35 Insects from the order of the lepidopterans (*Lepidoptera*), for example *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatilis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Chelmonobria brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydla pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keliferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria*
40

- monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frugiperda*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatococcus ptyocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* and *Zeiraphera canadensis*;
- beetles (Coleoptera), for example *Agrius sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Cricocoris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hyllobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorhynchus sulcatus*, *Ortiorhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllorhynchus sp.*, *Phyllorhynchus horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* and *Sitophilus granarius*;
- dipterans (Diptera), for example *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hyoscyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* and *Tipula paludosa*;
- thrips (Thysanoptera), e.g. *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Sclerothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*;
- hymenopterans (Hymenoptera) such as ants, bees, wasps and sawflies, e.g. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster spp.*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus spp.*, *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*,

Dolichovespula maculata, *Vespa crabro*, *Polistes*, *rubiginosa*, *Campodontus floridanus*, and *Linepithema humile* (*Linepithema humile*);

- heteropterans (Heteroptera), e.g. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Plesma quadrata*, *Solubea insularis* and *Thyanta perditor*;
- homopterans (Homoptera), e.g. *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyralis*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantivandae*, and *Viteus vitifolii*;
- termites (Isoptera), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* and *Termes natalensis*;
- orthopterans (Orthoptera), e.g. *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* and *Tachycines asynamorus*;
- Arachnoidea, such as arachnids (Acarina), e.g. of the families *Argasidae*, *Ixodidae* and *Sarcoptidae*, such as *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Pavlovius ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, and *Eriophyidae* spp. such as *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptura oleivora* and *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. such as *Phytonemus pallidus* and *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. such as *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. such as *Tetranychus cinnabarinus*,

Tetranychus kanzawai, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* and *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, and *oligonychus pratensis*;

Siphonatera, e.g. *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

5

The compounds of the formula I are preferably used for controlling pests of the orders Homoptera and Thysanoptera.

10

The compounds of the formula I are also preferably used for controlling pests of the orders Hymenoptera.

15

The compounds of formula (I) or the pesticidal compositions comprising them may be used to protect growing plants and crops from attack or infestation by animal pests, especially insects or acaridae by contacting the plant/crop with a pesticidally effective amount of compounds of formula (I). The term "crop" refers both to growing and harvested crops.

20

The animal pest, especially the insect, acaridae, plant and/or soil or water in which the plant is growing can be contacted with the present compound(s) I or composition(s) containing them by any application method known in the art. As such, "contacting" includes both direct contact (applying the compounds/compositions directly on the animal pest, especially the insect and/or acaridae, and/or plant - typically to the foliage, stem or roots of the plant) and indirect contact (applying the compounds/compositions to the locus of the animal pest, especially the insect and/or acaridae, and/or plant).

25

Moreover, animal pests, especially insects or acaridae may be controlled by contacting the target pest, its food supply or its locus with a pesticidally effective amount of compounds of formula (I). As such, the application may be carried out before or after the infection of the locus, growing crops, or harvested crops by the pest.

30

"Locus" means a habitat, breeding ground, plant, seed, soil, area, material or environment in which a pest or parasite is growing or may grow.

35

Effective amounts suitable for use in the method of invention may vary depending upon the particular formula I compound, target pest, method of application, application timing, weather conditions, animal pest habitat, especially insect, or acarid habitat, or the like. In general, for use in treating crop plants, the rate of application of the compounds I and/or compositions according to this invention may be in the range of about 0.1 g to about 4000 g per hectare, desirably from about 25 g to about 800 g per hectare, more desirably from about 50 g to about 500 g per hectare. For use in treating seeds, the typical rate of application is of from about 1 g to about 500 g per kilogram of seeds, desirably from about 2 g to about 300 g per kilogram of seeds, more desirably from about 10 g to about 200 g per kilogram of seeds. Customary application rates in the protection of materials are, for example, from about 0.001 g to about 2000 g, desirably

40

from about 0.005 g to about 1000 g, of active compound per cubic meter of treated material.

- 5 The compounds I or the pesticidal compositions comprising them can be used, for example in the form of solutions, emulsions, microemulsions, suspensions, flowable concentrates, dusts, powders, pastes and granules. The use form depends on the particular purpose; in any case, it should guarantee a fine and uniform distribution of the compound according to the invention.
- 10 The pesticidal composition for combating animal pests, especially insects and/or acaridae contains such an amount of at least one compound of the general formula I or an agriculturally useful salt of I and auxiliaries which are usually used in formulating pesticidal composition.
- 15 The formulations are prepared in a known manner, e.g. by extending the active ingredient with solvents and/or carriers, if desired using emulsifiers and dispersants, it also being possible to use other organic solvents as auxiliary solvents if water is used as the diluent. Auxiliaries which are suitable are essentially: solvents such as aromatics (e.g. xylene), chlorinated aromatics (e.g. chlorobenzenes), paraffins (e.g. mineral oil fractions), alcohols (e.g. methanol, butanol), ketones (e.g. cyclohexanone), amines (e.g. ethanolamine, dimethylformamide) and water; carriers such as ground natural minerals (e.g. kaolins, clays, talc, chalk) and ground synthetic minerals (e.g. highly-disperse silica, silicates); emulsifiers such as non-ionic and anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates) and dispersants
- 20 such as lignin-sulfite waste liquors and methylcellulose.
- Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl-naphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates and fatty acids and their alkali metal and alkaline earth metal salts, salts of sulfated fatty alcohol glycol ether, condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol or formaldehyde, polyoxyethylene octylphenyl ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ethers,
- 30 alkylaryl polyether alcohols, isotridecyl alcohol, fatty alcohol/ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignin-sulfite waste liquors and methylcellulose.
- 40 Substances which are suitable for the preparation of directly sprayable solutions, emulsions, pastes or oil dispersions are mineral oil fractions of medium to high boiling point, such as kerosene or diesel oil, furthermore coal tar oils and oils of vegetable or animal origin, aliphatic, cyclic and aromatic hydrocarbons, e.g. benzene, toluene, xylene, paraffin, tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol,

ethanol, propanol, butanol, chloroform, carbon tetrachloride, cyclohexanol, cyclohexanone, chlorobenzene, isophorone, strongly polar solvents, e.g. dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone and water.

- 5 Powders, materials for scattering and dusts can be prepared by mixing or concomitantly grinding the active substances with a solid carrier.

- Granules, e.g. coated granules, compacted granules, impregnated granules and homogeneous granules, can be prepared by binding the active ingredients to solid carriers. Examples of solid carriers are mineral earths, such as silicas, silica gels, silicates, talc, kaolin, attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate, magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, ureas, and products of vegetable origin, such as cereal meal, tree bark meal, wood meal and nutshell meal, cellulose powders and other solid carriers.

- Such formulations or compositions of the present invention include a formula I compound of this invention (or combinations thereof) admixed with one or more agronomically acceptable inert, solid or liquid carriers. Those compositions contain a pesticidally effective amount of said compound or compounds, which amount may vary depending upon the particular compound, target pest, and method of use.

- In general, the formulations comprise of from 0.01 to 95% by weight, preferably from 0.1 to 90% by weight, of the active ingredient. The active ingredients are employed in a purity of from 90% to 100%, preferably 95% to 100% (according to NMR spectrum).

The following are exemplary formulations:

- I. 5 parts by weight of a compound according to the invention are mixed intimately with 95 parts by weight of finely divided kaolin. This gives a dust which comprises 5% by weight of the active ingredient.
- II. 30 parts by weight of a compound according to the invention are mixed intimately with a mixture of 92 parts by weight of pulverulent silica gel and 8 parts by weight of paraffin oil which had been sprayed onto the surface of this silica gel. This gives a formulation of the active ingredient with good adhesion properties (comprises 23% by weight of active ingredient).
- III. 10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in a mixture composed of 90 parts by weight of xylene, 6 parts by weight of the adduct of 8 to 10 mol of ethylene oxide and 1 mol of oleic acid N-monoethanolamide, 2 parts by weight of calcium dodecylbenzenesulfonate and 2 parts by weight of the adduct of 40 mol of ethylene oxide and 1 mol of castor oil

(comprises 9% by weight of active ingredient).

- 5 IV. 20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in a mixture composed of 60 parts by weight of cyclohexanone, 30 parts by weight of isobutanol, 5 parts by weight of the adduct of 7 mol of ethylene oxide and 1 mol of isooctylphenol and 5 parts by weight of the adduct of 40 mol of ethylene oxide and 1 mol of castor oil (comprises 16% by weight of active ingredient).
- 10 V. 80 parts by weight of a compound according to the invention are mixed thoroughly with 3 parts by weight of sodium diisobutyl-naphthalene- α -sulfonate, 10 parts by weight of the sodium salt of a lignosulfonic acid from a sulfite waste liquor and 7 parts by weight of pulverulent silica gel, and the mixture is ground in a hammer mill (comprises 80% by weight of active ingredient).
- 15 VI. 90 parts by weight of a compound according to the invention are mixed with 10 parts by weight of N-methyl- α -pyrrolidone, which gives a solution which is suitable for use in the form of microdrops (comprises 90% by weight of active ingredient).
- 20 VII. 20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in a mixture composed of 40 parts by weight of cyclohexanone, 30 parts by weight of isobutanol, 20 parts by weight of the adduct of 7 mol of ethylene oxide and 1 mol of isooctylphenol and 10 parts by weight of the adduct of 40 mol of ethylene oxide and 1 mol of castor oil. Pouring the solution into 100,000 parts by weight of water and finely distributing it therein gives an aqueous dispersion which comprises 0.02% by weight of the active ingredient.
- 25 VIII. 20 parts by weight of a compound according to the invention are mixed thoroughly with 3 parts by weight of sodium diisobutyl-naphthalene- α -sulfonate, 17 parts by weight of the sodium salt of a lignosulfonic acid from a sulfite waste liquor and 60 parts by weight of pulverulent silica gel, and the mixture is ground in a hammer mill. Finely distributing the mixture in 20,000 parts by weight of water gives a spray mixture which comprises 0.1% by weight of the active ingredient.
- 30
- 35 The active ingredients can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, e.g. in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dusts, materials for spreading, or granules, by means of spraying, atomizing, dusting, scattering or pouring. The use forms depend entirely on the intended purposes; in any case, this is intended
- 40 to guarantee the finest possible distribution of the active ingredients according to the invention.

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions,

5 pastes or oil dispersions, the substances as such or dissolved in an oil or solvent, can be homogenized in water by means of wetter, tackifier, dispersant or emulsifier. Alternatively, it is possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

10 The active ingredient concentrations in the ready-to-use products can be varied within substantial ranges. In general, they are from 0.0001 to 10%, preferably from 0.01 to 1%.

The active ingredients may also be used successfully in the ultra-low-volume process (ULV), it being possible to apply formulations comprising over 95% by weight of active ingredient, or even the active ingredient without additives.

15 Compositions to be used according to this invention may also contain other active ingredients, for example other pesticides, insecticides, herbicides, fungicides, other pesticides, or bactericides, fertilizers such as ammonium nitrate, urea, potash, and superphosphate, phytotoxicants and plant growth regulators, safeners and nematicides. These additional ingredients may be used sequentially or in combination
20 with the above-described compositions, if appropriate also added only immediately prior to use (tank mix). For example, the plant(s) may be sprayed with a composition of this invention either before or after being treated with other active ingredients.

25 These agents can be admixed with the agents used according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1. Mixing the compounds I or the compositions comprising them in the use form as pesticides with other pesticides frequently results in a broader pesticidal spectrum of action.

30 The following list of pesticides together with which the compounds of formula I can be used, is intended to illustrate the possible combinations, but not to impose any limitation:

35 Organophosphates: Acephate, Azinphos-methyl, Chlorpyrifos, Chlorfenvinphos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, Dimethoate, Disulfoton, Ethion, Fentrothion, Fenthion, Isoxathion, Malathion, Methamidophos, Methidathion, Methyl-Parathion, Mevinphos, Monocrotophos, Oxydemeton-methyl, Paraoxon, Parathion, Phenthoate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phorate, Phoxim, Pirmiphos-methyl, Profenofos, Prothiofos, Sulphophos, Triazophos, Trichlorfon;

40 Carbamates: Alanycarb, Benfuracarb, Carbaryl, Carbosulfan, Fenoxycarb, Furathiocarb, Indoxacarb, Methlocarb, Methomyl, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Triazamate;

Pyrethroids: Bifenthrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Esfenvalerate, Ethofenprox, Fenpropathrin, Fenvalerate, Cyhalothrin, Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Tralomethrin, Zeta-Cypermethrin;

- 5 **Arthropod growth regulators:** a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas: Chlorfluazuron, Diflubenzuron, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Teflubenzuron, Triflumuron; Buprofezin, Difenolan, Hexythiazox, Etoxazole, Clofentazine; b) ecdysone antagonists: Halofenozide, Methoxyfenozide, Tebufenozide; c) juvenoids: Pyriproxyfen, Methoprene, Fenoxycarb; d) lipid biosynthesis inhibitors:
10 Spirodiclofen;

- Various:** Abamectin, Acequinocyl, Amitraz, Azadirachtin, Bifenazate, Cartap, Chlorfenapyr, Chlordimeform, Cyromazine, Diafenthiuron, Dinotofuran, Difenolan, Emamectin, Endosulfan, Ethiprole, Fenazaquin, Fipronil, Formetanate, Formetanate hydrochloride, Hydramethylnon, Imidacloprid, Indoxacarb, Pyridaben, Pymetrozine, Spinosad, Sulfur, Tebufenpyrad, Thiamethoxam, and Thiocyclam.
15

The present invention is now illustrated in further details by the following examples.

20 I. Synthesis Examples

Example 1: *n*-Propyl-(2-cyano-3-methyl-phenyl)sulfonamide

1.1: 2-Cyano-3-methyl-phenylsulfonylchloride

- 25 A solution of 11.6 g (88 mmol) of 2-amino-6-methylbenzonitrile (prepared, e.g. according to WO 94/18980) in 120 ml of glacial acetic acid was initially charged and 32.2 g of concentrated hydrochloric acid were slowly added at room temperature. The reaction mixture was stirred at room temperatures for 10 minutes and then a solution of 6.4 g
30 (92 mmol) of sodium nitrite in 20 ml of water was added dropwise at 5-10°C. The reaction mixture was stirred at 0°C for one hour to obtain the diazonium salt. In a separate stirred flask, a saturated solution of sulfur dioxide in glacial acetic acid was prepared at 10°C and a solution of 5.5 g of copper(II) chloride in 11 ml of water was added. The reaction mixture of the diazonium salt which had been prepared beforehand was then
35 added dropwise to the solution of the copper salt. The resulting mixture was stirred at room temperature for additional 45 minutes. Then the reaction mixture was poured into ice-cooled water and the aqueous phase was extracted three times with dichloromethane. The combined organic layers were dried over a drying agent and filtered. The filtrate was concentrated in vacuo to afford 16.4 g (87% of the theory) of the title compound having a melting point of 75-77°C.
40

1.2: *n*-Propyl-(2-cyano-3-methyl-phenyl)sulfonamide

A solution of 1 g (5 mmol) of 2-cyano-3-methyl-phenylsulfonylchloride in 10 ml of tetrahydrofuran was added to a solution of 630 mg (11 mmol) of n-propylamine in 20 ml of tetrahydrofuran at room temperature. The reaction mixture was stirred at room temperature for 3 hours before water was added. The aqueous phase was acidified with hydrochloric acid (10% strength by weight, aqueous solution) to pH = 3 and then extracted three times with dichloromethane. The combined organic extracts were dried over sodium sulfate and filtered. The filtrate was concentrated in vacuo to afford 850 mg (85% of theory) of the title compound having a melting point of 74-77°C.

10

Example 2: Methyl-(2-cyano-3-methoxy-phenyl)sulfonamide

2.1: 2-Amino-6-methoxy-benzonitrile

15 A solution of 70 g (0.5 mol) of 2-amino-6-fluoro-benzonitrile (prepared, e.g. according to US 4,504,660) in 250 ml of N,N-dimethylformamide was initially charged and a solution of 30.6 g (0.55 mol) sodium methoxide in 70 ml of methanol was added dropwise at room temperature while stirring. The mixture was then refluxed for 5 hours under stirring. The completion of the reaction was monitored by TLC. Additional 25 g of sodium methoxide in 35 ml methanol were added and the reaction mixture was refluxed for additional 4 hours while stirring. The reaction mixture was concentrated under reduced pressure, the resulting residue was triturated with water, sucked off and the obtained solids were dissolved in ethyl acetate. The resulting solution was concentrated in vacuo. The obtained residue was triturated with petroleum ether and sucked off to afford 48 g (83% of theory) of a brownish solid having a melting point of 143-146°C.

2.2: 2-Cyano-3-methoxy-phenylsulfonylchloride

10 g of concentrated hydrochloric acid were slowly added to a solution of 4.0 (27 mmol) of 2-amino-6-methoxy-benzonitrile in 32 ml of glacial acetic acid at room temperature while stirring. The mixture was stirred at room temperatures for 10 minutes. Then a solution of 1.9 g (27.3 mmol) sodium nitrite in 5 ml of water was added at 5-10°C and the reaction mixture was stirred at 0°C for 1 hour to obtain the diazonium salt. In a separate flask, a saturated solution of sulfur dioxide in 68 ml of glacial acetic acid was prepared at room temperature and a solution of 1.7 g of copper(II) chloride in 4 ml of water was added. The reaction mixture of the diazonium salt which had been prepared beforehand was then quickly added to the solution of the copper salt. The resulting mixture was stirred at room temperature for additional 2.5 hours. The reaction mixture was then poured into ice-cooled water. The aqueous layer was extracted three times with dichloromethane. The combined organic extracts were dried over a drying agent and filtered off with suction. The filtrate was concentrated in vacuo to afford 5.3 g (85% of theory) of the title compound having a melting point of 98-99°C.

2.3: Methyl-(2-cyano-3-methoxy-phenyl)sulfonamide

A solution of 1.25 g (5.4 mmol) of 2-cyano-3-methoxy-phenylsulfonylchloride in 30 ml of tetrahydrofuran was added to a solution of 960 mg (12 mmol) of an aqueous solution of methylamine (40% by weight) in 20 ml of tetrahydrofuran at room temperature. The reaction mixture was stirred at room temperature for 30 minutes before water was added. The aqueous phase was acidified to pH = 3 using hydrochloric acid (10% strength by weight, aqueous solution). The aqueous phase was then extracted three times with dichloromethane. The combined organic extracts were dried over sodium sulfate and filtered. The filtrate was concentrated in vacuo and the resulting residue was triturated with methyl tert-butyl ether to afford 0.28 g (23% of theory) of the title compound having a melting point of 121-128 °C.

Example 3: Ethyl-(4-chloro-2-cyano-3-methyl-phenyl)sulfonamide

3.1: 5-Chloro-6-methyl-2-thiocyano-benzonitrile

30 g (190 mmol) of 2-methyl-3-cyano-4-thiocyanatoaniline (prepared according to EP 0945449) were dissolved in 160 ml of glacial acetic acid and 63 g of concentrated hydrochloric acid were slowly added dropwise under stirring. The mixture was stirred for 10 minutes, and then a solution of 11 g (160 mmol) of sodium nitrite in 23 ml of water was added dropwise at 5-10 °C to obtain the diazonium salt. In a separate flask, a solution of 16 g of copper(I) chloride in 50 ml of concentrated hydrochloric acid was prepared. The reaction mixture of the diazonium salt which had been prepared beforehand was then quickly added dropwise to the solution of the copper salt. The resulting reaction mixture was stirred at room temperature for 24 hours. The reaction mixture was then poured into ice-cooled water and the aqueous phase was extracted three times with dichloromethane. The combined organic layers were dried, filtered and then evaporated. The resulting crude product was purified by column chromatography on silica gel (eluent: toluene/ethyl acetate) to yield 14.3 g (43% of theory) of the title compound having a melting point of 78-80°C.

3.2: 4-Chloro-2-cyano-3-methyl-phenylsulfonylchloride

A suspension of 3.0 g (21 mmol) of 5-chloro-6-methyl-2-thiocyanatobenzonitrile in 20 ml of methanol was initially charged, and a solution of 1.9 g (14 mmol) of sodium sulfide in 8 ml of water was added while the temperature was maintained at 20 to 35°C. The resulting yellow solution was stirred at room temperature for 2 days. The mixture was then diluted with water and extracted with methyl tert-butyl ether. The aqueous phase was adjusted to pH 7 by addition of concentrated hydrochloric acid and then extracted with dichloromethane. The aqueous phase was subsequently adjusted to pH 1 by addition of concentrated hydrochloric acid and then extracted with dichloromethane. The organic layer was dried, filtered and then concentrated. The obtained residue was suspended in a mixture of 20 ml of glacial acetic acid, 5 ml of dichloromethane and 18 ml of water and a stream of chlorine gas was then introduced at 25-

45°C over a period of 3 hours. The reaction mixture was diluted with dichloromethane and the organic phase was washed with ice-cooled water. Drying of the organic phase over sodium sulfate was followed by filtration and concentration of the solution to yield 1.3 g (36% of theory) of the title compound having a melting point of 69-72°C.

5

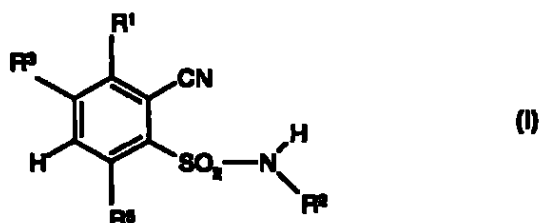
3.3: Ethyl-(4-chloro-2-cyano-3-methyl-phenyl)sulfonamide

An aqueous solution of 770 mg (12 mmol) of ethylamine (70% by weight) in 20 ml of tetrahydrofuran was initially charged, and a solution of 1.3 g (5.2 mmol) of 4-chloro-2-cyano-3-methylphenylsulfonylchloride from 3.2. In 10 ml of tetrahydrofuran was added dropwise at room temperature. The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 hours, diluted with water and adjusted to pH 3 by addition of hydrochloric acid (10% strength by weight, aqueous solution). The aqueous phase was extracted three times with dichloromethane. The combined organic layers were dried over sodium sulfate, filtered and then evaporated to dryness in vacuo to obtain 0.5 g (28% of theory) of a brown solid having a melting point of 85-90°C.

The compounds nos. 4 to 191 of the formula I with $R^4 = H$ listed in the following table 1 and the compounds nos. 192 and 193 of the formula I with $R^5 = H$ listed in table 2 were prepared analogously.

20

Table 1:



25

Example no.	R^3	R^5	R^1	R^2	m.p. [°C]
1	H	H	CH ₃	n-CH ₂ CH ₂ CH ₃	74-77
2	H	H	OCH ₃	-CH ₃	121-128
3	Cl	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	85-90
4	CN	CH ₃	CH ₃	-CH ₃	178-180
5	Br	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	112-114
6	Br	H	CH ₃	cyclopropyl	140-142
7	Br	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉	112-116
8	Br	H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	102-103
9	Br	H	CH ₃	n-CH ₂ CH ₂ CH ₃	119-120
10	Br	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	139-140
11	Br	H	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	147-151

Example no.	R ³	R ⁵	R ¹	R ²	m.p. [°C]
12	H	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	117-119
13	H	H	CH ₃	4-(CH ₃) ₂ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	97-103
14	H	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	150-151
15	Br	H	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	123-125
16	H	H	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	117-122
17	Br	H	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	156-161
18	H	H	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-132
19	Br	H	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	103-108
20	H	H	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-130
21	Br	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-131
22	Br	H	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	102-108
23	H	H	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	118-125
24	Br	H	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	118-125
25	H	H	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	128-131
26	Br	H	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	153-155
27	H	H	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	135-137
28	Br	H	CH ₃	cyclopropyl-CH ₂ -	106-110
29	H	H	CH ₃	-CH ₂	83-89
30	H	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	98-103
31	H	H	CH ₃	prop-2-ynyl	104-107
32	Br	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	106-110
33	H	H	CH ₃	cyclopropyl-CH ₂ -	89-93
34	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	130-134
35	Br	H	CH ₃	prop-2-ynyl	¹ H-NMR
36	Br	H	CH ₃	(CH ₃) ₂ C-CH ₂ -	112-114
37	H	H	CH ₃	(CH ₃) ₂ C-CH ₂ -	86-93
38	H	H	CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	¹ H-NMR
39	H	H	OCH ₃	-CH ₂ CH ₃	121-126
40	H	H	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	108-119
41	H	H	OCH ₃	-CH(CH ₃) ₂	104-113
42	H	H	OCH ₃	prop-2-ynyl	122-138
43	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CN	¹ H-NMR
44	H	H	OCH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	¹ H-NMR
45	H	H	OCH ₃	H	186-198
46	Cl	H	CH ₃	-CH ₃	112-122
47	Cl	H	CH ₃	H	160-162
48	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₃	91-95
49	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	111-113
50	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	183-186
51	Cl	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	132-135
52	Cl	H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	86-94

Example no.	R ³	R ⁵	R ¹	R ²	m.p. [°C]
53	Cl	H	CH ₃	prop-2-ynyl	¹ H-NMR
54	Cl	H	CH ₃	H ₂ C=CHCH ₂ -	95-96
55	Cl	H	CH ₃	FH ₂ CCH ₂ -	115-121
56	H	H	OCH ₂ CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	oil
57	H	H	OCH ₂ CH ₃	prop-2-ynyl	105-112
58	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CN	129-134
59	H	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	oil
60	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	113-115
61	H	H	OCH ₂ CH ₃	cyclopropyl-CH ₂	128-130
62	Cl	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	134-138
63	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CF ₃	oil
64	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₃	oil
65	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₃	oil
66	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₃	98-100
67	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	132-136
68	H	H	OCH(CH ₃) ₂	prop-2-ynyl	oil
69	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CN	oil
70	H	H	OCH(CH ₃) ₂	cyclopropyl	oil
71	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃) ₂	oil
72	H	H	OCH(CH ₃) ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	oil
73	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₃	oil
74	Br	H	CH ₃	H	149-151
75	H	H	CH ₃	H	171-174
76	H	H	OCH(CH ₃) ₂	O-CH ₂ -CH ₃	oil
77	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	oil
78	H	H	OCHF ₂	H	135-137
79	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -C≡CH	65-70
80	H	H	OCH ₂ CHClCH ₂ Cl	H	123-129
81	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₃	82-91
82	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -o-C ₆ H ₅	92-95
83	H	H	OCH ₃	-o-C ₆ H ₅	142-148
84	H	H	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH ₃	138-143
85	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CN	123-130
86	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	oil
87	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S(O) ₂ -CH ₃	157-160
88	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ F	134-140
89	H	H	OCHF ₂	H	122-128
90	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CF ₃	136-141
91	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CHF ₂	116-118
92	H	H	OCH ₃	-O-CH ₃	136-139
93	Br	H	OCH ₃	-CH ₂ -C≡CH	110-115

Example no.	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	m.p. [°C]
94	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	94-97
95	Br	H	OCH ₃	-CH ₂ -C ₆ H ₅	134-136
96	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CF ₃	120-138
97	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -C ₆ H ₅	115-117
98	H	H	OCHF ₂	-c-C ₃ H ₅	87-91
99	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	¹ H-NMR
100	Br	H	OCHF ₂	-CH ₃	168-173
101	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH=CH ₂	75-78
102	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -c-C ₃ H ₅	¹ H-NMR
103	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	54-58
104	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	¹ H-NMR
105	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CN	83-88
106	H	H	OCHF ₂	-CH-(CH ₃) ₂	72-74
107	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CHF ₂	92-96
108	H	H	OCHF ₂	-O-CH ₃	oil
109	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₃	81-86
110	H	H	CF ₃	-CH ₂ -C≡CH	106-111
111	H	H	CF ₃	-CH ₂ -C ₆ H ₅	106-108
112	H	H	CF ₃	-CH ₃	104-113
113	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	71-73
114	H	H	CF ₃	-CH-(CH ₃) ₂	85-87
115	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	62-66
116	H	H	CF ₃	-CH ₂ -c-C ₃ H ₅	oil
117	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CF ₃	oil
118	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	oil
119	H	H	CF ₃	-c-C ₃ H ₅	94-96
120	H	H	CF ₃	-O-CH ₂ -CH ₃	118-120
121	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	169-171
122	H	H	CH ₃	-O-CH ₂ -CH ₃	118-121
123	H	H	CH ₃	-O-CH ₃	136-140
124	H	H	CH ₃	-cyclobutyl	HPLC/MS
125	H	H	CH ₃	-cyclopentyl	HPLC/MS
126	H	H	CH ₃	-cyclohexyl	HPLC/MS
127	H	H	CH ₃	-cyclopropyl	HPLC/MS
128	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/MS
129	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(C ₂ H ₅) ₂	HPLC/MS
130	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
131	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	HPLC/MS
132	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₃	HPLC/MS
133	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₃	HPLC/MS
134	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/MS

Example no.	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	m.p. [°C]
135	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N[CH(CH ₃) ₂] ₂	HPLC/MS
136	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/MS
137	H	H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅) ₂	HPLC/MS
138	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
139	H	H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)-CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/MS
140	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -C≡CH	HPLC/MS
141	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/MS
142	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/MS
143	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	HPLC/MS
144	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/MS
145	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	¹ H-NMR
146	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₃	HPLC/MS
147	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(OC ₂ H ₅) ₂	HPLC/MS
148	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/MS
149	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
150	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
151	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/MS
152	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH ₃	HPLC/MS
153	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -C ₂ H ₅	HPLC/MS
154	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/MS
155	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -S-C ₂ H ₅	HPLC/MS
156	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/MS
157	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -N(CH ₃) ₂	HPLC/MS
158	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)(n-C ₃ H ₇) ₂ -C≡CH	HPLC/MS
159	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH=CH ₂	HPLC/MS
160	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C(O)-O-CH ₃	HPLC/MS
161	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-o-C ₂ H ₅	HPLC/MS
162	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CF ₃	HPLC/MS
163	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/MS
164	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	HPLC/MS
165	H	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
166	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CN	HPLC/MS
167	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	HPLC/MS
168	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/MS
169	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -F	HPLC/MS
170	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/MS
171	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃) ₂	HPLC/MS
172	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -Cl	HPLC/MS
173	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -Cl	HPLC/MS
174	H	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -Cl	HPLC/MS
175	H	H	CH ₃	-CH ₂ -C(O)-O-CH ₃	HPLC/MS

Example no.	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	m.p. [°C]
176	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -Br	HPLC/MS
177	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/MS
178	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-C ₂ H ₅	HPLC/MS
179	CN	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₃	114-119
180	CN	H	CH ₃	-CH ₃	172-175
181	CN	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡CH	95-105
182	CN	H	CH ₃	H	oil
183	CN	H	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	83-95
184	CN	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	95-99
185	CN	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -F	oil
186	CN	H	CH ₃	-cyclopropyl	oil
187	CN	H	CH ₃	-O-CH ₃	139-142
188	OCH ₃	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₃	171-174
189	OCH ₃	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡CH	151-155
190	OCH ₃	H	CH ₃	-H	171-180
191	OCH ₃	H	CH ₃	-CH ₃	171-175

m.p. melting point;

c-C₃H₅: cyclopropyl;

n-C₃H₇: n-propyl

5

Some compounds were characterized by ¹H-NMR. The signals are characterized by chemical shift (ppm) vs. tetramethylsilane, by their multiplicity and by their integral (relative number of hydrogen atoms given). The following abbreviations are used to characterize the multiplicity of the signals: m = multiplett, t = triplett, d = doublett and s = singulett.

10

Example 35: 2.06 (t, 1H), 2.72 (s, 3H), 3.92 (m, 2H), 5.56 (t, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), CDCl₃

15

Example 38: 2.66 (s, 3H), 3.67 (m, 2H), 5.12 (d, 1H), 5.21 (d, 1H), 5.30 (t, 1H), 5.74 (m, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.95 (d, 1H), CDCl₃

Example 43: 4.04 (s, 3H), 4.13 (d, 2H), 6.15 (t, 1H), 7.30 (m, 1H), 7.72 (m, 2H), CDCl₃

Example 44: 3.67 (m, 2H), 4.04 (s, 3H), 5.11 (d, 1H), 5.23 (m, 2H), 5.76 (m, 1H), 7.23 (dd, 1H), 7.68 (m, 2H), CDCl₃

20

Example 53: 2.07 (m, 1H), 2.72 (s, 3H), 3.95 (m, 2H), 5.52 (t, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), CDCl₃

Example 99: 2.05 (s, 3H), 2.66 (t, 2H), 3.28 (q, 2H), 5.62 (t, 1H), 6.73 (t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.77 (t, 1H), 7.99 (d, 1H), CDCl₃

25

Example 102: 0.13 (m, 2H), 0.31 (m, 2H), 0.90 (m, 1H), 2.95 (t, 2H), 5.32 (t, 1H), 6.72 (t, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.77 (t, 1H), 8.00 (d, 1H), CDCl₃

Example 104: 3.27 (s, 3H), 3.33 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 5.58 (t, 1H), 6.75 (t, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.77 (t, 1H), 8.00 (d, 1H), CDCl₃

Example 145: 2.65 (s, 3H), 3.15 (pt, 2H), 3.3 (s, 6H), 4.35 (t, 1H), 5.65 (t, 1H) 7.55 (d, 1H), 7.6 (t, 1H), 7.9 (d, 1H), CDCl₃

5

Some compounds were characterized by coupled High Performance Liquid Chromatography / mass spectrometry (HPLC/MS).

HPLC column: RP-18 column (Chromolith Speed ROD from Merck KGaA, Germany).

Elution: acetonitrile + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA) / water in a ratio from 5:95 to 95:5

10 In 5 minutes at 40 °C.

MS: Quadrupol electrospray ionisation, 80 V (positiv modus)

Example 124: 2.813 min, m/z = 273 [M+Na]⁺

Example 125: 3.043 min, m/z = 287 [M+Na]⁺

15 Example 126: 3.260 min, m/z = 279 [M+H]⁺

Example 127: 2.486 min, m/z = 237 [M+H]⁺

Example 128: 3.198 min, m/z = 267 [M+H]⁺

Example 129: 1.955 min, m/z = 310 [M+H]⁺

Example 130: 3.244 min, m/z = 267 [M+H]⁺

20 Example 131: 3.438 min, m/z = 281 [M+H]⁺

Example 132: 3.004 min, m/z = 253 [M+H]⁺

Example 133: 3.483 min, m/z = 303 [M+H]⁺

Example 134: 3.533 min, m/z = 281 [M+H]⁺

Example 135: 2.091 min, m/z = 324 [M+H]⁺

25 Example 136: 2.534 min, m/z = 269 [M+H]⁺

Example 137: 3.154 min, m/z = 267 [M+H]⁺

Example 138: 3.413 min, m/z = 303 [M+H]⁺

Example 139: 2.761 min, m/z = 283 [M+H]⁺

Example 140: 2.740 min, m/z = 263 [M+H]⁺

30 Example 141: 2.802 min, m/z = 283 [M+H]⁺

Example 142: 2.596 min, m/z = 269 [M+H]⁺

Example 143: 3.225 min, m/z = 267 [M+H]⁺

Example 144: 3.636 min, m/z = 285 [M+H]⁺

Example 146: 3.430 min, m/z = 281 [M+H]⁺

35 Example 147: 2.934 min, m/z = 335 [M+Na]⁺

Example 148: 2.677 min, m/z = 271 [M+H]⁺

Example 149: 2.989 min, m/z = 253 [M+H]⁺

Example 150: 3.254 min, m/z = 267 [M+H]⁺

Example 151: 2.443 min, m/z = 269 [M+H]⁺

40 Example 152: 2.481 min, m/z = 269 [M+H]⁺

Example 153: 3.501 min, m/z = 281 [M+H]⁺

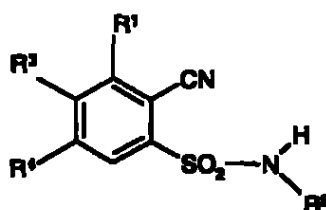
Example 154: 2.750 min, m/z = 285 [M+H]⁺

Example 155: 3.362 min, m/z = 335 [M+Na]⁺

Example 156: 3.116 min, m/z = 321 [M+Na]⁺

- Example 157: 1.740 min, $m/z = 282$ $[M+H]^+$
 Example 158: 3.249 min, $m/z = 291$ $[M+H]^+$
 Example 159: 2.985 min, $m/z = 265$ $[M+H]^+$
 Example 160: 2.364 min, $m/z = 283$ $[M+H]^+$
 5 Example 161: 2.919 min, $m/z = 265$ $[M+H]^+$
 Example 162: 2.644 min, $m/z = 301$ $[M+Na]^+$
 Example 163: 2.177 min, $m/z = 255$ $[M+H]^+$
 Example 164: 2.917 min, $m/z = 253$ $[M+H]^+$
 Example 165: 2.570 min, $m/z = 239$ $[M+H]^+$
 10 Example 166: 2.500 min, $m/z = 278$ $[M+H]^+$
 Example 167: 3.314 min, $m/z = 282$ $[M+H]^+$
 Example 168: 3.297 min, $m/z = 267$ $[M+H]^+$
 Example 169: 2.259 min, $m/z = 243$ $[M+H]^+$
 Example 170: 2.709 min, $m/z = 283$ $[M+H]^+$
 15 Example 171: 2.814 min, $m/z = 283$ $[M+H]^+$
 Example 172: 2.733 min, $m/z = 273$ $[M+H]^+$
 Example 173: 2.729 min, $m/z = 273$ $[M+H]^+$
 Example 174: 2.743 min, $m/z = 283$ $[M+H]^+$
 Example 175: 2.187 min, $m/z = 269$ $[M+H]^+$
 20 Example 176: 2.935 min, $m/z = 317$ $[M+H]^+$
 Example 177: 3.090 min, $m/z = 253$ $[M+H]^+$
 Example 178: 2.956 min, $m/z = 285$ $[M+H]^+$

25 Table 2:



Example no.	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	m.p. [°C]
191	H	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₃	119-123
192	H	Br	CH ₃	CH ₂ CH ₃	141-144

30 II. Examples of action against pests

The action of the compounds of the formula I against pests was demonstrated by the following experiments:

35 Green Peach Aphid (*Myzus persicae*)

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic® surfactant.

- 5 Pepper plants in the 2nd leaf-pair stage (variety 'California Wonder') were infested with approximately 40 laboratory-reared aphids by placing infested leaf sections on top of the test plants. The leaf sections were removed after 24 hr. The leaves of the intact plants were dipped into gradient solutions of the test compound and allowed to dry. Test plants were maintained under fluorescent light (24 hour photoperiod) at about 25°C and 20-40% relative humidity. Aphid mortality on the treated plants, relative to mortality on check plants, was determined after 5 days.

- 10 In this test, compounds nos. 1, 2, 3, 5, 12, 23, 29, 30, 31, 33, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, and 55 at 300 ppm showed over 85% mortality in comparison with untreated controls.

- 15 Cotton Aphid (*Aphis gossypii*)

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic® surfactant.

- 20 Cotton plants in the cotyledon stage (variety 'Delta Pine', one plant per pot) were infested by placing a heavily infested leaf from the main colony on top of each cotyledon. The aphids were allowed to transfer to the host plant overnight, and the leaf used to transfer the aphids were removed. The cotyledons were dipped in the test solution and allowed to dry. After 5 days, mortality counts were made.

- 25 In this test, compounds nos. 2, 3, 5, 6, 8, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, and 55 at 300 ppm showed over 85% mortality in comparison with untreated controls.

- 30 Bean Aphid (*Aphis fabae*)

- 35 The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic® surfactant.

- 40 Nasturtium plants grown in Metro mix in the 1st leaf-pair stage (variety 'Mixed Jewel') were infested with approximately 2-30 laboratory-reared aphids by placing infested cut plants on top of the test plants. The cut plants were removed after 24 hr. Each plant was dipped into the test solution to provide complete coverage of the foliage, stem, protruding seed surface and surrounding cube surface and allowed to dry in the fume hood. The treated plants were kept at about 25°C with continuous fluorescent light. Aphid mortality is determined after 3 days.

In this test, compounds nos. 30, 38, 5, 6, 7, 8, 23, 29, 32, 33, 34, 35, 40, 41, 42, and 45 at 300 ppm showed over 85% mortality in comparison with untreated controls.

Silverleaf whitefly (*Bemisia argentifolii*)

5

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm K-netic® surfactant.

10 Selected cotton plants were grown to the cotyledon state (one plant per pot). The cotyledons were dipped into the test solution to provide complete coverage of the foliage and placed in a well-vented area to dry. Each pot with treated seedling was placed in a plastic cup and 10 to 12 whitefly adults (approximately 3-5 day old) were introduced. The insects were collected using an aspirator and an 0.8 cm, non-toxic Tygon® tubing (R-3803) connected to a barrier pipette tip. The tip, containing the collected insects, 15 was then gently inserted into the soil containing the treated plant, allowing insects to crawl out of the tip to reach the foliage for feeding. The cups were covered with a reusable screened lid (150 micron mesh polyester screen PeCap from Tetko Inc). Test plants were maintained in the holding room at about 25°C and 20-40% humidity for 3 days avoiding direct exposure to the fluorescent light (24 photoperiod) to prevent trapping of heat inside the cup. Mortality was assessed 3 days after treatment of the plants. 20

In this test, compounds no. 5 and 42 at 300 ppm showed over 70% mortality compared to untreated controls.

25 **2-spotted Spider Mite (*Tetranychus urticae*, OP-resistant strain)**

Sieva lima bean plants (variety 'Henderson') with primary leaves expanded to 7-12 cm were infested by placing on each a small piece from an infested leaf (with about 100 mites) taken from the main colony. This was done at about 2 hours before treatment to 30 allow the mites to move over to the test plant to lay eggs. The piece of leaf used to transfer the mites was removed. The newly-infested plants were dipped in the test solution and allowed to dry. The test plants were kept under fluorescent light (24 hour photoperiod) at about 25°C and 20-40% relative humidity. After 5 days, one leaf was removed and mortality counts were made.

35

In this test, compounds nos. 8 and 30 at 300 ppm showed over 75% mortality compared to untreated controls.

Florida Carpenter Ant (*Camponotus floridanus*)

40

The tests were conducted in petri dishes. Ants were given a water source and then were starved of a food source for 24 hours. Baits were prepared with 20 % honey/water solution. A solution of the active ingredient in acetone was added to reach a concentration of the active ingredient of 1% by weight (w/w). 0.2 ml of the active ingredient con-

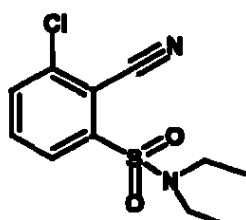
taining honey/water solution, placed in a cap, was added to each dish. The dishes were covered and maintained at a water temperature of 22°C. The ants were observed for mortality daily. Mortality was determined after 10 days.

- 5 In these tests, compounds nos. 66, 78 and 79 showed over 85% mortality compared to untreated controls.

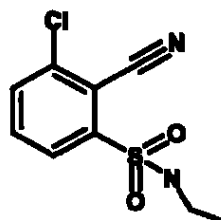
Argentine Ants (*Linepithema humile*)

- 10 a) The tests were conducted in petri dishes. Ants were given a water source and then were starved of a food source for 24 hours. Baits were prepared with 20% honey/water solution. A solution of the active ingredient in acetone was added to reach a concentration of the active ingredient of 1% by weight (w/w). 0.2 ml of the active ingredient containing honey/water solution, placed in a cap, was added to
- 15 each dish. The dishes were covered and maintained at a water temperature of 22°C. The ants were observed for mortality daily. Mortality was determined after 10 days.
- In these tests, compounds nos. 66, 78 and 79 showed 100% mortality compared to untreated controls.

- 20 b) The tests were conducted as in example a). The following compounds I and II according to EP 33984 were used as comparative examples. The ants were observed for mortality after 6 days. The results are shown in Table 3.



Comparative Example I



Comparative Example II

25

Table 3: Bioactivity against Argentine ants, *Linepithema humile*

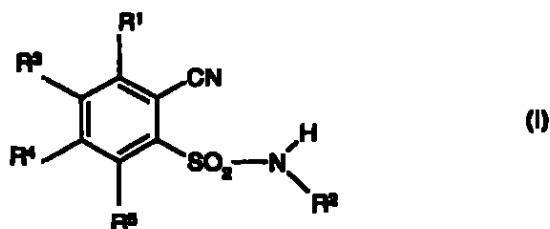
Treatment	% ai ¹⁾ (w/w)	Mean cumulative % mortality 6 days after treatment ²⁾
Compound No. 66	1.0	100.0
Comparative Example I	1.0	35.6
Comparative Example II	1.0	35.6
Control ²⁾	na	17.8

¹⁾ % active ingredient

30 ²⁾ each mean is based on 45 ants (3 replications/treatment)

We claim:

1. A 2-cyanobenzenesulfonamide compound of the general formula I



5

where

R^1 is C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy or C_1 - C_4 -haloalkoxy;

10

R^2 is hydrogen, C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, wherein the five last-mentioned radicals may be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or may carry one, two, or three radicals selected from the group consisting of C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -haloalkylthio, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, cyano, amino, $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, C_3 - C_8 -cycloalkyl and phenyl, it being possible for phenyl to be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or to carry one, two or three substituents selected from the group consisting of C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -haloalkoxy; and

15

20

R^3 , R^4 and R^5 are independently of one another selected from the group consisting of hydrogen, halogen, cyano, nitro, C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -haloalkoxy, C_1 - C_4 -haloalkylthio, C_2 - C_8 -alkenyl, C_2 - C_8 -alkynyl, C_1 - C_4 -alkoxycarbonyl, amino, $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, aminocarbonyl, $(C_1$ - C_4 -alkyl)aminocarbonyl and di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)aminocarbonyl;

25

30

and/or the agriculturally useful salts thereof.

2. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^1 is C_1 - C_2 -alkyl or C_1 - C_2 -alkoxy.

35

3. A compound as claimed in claim 2 wherein in formula I R^1 is methyl.

4. A compound as claimed in claim 2 wherein in formula I R^1 is methoxy.

5. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^1 is C_1 - C_4 -haloalkoxy.
6. A compound as claimed in claim 5 wherein in formula I R^1 is C_1 -haloalkoxy, in particular difluoromethoxy.
- 5 7. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^2 is selected from the group consisting of hydrogen, a hydrocarbon radical having from 1 to 4 carbon atoms, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl and C_2 - C_4 -alkinyl.
- 10 8. A compound as claimed in claim 5 wherein R^2 is hydrogen, methyl, ethyl, 1-methylethyl, or prop-2-yn-1-yl.
9. A compound as claimed in claim 1 where in formula I at least one of the radicals R^3 , R^4 and R^5 is different from hydrogen.
- 15 10. A compound as claimed in claim 9 where R^3 is halogen.
11. A compound as claimed in claim 1 where in formula I the radicals R^3 , R^4 or R^5 represent hydrogen.
- 20 12. An agricultural composition comprising such an amount of at least one compound of the general formula I and/or at least one agriculturally useful salt of I as defined in claim 1 and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant.
- 25 13. A method of combating animal pests which comprises contacting the animal pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material or environment in which the animal pests are growing or may grow, or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from animal attack or infestation with a pesticidally effective amount of at least one 2-cyano-benzenesulfonamide compound of the general formula I and/or at least one agriculturally acceptable salt thereof.
- 30 14. A method as defined in claim 13 where the animal pest is from the order Homoptera.
- 35 15. A method as defined in claim 13 where the animal pest is from the order Hymenoptera.
- 40 16. A method as defined in claim 13 where the animal pest is from the order Thysanoptera.
17. A method for protecting crops from attack or infestation by animal pests which comprises contacting a crop with a pesticidally effective amount of at least one

2-cyano-benzenesulfonamide compound of the general formula I and/or at least one salt thereof as defined in claim 1.

28
78

2-CIANOBCENCENOSULFONAMIDAS PARA COMBATIR PLAGAS ANIMALES

La presente invención se refiere a compuestos de 2-cianobencenosulfonamidas y a las sales de éstas, útiles para la agricultura, y a composiciones que comprenden esos compuestos. La invención se refiere asimismo al uso de compuestos de 2-cianobenceno-sulfonamidas, a sales de esos compuestos o a composiciones que los comprenden, destinadas a combatir plagas animales.

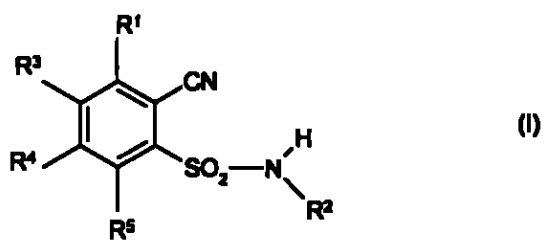
Las plagas animales destruyen cosechas en crecimiento y ya recogidas y atacan estructuras habitacionales y comerciales de madera, causando graves pérdidas económicas al suministro de alimentos y a la propiedad. Aunque se conocen un gran número de agentes pesticidas, hay una permanente necesidad de nuevos agentes para combatir las plagas animales, debido a la aptitud de las plagas objetivo de desarrollar resistencia a dichos agentes. En particular, son difíciles de controlar eficazmente plagas animales tales como las de los insectos y de los ácaros.

EP 0033984 describe compuestos sustituidos de 2-cianobencenosulfonamida que tienen acción aficida. Los compuestos de bencenosulfonamida llevan preferentemente un átomo de flúor o de cloro en la posición 3 del anillo fenilo. No obstante, la acción plaguicida de dichos compuestos es insatisfactoria; son activos solamente contra los áfidos.

Uno de los objetos de la presente invención es, por lo tanto, proveer compuestos que tengan una buena acción plaguicida, especialmente contra insectos y ácaros que son difíciles de controlar.

Se ha comprobado que esos objetivos se logran empleando compuestos de 2-ciano-bencenosulfonamida de la fórmula general I

84
79



en la que

- R¹** es alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ ó haloalcoxi-C₁-C₄;
- R²** es hidrógeno, alquilo-C₁-C₈, alquenilo-C₂-C₈, alquinilo-C₂-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈ o alcoxi-C₁-C₄, en el que los cinco radicales mencionados en último término pueden estar no sustituidos, halogenados parcial o totalmente y/o portar uno, dos o tres radicales seleccionados de entre el grupo compuesto por alcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquilsulfinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, ciano, amino, (alquilo-C₁-C₄)amino, di(alquilo-C₁-C₄)amino, cicloalquilo-C₃-C₈, y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o totalmente halogenado y/o que porte uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de entre el grupo compuesto por alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄; y
- R³, R⁴ y R⁵** son, independientemente el uno del otro, seleccionados de entre el grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, alquilsulfinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₈, alquinilo-C₂-C₈, alcoxycarbonilo-C₁-C₄, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, aminocarbonilo, (alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo y di(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo;

y sus sales aceptables en agricultura. Los compuestos de la fórmula I y sus sales aceptables en agricultura tienen una fuerte acción plaguicida, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

Por consiguiente, la presente invención se refiere a compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y a sus sales útiles en agricultura.

Además, la presente invención se refiere

- al uso de compuestos I y/o a sus sales para combatir plagas animales;
- a composiciones agrícolas que comprenden tal cantidad de por lo menos un compuesto de la fórmula I y/o al menos una sal útil en agricultura de I, y por lo menos un portador inerte agrónomicamente aceptable, líquido y/o sólido, que le dé acción plaguicida y, si se lo desea, por lo menos un tensioactivo; y
- a un método para combatir plagas animales que comprenden tomar contacto con las plagas animales, su hábito, campo de cultivo, suministro de alimento, plantas, semillas, suelo, área, material o ambiente en el cual las plagas animales estén creciendo o puedan crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que han de protegerse de ataques o infestaciones por animales, con una cantidad efectiva como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobenecenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de éste, aceptable en agricultura.

En los sustituyentes R¹ a R⁵, los compuestos de la fórmula general I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereoisómeros. La presente invención provee tanto enantiómeros o diastereoisómeros puros como mezclas de ellos.

Las sales de los compuestos de la fórmula I que son aptas para el uso de acuerdo con la invención son sales especialmente aceptables en agricultura. Pueden formarse por un método habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión.

Son sales útiles en agricultura especialmente las sales de esos cationes o las sales por adición de ácidos de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efecto negativo sobre la acción de los compuestos conformes a la presente invención, que son útiles para combatir insectos o arácnidos dañinos. De ese modo, son cationes aptos en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente el litio, el sodio y el potasio, de metales alcalinotérreos, preferiblemente el calcio, el magnesio y el bario, y de los metales de transición, preferiblemente el manganeso, el cobre, el zinc y el hierro, y también el ion de amonio, que puede, si se lo desea, portar de uno a cuatro sustituyentes de alquilo- C_1-C_4 , y/o un sustituyente de fenilo o uno de bencilo, preferiblemente diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutylamonio, trimetilbencilamonio, y además iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente, tri(alquil- C_1-C_4)sulfonio, e iones sulfoxonio, preferiblemente, tri(alquil- C_1-C_4)sulfoxonio.

Primariamente, son aniones de sales por adición de ácido útiles el cloruro, bromuro, fluoruro, hidrógenosulfato, sulfato, dihidrógenofosfato, hidrógenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanoicos- C_1-C_4 , preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Puede formárselos haciendo reaccionar los compuestos de las fórmulas 1a y 1b con un ácido del correspondiente anión, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico.

Las porciones orgánicas mencionadas en las definiciones antedichas de las variables son – como el término halógeno – términos colectivos para los listados de los miembros individuales del grupo. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el posible número de átomos de carbono en el grupo.

El término halógeno denota en cada caso flúor, bromo, cloro o iodo.

Ejemplos de otros significados son:

El término "alquilo- C_1-C_4 ", tal como se lo usa aquí, y las porciones de alquilo

del alquilamino y dialquilamino se refieren a un radical de hidrocarburo saturado, de cadena recta o ramificado, que tiene 1 a 4 átomos de carbono, es decir, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

El término "alquilo-C₁-C₆", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical de hidrocarburo saturado, de cadena recta o ramificado, que tiene 1 a 6 átomos de carbono, es decir, por ejemplo, uno de los radicales mencionados bajo alquilo-C₁-C₄, y también n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo.

El término "haloalquilo-C₁-C₄", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alquilo saturado, de cadena recta o ramificado, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (tal como se lo señala *supra*), en el que algunos de los átomos de hidrógeno en esos radicales, o todos ellos, pueden estar reemplazados por flúor, cloro, bromo y/o yodo, es decir por ejemplo clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2-bromoetilo, 2-iodoetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 2,3-difluoropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-tricloropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, heptafluoropropilo, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo, 1-(clorometil)-2-cloroetilo, 1-(bromometil)-2-bromoetilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-bromobutilo o nonafluorobutilo.

El término "fluoroalquilo-C₁-C₂", tal como se lo usa aquí, se refiere a un

radical alquilo-C₁-C₂, que porta 1, 2, 3, 4 ó 5 átomos de flúor, por ejemplo difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo.

El término "alcoxi-C₁-C₄", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alquilo saturado, de cadena recta o ramificado, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (tal como se señala *supra*), que está unido por medio de un átomo de oxígeno, es decir por ejemplo metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, n-butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi ó 1,1-dimetiletoxi.

El término "haloalcoxi-C₁-C₄", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alcoxi-C₁-C₄, tal como se lo menciona *supra*, que está parcial o totalmente sustituido por flúor, cloro, bromo y/o yodo, es decir por ejemplo clorometoxi, diclorometoxi, ticlorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-iodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxi, heptafluoropropoxi, 1-(fluorometil)-2-fluoroetoxi, 1-(clorometil)-2-cloroetoxi, 1-(bromometil)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi.

El término "alquil-C₁-C₄-tio" (alquil-C₁-C₄-sulfanilo, alquilo-C₁-C₄-S), tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alquilo saturado, de cadena recta o ramificado, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (tal como se lo menciona *supra*), que está unido por medio de un átomo de azufre, es decir por ejemplo metilitio, etiltio, n-propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio ó 1,1-dimetileiltio.

El término "alquil-C₁-C₄-sulfinilo (alquilo-C₁-C₄-S(=O)-), tal como se lo usa

aquí, se refiere a un radical hidrocarburo saturado, de cadena recta o ramificado, (tal como se lo menciona *supra*) que tiene de 1 a 4 átomos de carbono ligados por medio del átomo de azufre del grupo sulfinilo a cualquier enlace en el radical alquilo, es decir por ejemplo SO-CH_3 , $\text{SO-C}_2\text{H}_5$, n-propilsulfinilo, 1-metiletilsulfinilo, n-butilsulfinilo, 1-metilpropilsulfinilo, 2-metilpropilsulfinilo, 1,1-dimetiletilsulfinilo, n-pentilsulfinilo, 1-metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-dimetilpropilsulfinilo, 2,2-dimetilpropilsulfinilo o 1-etilpropilsulfinilo.

El término "alquil- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -sulfonilo" (alquil- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-S(=O)}_2$), tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (tal como se lo menciona *supra*), que está ligado por medio del átomo de azufre del grupo sulfonilo a cualquier enlace en el radical alquilo, es decir por ejemplo $\text{SO}_2\text{-CH}_3$, $\text{SO}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, n-propilsulfonilo, $\text{SO}_2\text{-CH(CH}_3)_2$, n-butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo o $\text{SO}_2\text{-C(CH}_3)_3$.

El término "haloalquil- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -tio", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alquil- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -tio, tal como se lo menciona *supra*, que está parcial o totalmente sustituido por flúor, cloro, bromo y/o yodo, es decir por ejemplo fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorodifluorometiltio, bromodifluorometiltio, 2-fluoroetiltio, 2-cloroetiltio, 2-bromoetiltio, 2-iodoetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, pentafluoroetiltio, 2-fluoropropiltio, 3-fluoropropiltio, 2-cloropropiltio, 3-cloropropiltio, 2-bromopropiltio, 3-bromopropiltio, 2,2-difluoropropiltio, 2,3-difluoropropiltio, 2,3-dicloropropiltio, 3,3,3-trifluoropropiltio, 3,3,3-tricloropropiltio, 2,2,3,3,3-pentafluoropropiltio, heptafluoropropiltio, 1-(fluorometil)-2-fluoroetiltio, 1-(clorometil)-2-cloroetiltio, 1-(bromometil)-2-bromoetiltio, 4-fluorobutiltio, 4-clorobutiltio, 4-bromobutiltio o nonafluorobutiltio.

El término "alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -carbonilo", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical alcoxi de cadena recta o ramificado (tal como se lo menciona *supra*), que

85-

tiene de 1 a 4 átomos de carbono unidos por medio del átomo de carbono del grupo carbonilo, es decir por ejemplo metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, 1-metiletoxycarbonilo, n-butoxycarbonilo, 1-metilpropoxycarbonilo, 2-metilpropoxycarbonilo ó 1,1-dimetiletoxycarbonilo.

El término "(alquil-C₁-C₄-amino)carbonilo", tal como se lo usa aquí, se refiere, por ejemplo, a metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, propilaminocarbonilo, 1-metiletilaminocarbonilo, butilaminocarbonilo, 1-metilpropilaminocarbonilo, 2-metilpropilaminocarbonilo ó 1,1-dimetiletilaminocarbonilo.

El término "di(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo, tal como se lo usa aquí, se refiere, por ejemplo, a N,N-dimetilaminocarbonilo, N,N-diethylaminocarbonilo, N,N-di-(1-metiletil)aminocarbonilo, N,N-dipropilaminocarbonilo, N,N-dibutilaminocarbonilo, N,N-di-(1-metilpropil)aminocarbonilo, N,N-di-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N,N-di-(1,1-dimetiletil)aminocarbonilo, N-etil-N-metilaminocarbonilo, N-metil-N-propilaminocarbonilo, N-metil-N-(1-metiletil)aminocarbonilo, N-butil-N-metilaminocarbonilo, N-metil-N-(1-metilpropil)aminocarbonilo, N-metil-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N-(1,1-dimetiletil)-N-metilaminocarbonilo, N-etil-N-propilaminocarbonilo, N-etil-N-(1-metiletil)aminocarbonilo, N-butil-N-etilaminocarbonilo, N-etil-N-(1-metilpropil)aminocarbonilo, N-etil-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N-etil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonilo, N-(1-metiletil)-N-propilaminocarbonilo, N-butil-N-propilaminocarbonilo, N-(1-metilpropil)-N-propilaminocarbonilo, N-(2-metilpropil)-N-propilaminocarbonilo, N-(1,1-dimetiletil)-N-propilaminocarbonilo, N-butil-N-(1-metiletil)aminocarbonilo, N-(1-metiletil)-N-(1-metilpropil)aminocarbonilo, N-(1-metiletil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-metiletil)aminocarbonilo, N-butil-N-(1-metilpropil)aminocarbonilo, N-butil-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N-butil-N-(1,1-dimetiletil)aminocarbonilo, N-(1-metilpropil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo, N-(1,1-dimetiletil)-N-(1-

metilpropil)aminocarbonilo, o N- (1,1-dimetiletil)-N-(2-metilpropil)aminocarbonilo.

El término "alquenilo-C₂-C₆", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical hidrocarburo de cadena recta o ramificado, monoinsaturado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición, o sea por ejemplo etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1 propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

El término "alquinilo-C₂-C₆", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical hidrocarburo de cadena recta o ramificado, alifático, que contiene un triple enlace C-C y tiene de 2 a 6 átomos de carbono; por ejemplo etinilo, prop-1-in-1-ilo, prop-2-in-1-ilo, n-but-1-in-1-ilo, n-but-2-in-3-ilo, n-but-1-in-4-ilo, n-but-2-in-1-ilo, n-pent-1-in-1-ilo, n-pent-1-in-3-ilo, n-pent-1-in-4-ilo, n-pent-1-in-5-ilo, n-pent-2-in-1-ilo, n-pent-2-in-4-ilo, n-pent-2-in-5-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 3-metilbut-1-in-4-ilo, n-hex-1-

in-1-ilo, n-hex-1-in-3-ilo, n-hex-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-5-ilo, n-hex-1-in-6-ilo, n-hex-2-in-1-ilo, n-hex-2-in-4-ilo, n-hex-2-in-5-ilo, n-hex-2-in-6-ilo, n-hex-3-in-1-ilo, n-hex-3-in-2-ilo, 3-metilpent-1-in-1-ilo, 3-metilpent-1-in-3-ilo, 3-metilpent-1-in-4-ilo, 3-metilpent-1-in-5-ilo, 4-metilpent-1-in-1-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo, ó 4-metilpent-2-in-5-ilo, y similares.

El término "cicloalquilo-C₃-C₈", tal como se lo usa aquí, se refiere a un radical hidrocarburo monocíclico que tiene de 3 a 8 átomos de carbono, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo.

Entre los compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I, se da preferencia a aquellos en los cuales las variables R¹ y R² tienen, independientemente la una de la otra, pero particularmente en combinación, los significados que se indican en lo que sigue:

R¹ es alquilo-C₁-C₂, especialmente metilo, o alcoxi-C₁-C₂, especialmente metoxi;

R² es hidrógeno o un radical hidrocarburo lineal, cíclico o de cadena ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, alquilo-C₁-C₄, en particular metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, ciclopropilo, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, en particular 2-metoxietilo, alquil-C₁-C₄-tio-alquilo-C₁-C₄, en particular 2-metiltioetilo o alquinilo-C₂-C₄, en particular prop-2-in-1-il(propargilo). Los más preferidos son los compuestos I en los cuales R² es seleccionado de entre metilo, etilo, 1-metiletilo y prop-2-in-1-ilo.

Se da preferencia también a compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I, en los que R¹ es haloalcoxi-C₁-C₄, en particular haloalcoxi-C₁, especialmente trifluorometoxi, difluorometoxi o clorodifluorometoxi. En esos compuestos, R² tiene los significados arriba indicados, preferiblemente hidrógeno o un radical hidrocarburo lineal, cíclico o de cadena ramificada, que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo alquilo-C₁-C₄, en particular metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, ciclopropilo, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, en particular 2-metoxietilo,

alquil-C₁-C₄-tioalquilo-C₁-C₄, en particular 2-metiltioetilo o alquinilo-C₂-C₄, en particular prop-2-in-1-ilo (propargilo). Los más preferidos son los compuestos I en los cuales R² está seleccionado de entre metilo, etilo, 1-metiletilo y prop-2-in-1-ilo.

Una realización preferida de la presente invención se refiere a compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I, en los cuales R¹ y R² tienen los significados anteriormente mencionados y en particular los significados dados como preferidos y en los cuales por lo menos uno de los radicales R³, R⁴ y R⁵ es diferente de hidrógeno. Preferentemente, uno o dos de los radicales R³, R⁴ y R⁵ representan hidrógeno. Entre estos compuestos, se da preferencia a aquellos en los cuales R³ es distinto de hidrógeno y representa preferiblemente halógeno, especialmente cloro o flúor, y los otros radicales, R⁴ y R⁵, son hidrógeno.

Otra realización preferida de la presente invención se refiere a compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I en los cuales las variables R¹ y R² tienen los significados mencionados anteriormente y en particular los significados que se dan como preferidos, y en los que cada uno de los radicales R³, R⁴ y R⁵ representa hidrógeno.

Ejemplos de compuestos preferidos de la fórmula I de la presente invención comprenden aquellos compuestos que están dados en las siguientes tablas A1 a A16, en las que R³, R⁴, R⁵ son tales como están definidas en las tablas y en las cuales R¹ y R² están dados en las filas de la Tabla A:

Tabla A1: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R³, R⁴ y R⁵ son, cada una, hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A2: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R³ es cloro, R⁴ y R⁵ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A3: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R³ es flúor, R⁴ y R⁵ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la

Tabla A

- Tabla A4:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^3 es bromo, R^4 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A5:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^3 es yodo, R^4 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A6:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^3 es CH_3 , R^4 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A7:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^4 es cloro, R^3 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A8:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^4 es flúor, R^3 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A9:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^4 es bromo, R^3 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A10:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^4 es yodo, R^3 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A11:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^4 es CH_3 , R^3 y R^5 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A
- Tabla A12:** Compuestos de la fórmula I, en los cuales R^5 es cloro, R^3 y R^4 son hidrógeno, y R^1 y R^2 son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

90

Tabla A13: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R⁵ es flúor, R³ y R⁴ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A14: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R⁵ es bromo, R³ y R⁴ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A15: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R⁵ es yodo, R³ y R⁴ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A16: Compuestos de la fórmula I, en los cuales R⁵ es CH₃, R³ y R⁴ son hidrógeno, y R¹ y R² son tal como están definidos en una fila de la Tabla A

Tabla A:

	R ¹	R ²
1.	CH ₃	H
2.	CH ₃	CH ₃
3.	CH ₃	CH ₃ CH ₂ -
4.	CH ₃	(CH ₃) ₃ CH-
5.	CH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
6.	CH ₃	n-C ₄ H ₉
7.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-
8.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
9.	CH ₃	n-C ₅ H ₁₁
10.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
11.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
12.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
13.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
14.	CH ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
15.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
16.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
17.	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
18.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
19.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
20.	CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
21.	CH ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
22.	CH ₃	Ciclopropilo
23.	CH ₃	ciclopropilo-CH ₂ -
24.	CH ₃	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
25.	CH ₃	Ciclobutilo

	R ¹	R ²
26.	CH ₃	Ciclopentilo
27.	CH ₃	Ciclohexilo
28.	CH ₃	HC≡C-CH ₂ -
29.	CH ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
30.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
31.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
32.	CH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
33.	CH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
34.	CH ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
35.	CH ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
36.	CH ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
37.	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
38.	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ -C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
39.	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
40.	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ -C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
41.	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
42.	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
43.	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
44.	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
45.	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
46.	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
47.	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
48.	CH ₃	NC-CH ₂ -
49.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
50.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
51.	CH ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
52.	CH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
53.	CH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
54.	CH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
55.	CH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
56.	CH ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
57.	CH ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
58.	CH ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
59.	CH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
60.	CH ₃	F ₃ C-CH ₂ -
61.	CH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
62.	CH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
63.	CH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
64.	CH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
65.	CH ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
66.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
67.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
68.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
69.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
70.	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
71.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
72.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
73.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
74.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
75.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
76.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-

107
92

	R ¹	R ²
77.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
78.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
79.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
80.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
81.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
82.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
83.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
84.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
85.	CH ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
86.	CH ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
87.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
88.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
89.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
90.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
91.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
92.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
93.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
94.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
95.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
96.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
97.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
98.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
99.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
100.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
101.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
102.	CH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
103.	CH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
104.	CH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
105.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
106.	CH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
107.	CH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
108.	CH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
109.	CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
110.	CH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
111.	CH ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
112.	CH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
113.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
114.	CH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
115.	CH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃) ₂ -
116.	CH ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
117.	CH ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
118.	CH ₃	H
119.	C ₂ H ₅	CH ₃
120.	C ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ -
121.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-
122.	C ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
123.	C ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
124.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-
125.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
126.	C ₂ H ₅	n-C ₅ H ₁₁
127.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
128.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
129.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
130.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
131.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
132.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
133.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
134.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₃ C
135.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
136.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
137.	C ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
138.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
139.	C ₂ H ₅	ciclopropilo
140.	C ₂ H ₅	ciclopropilo-CH ₂ -
141.	C ₂ H ₅	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
142.	C ₂ H ₅	ciclobutilo
143.	C ₂ H ₅	ciclopentilo
144.	C ₂ H ₅	ciclohexilo
145.	C ₂ H ₅	HC≡C-CH ₂ -
146.	C ₂ H ₅	HC≡C-CH(CH ₃)-
147.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
148.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
149.	C ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
150.	C ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂ -
151.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
152.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
153.	C ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
154.	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
155.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
156.	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
157.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
158.	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
159.	C ₂ H ₅	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
160.	C ₂ H ₅	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
161.	C ₂ H ₅	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
162.	C ₂ H ₅	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
163.	C ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
164.	C ₂ H ₅	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
165.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -
166.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -
167.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
168.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
169.	C ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
170.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -
171.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -
172.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -
173.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
174.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
175.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
176.	C ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -
177.	C ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -
178.	C ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -

94

	R ¹	R ²
179.	C ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
180.	C ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
181.	C ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
182.	C ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
183.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
184.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
185.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
186.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
187.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
188.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
189.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
190.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
191.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
192.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
193.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
194.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
195.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
196.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
197.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
198.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
199.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
200.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
201.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
202.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
203.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
204.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
205.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
206.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
207.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
208.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
209.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
210.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
211.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
212.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
213.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
214.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
215.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
216.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
217.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
218.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
219.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
220.	C ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
221.	C ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
222.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
223.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
224.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
225.	C ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
226.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
227.	C ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
228.	C ₂ H ₅	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
229.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₃ -O-C(O)-CH ₂

~~95~~
95

	R ¹	R ²
230.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂
231.	C ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
232.	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
233.	C ₂ H ₅	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
234.	C ₂ H ₅	(C ₂ H ₅ O) ₂ -CH-CH ₂ -
235.	OCH ₃	H
236.	OCH ₃	CH ₃
237.	OCH ₃	CH ₃ CH ₂ -
238.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-
239.	OCH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
240.	OCH ₃	n-C ₄ H ₉
241.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-
242.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
243.	OCH ₃	n-C ₅ H ₁₁
244.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
245.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
246.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
247.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
248.	OCH ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
249.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
250.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
251.	OCH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
252.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
253.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
254.	OCH ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
255.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
256.	OCH ₃	Ciclopropilo
257.	OCH ₃	ciclopropilo-CH ₂ -
258.	OCH ₃	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
259.	OCH ₃	Ciclobutilo
260.	OCH ₃	Ciclopentilo
261.	OCH ₃	Ciclohexilo
262.	OCH ₃	HC≡C-CH ₂ -
263.	OCH ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
264.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
265.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
266.	OCH ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
267.	OCH ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
268.	OCH ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
269.	OCH ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
270.	OCH ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
271.	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
272.	OCH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
273.	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
274.	OCH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
275.	OCH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
276.	OCH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
277.	OCH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
278.	OCH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
279.	OCH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
280.	OCH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
281.	OCH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
282.	OCH ₃	NC-CH ₂ -
283.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
284.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
285.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -
286.	OCH ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
287.	OCH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
288.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
289.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
290.	OCH ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
291.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
292.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
293.	OCH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
294.	OCH ₃	F ₃ C-CH ₂ -
295.	OCH ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
296.	OCH ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
297.	OCH ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
298.	OCH ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
299.	OCH ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
300.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
301.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
302.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
303.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
304.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
305.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
306.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
307.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
308.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
309.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
310.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
311.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
312.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
313.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
314.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
315.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
316.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
317.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
318.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
319.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
320.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
321.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
322.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
323.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
324.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
325.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
326.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
327.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
328.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
329.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
330.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
331.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -

9x

	R ¹	R ²
332.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
333.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
334.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
335.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
336.	OCH ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
337.	OCH ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
338.	OCH ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
339.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
340.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
341.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
342.	OCH ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
343.	OCH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
344.	OCH ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
345.	OCH ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
346.	OCH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂
347.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂
348.	OCH ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
349.	OCH ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
350.	OCH ₃	(CH ₃ O) ₂ -CH-CH ₂
351.	OCH ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ -CH-CH ₂
352.	OC ₂ H ₅	H
353.	OC ₂ H ₅	CH ₃
354.	OC ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ -
355.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-
356.	OC ₂ H ₅	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
357.	OC ₂ H ₅	n-C ₄ H ₉
358.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-
359.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
360.	OC ₂ H ₅	n-C ₅ H ₁₁
361.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
362.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
363.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
364.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
365.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
366.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
367.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
368.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
369.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
370.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
371.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
372.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
373.	OC ₂ H ₅	Ciclopropilo
374.	OC ₂ H ₅	ciclopropilo-CH ₂ -
375.	OC ₂ H ₅	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
376.	OC ₂ H ₅	Ciclobutilo
377.	OC ₂ H ₅	Ciclopentilo
378.	OC ₂ H ₅	Ciclohexilo
379.	OC ₂ H ₅	HC≡C-CH ₂ -
380.	OC ₂ H ₅	HC≡C-CH(CH ₃)-
381.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
382.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-

	R ¹	R ²
383.	OC ₂ H ₅	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
384.	OC ₂ H ₅	CH ₂ =CH-CH ₂ -
385.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
386.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
387.	OC ₂ H ₅	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
388.	OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
389.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
390.	OC ₂ H ₅	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
391.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
392.	OC ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
393.	OC ₂ H ₅	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
394.	OC ₂ H ₅	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
395.	OC ₂ H ₅	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
396.	OC ₂ H ₅	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
397.	OC ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
398.	OC ₂ H ₅	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
399.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -
400.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -
401.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
402.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
403.	OC ₂ H ₅	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
404.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -
405.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -
406.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -
407.	OC ₂ H ₅	FH ₂ CH(CH ₃) -
408.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH(CH ₃) -
409.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH(CH ₃) -
410.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -
411.	OC ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -
412.	OC ₂ H ₅	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
413.	OC ₂ H ₅	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
414.	OC ₂ H ₅	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
415.	OC ₂ H ₅	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
416.	OC ₂ H ₅	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
417.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
418.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
419.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
420.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
421.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ -CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
422.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
423.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
424.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
425.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
426.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
427.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃) -
428.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃) -
429.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) -
430.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
431.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
432.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
433.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-

	R ¹	R ²
434.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
435.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
436.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
437.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
438.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
439.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
440.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
441.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
442.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
443.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
444.	OC ₂ H ₅	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
445.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
446.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
447.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
448.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
449.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
450.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
451.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
452.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
453.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
454.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
455.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
456.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
457.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
458.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
459.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
460.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
461.	OC ₂ H ₅	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
462.	OC ₂ H ₅	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
463.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂
464.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂
465.	OC ₂ H ₅	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
466.	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
467.	OC ₂ H ₅	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
468.	OC ₂ H ₅	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
469.	CF ₃	H
470.	CF ₃	CH ₃
471.	CF ₃	CH ₃ CH ₂ -
472.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-
473.	CF ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
474.	CF ₃	n-C ₄ H ₉
475.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-
476.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
477.	CF ₃	n-C ₅ H ₁₁
478.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
479.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
480.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
481.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
482.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ CH(CH ₃)-CH ₂ -
483.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
484.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-

~~100~~
100

	R ¹	R ²
485.	CF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
486.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
487.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
488.	CF ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
489.	CF ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
490.	CF ₃	ciclopropilo
491.	CF ₃	Ciclopropilo-CH ₂ -
492.	CF ₃	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
493.	CF ₃	Ciclobutilo
494.	CF ₃	Ciclopentilo
495.	CF ₃	Ciclohexilo
496.	CF ₃	HC≡C-CH ₂ -
497.	CF ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
498.	CF ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
499.	CF ₃	HC≡C-C(-CH ₃)(C ₂ H ₅)-
500.	CF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
501.	CF ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
502.	CF ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
503.	CF ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
504.	CF ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
505.	CF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
506.	CF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
507.	CF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
508.	CF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
509.	CF ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
510.	CF ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
511.	CF ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
512.	CF ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
513.	CF ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
514.	CF ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
515.	CF ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
516.	CF ₃	NC-CH ₂ -
517.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
518.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
519.	CF ₃	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
520.	CF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
521.	CF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
522.	CF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
523.	CF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
524.	CF ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
525.	CF ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
526.	CF ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
527.	CF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
528.	CF ₃	F ₃ C-CH ₂ -
529.	CF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
530.	CF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
531.	CF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
532.	CF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
533.	CF ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
534.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
535.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -

101

	R ¹	R ²
536.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
537.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
538.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
539.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
540.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
541.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-S-CH ₂ -CH ₂ -
542.	CF ₃	(CH ₃) ₂ CH-SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
543.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
544.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
545.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
546.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
547.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
548.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
549.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
550.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
551.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
552.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
553.	CF ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
554.	CF ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
555.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
556.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
557.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
558.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
559.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
560.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
561.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
562.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
563.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
564.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
565.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
566.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
567.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
568.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
569.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
570.	CF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
571.	CF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
572.	CF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
573.	CF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
574.	CF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
575.	CF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
576.	CF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
577.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
578.	CF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
579.	CF ₃	Cl-CH ₂ -≡C-CH ₂ -
580.	CF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
581.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
582.	CF ₃	CH ₃ -O-C(O)-C(CH ₃)-
583.	CF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
584.	CF ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
585.	CF ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
586.	OCHF ₂	H

	R ¹	R ²
587.	OCHF ₂	CH ₃
588.	OCHF ₂	CH ₃ CH ₂ -
589.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-
590.	OCHF ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
591.	OCHF ₂	n-C ₄ H ₉
592.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-
593.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
594.	OCHF ₂	n-C ₅ H ₁₁
595.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
596.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
597.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ -C-CH ₂ -
598.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
599.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
600.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
601.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
602.	OCHF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
603.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
604.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
605.	OCHF ₂	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(C ₂ H ₅) ₂ -
606.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
607.	OCHF ₂	Ciclopropilo
608.	OCHF ₂	ciclopropilo-CH ₂ -
609.	OCHF ₂	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
610.	OCHF ₂	Ciclobutilo
611.	OCHF ₂	Ciclopentilo
612.	OCHF ₂	Ciclohexilo
613.	OCHF ₂	HC≡C-CH ₂ -
614.	OCHF ₂	HC≡C-CH(CH ₃)-
615.	OCHF ₂	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
616.	OCHF ₂	HC≡C-CH(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
617.	OCHF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
618.	OCHF ₂	CH ₂ =CH-CH ₂ -
619.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
620.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
621.	OCHF ₂	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
622.	OCHF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
623.	OCHF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
624.	OCHF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
625.	OCHF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
626.	OCHF ₂	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
627.	OCHF ₂	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
628.	OCHF ₂	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
629.	OCHF ₂	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
630.	OCHF ₂	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
631.	OCHF ₂	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
632.	OCHF ₂	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
633.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -
634.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -
635.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -
636.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
637.	OCHF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
638.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -
639.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -
640.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -
641.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
642.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
643.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
644.	OCHF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -
645.	OCHF ₂	F ₃ C-CH ₂ -
646.	OCHF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
647.	OCHF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
648.	OCHF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
649.	OCHF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
650.	OCHF ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
651.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
652.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
653.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
654.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
655.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
656.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
657.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
658.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
659.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
660.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
661.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
662.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
663.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
664.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
665.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
666.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
667.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
668.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
669.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
670.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
671.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
672.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
673.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
674.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
675.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
676.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
677.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
678.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
679.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
680.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
681.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
682.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
683.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
684.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
685.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
686.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
687.	OCHF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
688.	OCHF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -

104

	R ¹	R ²
689.	OCHF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
690.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
691.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
692.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
693.	OCHF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
694.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
695.	OCHF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
696.	OCHF ₂	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
697.	OCHF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
698.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
699.	OCHF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
700.	OCHF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
701.	OCHF ₂	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
702.	OCHF ₂	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
703.	OCF ₃	H
704.	OCF ₃	CH ₃
705.	OCF ₃	CH ₃ CH ₂ -
706.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-
707.	OCF ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
708.	OCF ₃	n-C ₄ H ₉
709.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-
710.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -
711.	OCF ₃	n-C ₅ H ₁₁
712.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
713.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ -CH-
714.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-C-CH ₂ -
715.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
716.	OCF ₃	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
717.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
718.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
719.	OCF ₃	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
720.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
721.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
722.	OCF ₃	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
723.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
724.	OCF ₃	ciclopropilo
725.	OCF ₃	ciclopropilo-CH ₂ -
726.	OCF ₃	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
727.	OCF ₃	ciclobutilo
728.	OCF ₃	ciclopentilo
729.	OCF ₃	ciclohexilo
730.	OCF ₃	HC≡C-CH ₂ -
731.	OCF ₃	HC≡C-CH(CH ₃)-
732.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
733.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
734.	OCF ₃	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
735.	OCF ₃	CH ₂ =CH-CH ₂ -
736.	OCF ₃	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
737.	OCF ₃	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
738.	OCF ₃	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
739.	OCF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -

230
25

	R ¹	R ²
740.	OCF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
741.	OCF ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
742.	OCF ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
743.	OCF ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
744.	OCF ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
745.	OCF ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
746.	OCF ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
747.	OCF ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
748.	OCF ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
749.	OCF ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
750.	OCF ₃	NC-CH ₂ -
751.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -
752.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
753.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂ -
754.	OCF ₃	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
755.	OCF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -
756.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -
757.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -
758.	OCF ₃	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
759.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
760.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
761.	OCF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -
762.	OCF ₃	F ₃ C-CH ₂ -
763.	OCF ₃	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
764.	OCF ₃	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
765.	OCF ₃	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
766.	OCF ₃	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
767.	OCF ₃	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
768.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
769.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
770.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
771.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
772.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ CH-O-CH ₂ -CH ₂ -
773.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
774.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
775.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
776.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
777.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
778.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
779.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
780.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
781.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
782.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
783.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
784.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
785.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
786.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
787.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
788.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
789.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
790.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -

~~148~~
~~148~~
106

	R ¹	R ²
791.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
792.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
793.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
794.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
795.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
796.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
797.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
798.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
799.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
800.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
801.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
802.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
803.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
804.	OCF ₃	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
805.	OCF ₃	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
806.	OCF ₃	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
807.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
808.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
809.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
810.	OCF ₃	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
811.	OCF ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
812.	OCF ₃	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
813.	OCF ₃	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
814.	OCF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
815.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
816.	OCF ₃	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
817.	OCF ₃	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
818.	OCF ₃	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
819.	OCF ₃	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -
820.	OCCIF ₂	H
821.	OCCIF ₂	CH ₃
822.	OCCIF ₂	CH ₃ CH ₂ -
823.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ CH-
824.	OCCIF ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ -
825.	OCCIF ₂	n-C ₄ H ₉
826.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ C-
827.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ CH-CH ₂ -
828.	OCCIF ₂	n-C ₅ H ₁₁
829.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ CH-CH ₂ -CH ₂ -
830.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ CH-
831.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -
832.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
833.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ CH(CH ₃)-CH ₂ -
834.	OCCIF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
835.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH(CH ₃)-
836.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₃ C-CH(CH ₃)-
837.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH(CH ₃)-
838.	OCCIF ₂	CH ₃ -CH ₂ -C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
839.	OCCIF ₂	CH ₃ -CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
840.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
841.	OCCIF ₂	ciclopropilo

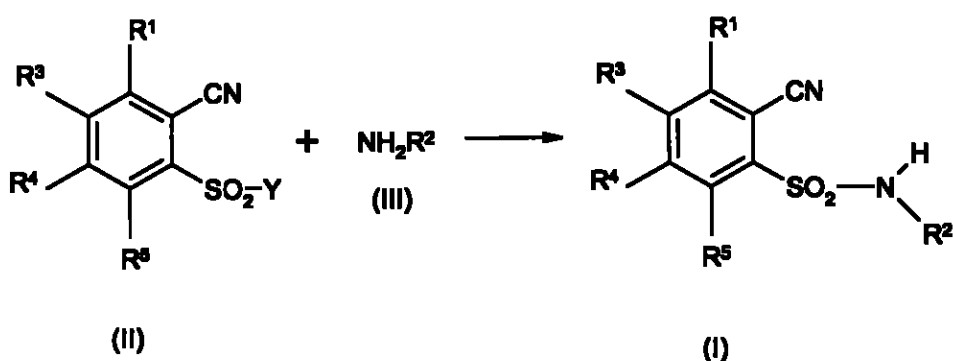
	R ¹	R ²
842.	OCCIF ₂	ciclopropilo-CH ₂ -
843.	OCCIF ₂	ciclopropilo-CH(CH ₃)-
844.	OCCIF ₂	ciclobutilo
845.	OCCIF ₂	ciclopentilo
846.	OCCIF ₂	ciclohexilo
847.	OCCIF ₂	HC≡C-CH ₂ -
848.	OCCIF ₂	HC≡C-CH(CH ₃)-
849.	OCCIF ₂	HC≡C-C(CH ₃) ₂ -
850.	OCCIF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-
851.	OCCIF ₂	HC≡C-C(CH ₃)(C ₃ H ₇)-
852.	OCCIF ₂	CH ₂ =CH-CH ₂ -
853.	OCCIF ₂	H ₂ C=CH-CH(CH ₃)-
854.	OCCIF ₂	H ₂ C=CH-C(CH ₃) ₂ -
855.	OCCIF ₂	H ₂ C=CH-C(C ₂ H ₅)(CH ₃)-
856.	OCCIF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
857.	OCCIF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
858.	OCCIF ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -
859.	OCCIF ₂	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
860.	OCCIF ₂	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
861.	OCCIF ₂	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
862.	OCCIF ₂	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
863.	OCCIF ₂	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
864.	OCCIF ₂	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
865.	OCCIF ₂	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
866.	OCCIF ₂	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
867.	OCCIF ₂	NC-CH ₂ -
868.	OCCIF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -
869.	OCCIF ₂	NC-CH ₂ -CH(CH ₃)-
870.	OCCIF ₂	NC-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
871.	OCCIF ₂	NC-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
872.	OCCIF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -
873.	OCCIF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -
874.	OCCIF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -
875.	OCCIF ₂	FH ₂ C-CH(CH ₃)-
876.	OCCIF ₂	ClH ₂ C-CH(CH ₃)-
877.	OCCIF ₂	BrH ₂ C-CH(CH ₃)-
878.	OCCIF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -
879.	OCCIF ₂	F ₃ C-CH ₂ -
880.	OCCIF ₂	FH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
881.	OCCIF ₂	ClH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
882.	OCCIF ₂	BrH ₂ C-CH ₂ -CH ₂ -
883.	OCCIF ₂	F ₂ HC-CH ₂ -CH ₂ -
884.	OCCIF ₂	F ₃ C-CH ₂ -CH ₂ -
885.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -
886.	OCCIF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -
887.	OCCIF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
888.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -
889.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ -CH ₂ -
890.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -
891.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
892.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -

	R ¹	R ²
893.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
894.	OCCIF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -
895.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
896.	OCCIF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
897.	OCCIF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
898.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH(CH ₃)-
899.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH(CH ₃)-
900.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-
901.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
902.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
903.	OCCIF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -CH(CH ₃)-
904.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
905.	OCCIF ₂	CH ₃ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
906.	OCCIF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
907.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH(CH ₃)-CH ₂ -
908.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH(CH ₃)-CH ₂ -
909.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -
910.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
911.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
912.	OCCIF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH(CH ₃)-CH ₂ -
913.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
914.	OCCIF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
915.	OCCIF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
916.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
917.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
918.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
919.	OCCIF ₂	(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
920.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -
921.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
922.	OCCIF ₂	CH ₃ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
923.	OCCIF ₂	CH ₃ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
924.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
925.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -S-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
926.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -SO ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
927.	OCCIF ₂	[(CH ₃) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
928.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅) ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
929.	OCCIF ₂	[(CH ₃) ₂ CH] ₂ N-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -
930.	OCCIF ₂	Cl-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -
931.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH ₂ -
932.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH ₂ -
933.	OCCIF ₂	CH ₃ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
934.	OCCIF ₂	C ₂ H ₅ -O-C(O)-CH(CH ₃)-
935.	OCCIF ₂	(CH ₃ O) ₂ CH-CH ₂ -
936.	OCCIF ₂	(C ₂ H ₅ O) ₂ CH-CH ₂ -

Los compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula I pueden ser preparados, por ejemplo, haciendo reaccionar un haluro de 2-cianobencenosulfonilo II con amoníaco o con una amina primaria (III), de manera

similar al procedimiento descrito en J. March, 4ª edición 1992, pág. 499 (véase Esquema 1):

Esquema 1:



En el Esquema 1, las variables R¹ a R⁵ son como se las ha definido anteriormente e Y es halógeno, especialmente cloro o bromo. La reacción de un haluro de sulfonilo II, especialmente un cloruro de sulfonilo, con una amina III, se lleva a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. Son disolventes apropiados los disolventes polares que son inertes bajo las condiciones de reacción, por ejemplo alcanos-C₁-C₄, tales como el metanol, etanol, n-propanol o isopropanol, éteres dialquílicos tales como el éter dietílico, éter diisopropílico o éter metil-ter-butílico, éteres cíclicos tales como el dioxano o el tetrahidrofurano, acetonitrilo, las carboxamidas tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida o la N-metilpirrolidinona, el agua (siempre que el haluro de sulfonilo II sea lo suficientemente resistente a la hidrólisis en las condiciones de reacción que se usen) o una mezcla de éstos.

En general, la amina III se emplea en una cantidad que sea por lo menos equimolar, preferiblemente en un exceso molar de por lo menos el doble, basado en el haluro de sulfonilo II, con el fin de ligar el haluro de hidrógeno que se ha formado. Podría ser ventajoso emplear la amina primaria III con un exceso molar que llegue a ser hasta de seis veces, basado en el haluro de sulfonilo II.

Podría ser ventajoso llevar a efecto la reacción en presencia de una base

~~21/10~~
110

auxiliar. Las bases auxiliares apropiadas incluyen bases orgánicas, por ejemplo aminas terciarias, tales como las aminas terciarias alifáticas, tales como la trimetilamina, la trietilamina o la diisopropilamina, aminas terciarias cicloalifáticas tales como la N-metilpiperidina o aminas aromáticas tales como la piridina, piridinas sustituidas tales como la 2,3,5-colidina, la 2,4,6-colidina, la 2,4-lutidina, la 3,5-lutidina o la 2,6-lutidina, y bases inorgánicas, como por ejemplo los carbonatos de metales alcalinos y los carbonatos de metales alcalinotérreos tales como el carbonato de litio, el carbonato de potasio y el carbonato de sodio, el carbonato de calcio y los bicarbonatos de metales alcalinos como el bicarbonato de sodio. La relación molar de la base auxiliar respecto al haluro de sulfonilo II está preferiblemente dentro de un intervalo que va de 1:1 a 4:1, preferiblemente de 1:1 a 2:1. Si la reacción se lleva a cabo en presencia de una base auxiliar, la relación molar de la amina primaria III respecto al haluro de sulfonilo II es habitualmente de 1:1 a 1,5:1.

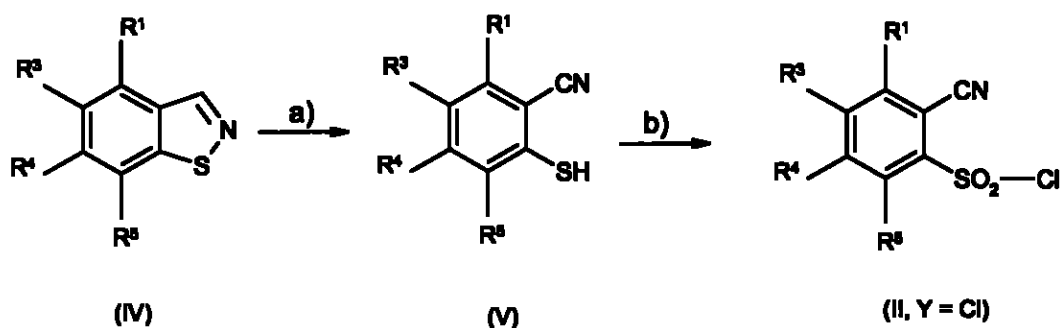
La reacción es llevada a cabo habitualmente a una temperatura de reacción que va de los 0° C hasta el punto de ebullición del disolvente, preferiblemente de 0 a 30° C.

En caso de no poder obtenerse en el comercio, los compuestos de haluros de sulfonilo II pueden ser preparados, por ejemplo, mediante alguno de los procedimientos que se describen a continuación.

La preparación del compuesto de cloruro de sulfonilo II puede realizarse, por ejemplo, de acuerdo con la secuencia de reacción que se muestra en el Esquema 2, donde las variables R¹, R³ a R⁵ son tales como se las define *supra*:

~~723~~
///

Esquema 2:



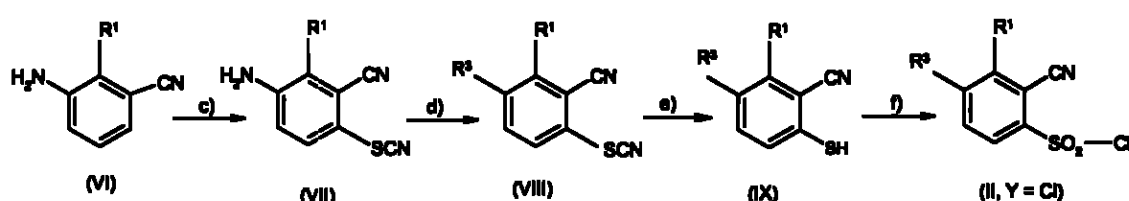
- a) conversión de un benzisotiazol IV en un tiol V, por ejemplo, análogamente al procedimiento descrito en Liebigs Ann. Chem. 1980, 768-778, haciendo reaccionar IV con una base tal como un hidróxido de metal alcalino y un hidróxido un metal alcalinotérreo tales como el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio y el hidróxido de calcio, un hidruro de metal alcalino tal como el hidruro de sodio o el hidruro de potasio o un alcóxido tal como el metóxido de sodio, el etóxido de sodio y similares en un disolvente orgánico inerte, por ejemplo un éter tal como el éter dietílico, el éter diisopropílico, el tetrahidrofurano, el dioxano, o en un alcohol tal como el metanol, el etanol, el propanol, el isopropanol, el butanol, el 1,2-etanodiol, el dietilenglicol, o en una carboxamida tal como la N,N-dimetil-formamida, la N,N-dimetil-acetamida o la N-metilpirrolidinona, o en dimetilsulfóxido, o en una mezcla de los disolventes anteriormente mencionados; y acidificación para obtener el tiol V. El benzisotiazol IV puede ser preparado en analogía con un procedimiento descrito en Liebigs Ann. Chem. 729, 146-151 (1969); y subsiguiente
- b) oxidación del tiol V para convertirlo en cloruro de sulfonilo II (Y = Cl), por ejemplo, haciendo reaccionar el tiol V con cloro en agua o en una mezcla disolvente con agua, por ejemplo una mezcla de agua y ácido acético, en analogía con un procedimiento descrito en Jerry March, 3^a edición, 1985,

~~112~~
112

reacción 9-27, página 1087.

Los compuestos II (en los que Y es cloro y R⁴ y R⁵ son hidrógeno) pueden prepararse mediante la secuencia de reacción que se muestra en el Esquema 3, en el que la variable R¹ tiene los significados dados anteriormente y R³ es H, Cl, Br, I o CN:

Esquema 3:



- c) preparar un compuesto de tiocianato VII por tiocianatación de la anilina VI con tiocianógeno, por ejemplo, en analogía con un procedimiento descrito en EP 945 449, en Jerry March, 3ª edición, 1985, p. 476, en Neuere Methoden der organischen Chemie, vol. 1, 237 (1944) o en J. L. Wood, Organic Reactions, vol. III, 240 (1946); el tiocianógeno es preparado por lo común *in situ* haciendo reaccionar, por ejemplo, tiocianato de sodio con bromo en un disolvente inerte. Los disolventes apropiados incluyen alcoholes tales como el metanol o el etanol o ácidos carboxílicos tales como el ácido acético, el ácido propiónico o el ácido isobutírico y mezclas de éstos. El disolvente inerte preferiblemente es el metanol, al cual puede haberse añadido algo de bromuro de sodio con fines de estabilización.
- d) Conversión del grupo amino en VII en un grupo diazonio mediante una diazotación convencional seguida de la conversión del grupo diazonio en hidrógeno, cloro, bromo o iodo o ciano. Son agentes nitrosantes apropiados el tetrafluoroborato de nitrosonio, el cloruro de nitrosilo, el ácido

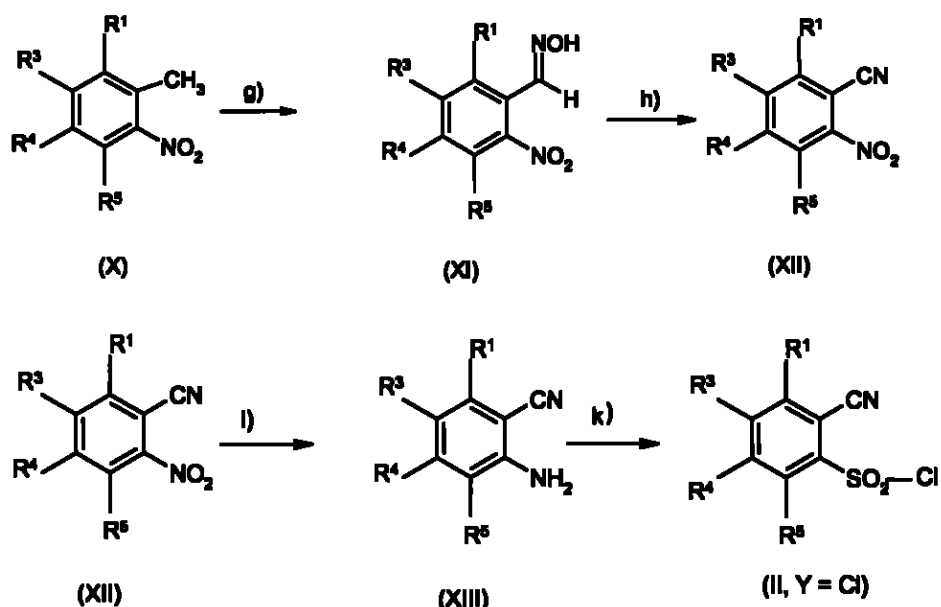
nitrosilsulfúrico, los nitritos de alquilo tales como el nitrito de t-butilo, o sales de ácido nitroso tales como el nitrito de sodio. La conversión de la resultante sal de diazonio en el correspondiente compuesto VIII, en el que R^3 = ciano, cloro, bromo o yodo puede ser llevada a cabo tratando a VII con una solución o suspensión de una sal de cobre(I), tal como el cianuro, el cloruro, el bromuro o el yoduro de cobre (I) o con una solución de una sal de metal alcalino (cfr., por ejemplo, Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry], Georg Thieme Verlag Stuttgart, vol. 5/4, 4ª edición 1960, pp. 438 y ss.). La conversión de la resultante sal de diazonio en el correspondiente compuesto VIII, en el que R^3 = H, por ejemplo, puede ser llevada a cabo mediante tratamiento con ácido hipofosforoso, ácido fosforoso, estannito de sodio o, en un medio no acuoso, mediante tratamiento con hidruro de tributilestaño o $(C_2H_5)_3SnH$ o con borohidruro de sodio (cfr. por ejemplo, Jerry March, 3ª edición, 1985, 646 y s.).

- e) Reducción del tiocianato VIII para obtener el correspondiente compuesto de tiol IX mediante tratamiento con zinc en presencia de ácido sulfúrico o mediante tratamiento con sulfuro de sodio; y subsiguiente
- f) Oxidación del tiol IX para obtener el cloruro de sulfonilo II por analogía con el paso b) del Esquema 2.

Además, el cloruro de bencenosulfonilo II ($Y = Cl$) puede ser preparado mediante la secuencia de reacción que se muestra en el Esquema 4, en el que las variables R^1 , R^3 , R^4 y R^5 son como se las ha definido anteriormente:

[Handwritten signature]
11/4

Esquema 4:



- g) Transformación del nitrotolueno X en el compuesto de benzaldoxima XI, por ejemplo, en analogía con un procedimiento descrito en WO 00/29394. La transformación de X en XI se logra, por ejemplo, haciendo reaccionar el nitrocompuesto X con un nitrito R-ONO orgánico, en el que R es alquilo, en presencia de una base. Son nitritos apropiados los nitritos de alquilo- $\text{C}_2\text{-C}_8$ tales como el nitrito de n-butilo o el nitrito de (iso)amilo. Son bases apropiadas los alcóxidos de metal alcalino tales como el metóxido de sodio, el metóxido de potasio o el ter-butóxido de potasio, los hidróxidos de metal alcalino tales como NaOH o KOH o compuestos de organomagnesio tales como los reactivos de Grignard de la fórmula R'MgX (R' =alquilo, X =halógeno). La reacción se lleva a cabo de ordinario en un disolvente inerte, que preferiblemente comprende un disolvente aprótico polar. Los disolventes apróticos polares apropiados incluyen carboxamidas tales como N,N-diaquilformamidas, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-diaquilacetamidas, por ejemplo N,N-dimetilacetamida o N-alquilactamas, por ejemplo N-metilpirrolidona o mezclas de éstas o mezclas de éstas con

disolventes no polares tales como alcanos, cicloalcanos y disolventes aromáticos, por ejemplo tolueno y xilenos. Cuando se usan bases de sodio, puede adicionarse 1-10 % en moles de un alcohol, si resultare apropiado. Las relaciones estequiométricas son, por ejemplo, como sigue: 1-4 equivalentes de base, 1-2 equivalentes de R-ONO; preferiblemente 1,5-2,5 equivalentes de base y 1-1,3 equivalente de R-ONO; igualmente preferible: 1-2 equivalentes de base y 1,3 equivalente de R-ONO. La reacción se lleva a cabo por lo común dentro de un intervalo de -60°C a temperatura ambiente, preferiblemente de -50°C a -20°C , en particular de -35°C a -25°C .

- h) Deshidratación de la aldoxima XI para convertirla en el nitrilo XII, por ejemplo mediante tratamiento con un agente deshidratante como el anhídrido acético, el ortoformiato de etilo y H^{+} , $(\text{C}_6\text{H}_5)_3\text{P}-\text{CCl}_4$, el cloroformiato de triclorometilo, el cianoformiato de metilo (o etilo), el anhídrido trifluorometanosulfónico por analogía con un procedimiento descrito en Jerry March, 4ª edición, 1992, 1038 y s.
- i) Reducción del compuesto XII para convertirlo en la anilina XIII, por ejemplo haciendo reaccionar el nitrocompuesto XII con un metal al como el hierro, zinc o estaño, o con SnCl_2 , en condiciones ácidas, con un hidruro complejo, tal como el hidruro de litio y aluminio y sodio. La reducción puede llevarse a cabo sin dilución o en un disolvente o diluyente. Son disolventes adecuados – según el reactivo reductor elegido – por ejemplo agua, alcoholes, tales como el metanol, el etanol y el isopropanol, o éteres, tales como el éter dietílico, el éter metil ter-butílico, el dioxano, el tetrahidrofurano y el éter dimetílico de etilenglicol.

El grupo nitro en el compuesto XII puede ser igualmente convertido en un grupo amino mediante hidrogenación catalítica (véase, por ejemplo, Houben Weyl, vol. IV/1c, pp. 506 y ss. o WO 00/29394). Son catalizadores

apropiados, por ejemplo, los catalizadores de platino o de paladio, en los que el metal puede ser soportado por un portador inerte tal como el carbón activado, las arcillas, celite, sílice, el óxido de aluminio, los carbonatos alcalinos o alcalinotérreos, etc. El contenido de metal del catalizador puede variar de 1 a 20% en peso, sobre la base del soporte. En general, se usan 0,001 a 1% en peso de platino o paladio, sobre la base del nitrocompuesto XII, preferiblemente de 0,01 a 1% en peso de platino o paladio. La reacción por lo común se lleva a cabo, o bien sin disolvente o bien en un disolvente o diluyente inerte. Los disolventes o diluyentes apropiados incluyen compuestos aromáticos tales como el benceno, el tolueno, los xilenos, las carboxamidas tales como las N,N-dialquilformamidas, por ejemplo la N,N-dimetilformamida, las N,N-dialquilacetamidas, por ejemplo la N,N-dimetilacetamida o las N-alquil-lactamas, por ejemplo la N-metilpirrolidona, las tetraalquilureas, tales como la tetrametilurea, la tetrabutilurea, el N,N'-dimetilpropilen-urea y la N,N'-dimetiletilen-urea; alcoholes tales como el metanol, el etanol, el isopropanol, o el n-butanol; éteres tales como el éter dietílico, el éter metil-ter-butílico, el dioxano, el tetrahidrofurano y el éter dimetílico de etilenglicol, los ácidos carboxílicos tales como el ácido acético o el ácido propiónico; un éster de ácido carbónico como el acetato de etilo. La temperatura de reacción oscila de ordinario dentro de un intervalo de -20° C a 100° C, preferiblemente de 0° C a 50° C. La hidrogenación puede llevarse a cabo bajo presión atmosférica de hidrógeno o presión de hidrógeno elevada.

- k) La conversión del grupo amino el compuesto XIII para convertirlo en el correspondiente grupo de diazonio, seguida por la reacción de la sal de diazonio con dióxido de azufre en presencia de cloruro de cobre (II) con el fin de tener los medios para obtener el cloruro de sulfonilo II. La sal de diazonio puede prepararse tal como se describe en el paso d) del esquema

~~ES~~
112

3. Como nitrito de alquilo se usa preferiblemente el nitrito de sodio. En general, el dióxido de azufre es disuelto en ácido acético glacial.

Los compuestos de la fórmula XIII pueden igualmente ser preparados de acuerdo con los métodos descritos en WO 94/18980, usando orto-nitroanilinas como precursores o WO 00/059868, usando precursores de isatina.

Si los compuestos individuales no pueden obtenerse por las vías anteriormente descritas, pueden ser preparados otros compuestos I por derivatización o por modificaciones usuales de las vías de síntesis descritas.

Las mezclas de reacción son elaboradas de la manera usual, por ejemplo mezclando con agua, separando las fases y, si fuere apropiado, purificando los productos brutos por cromatografía, por ejemplo empleando óxidos de aluminio o silicagel. Algunos de los productos intermedios y finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o de color pardo claro, que son librados o purificados de componentes volátiles bajo presión reducida y a una temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y finales se obtienen en forma de sólidos, se los puede purificar mediante recristalización o digestión.

Debido a su excelente acción, los compuestos de la fórmula general I pueden usarse para controlar plagas animales. Las plagas animales incluyen insectos y ácaros dañinos. De acuerdo con esto, la invención provee asimismo una composición útil en agricultura para combatir plagas animales, especialmente insectos y/o ácaros, que comprende una cantidad tal de por lo menos un compuesto de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de I que es útil en agricultura y por lo menos un portador inerte, líquido y/o sólido, aceptable en agronomía, que tiene acción plaguicida y, si se lo desea, por lo menos un tensioactivo.

Una composición de esa índole puede contener un único compuesto activo de la fórmula general I o una mezcla de varios compuestos activos I de acuerdo

con la presente invención. La composición conforme a la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros.

Los compuestos de 2-cianobencenosulfonamida I y las composiciones plaguicidas que los comprenden son agentes eficaces para controlar las plagas animales. Las plagas animales controladas por los compuestos de la fórmula I, incluyen por ejemplo:

Insectos del orden de los lepidópteros (*Lepidoptera*), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadiensis*;

Coleópteros (*Coleoptera*), por ejemplo: *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus*

grandis, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Ortiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nomorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;

Dípteros (Diptera), por ejemplo: *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* y *Tipula paludosa*;

Tisanópteros (Thysanoptera), por ejemplo: *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*;

Himenópteros (Hymenoptera), tales como las hormigas, las abejas, las

avispas y los Tenthredinidae, por ejemplo: *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Creumatogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Campodontus floridanus* y *Linepithëum humile* (*Linepithema humile*);

Heterópteros (Heteroptera), por ejemplo: *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* y *Thyanta perditor*;

Homópteros (Homoptera), por ejemplo: *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus homi*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*,

Schizaphis graminum, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii* y *Viteus vitifolii*;

Termitas o comejenes (Isoptera), por ejemplo: *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* y *Termes natalensis*;

Ortópteros (Orthoptera), por ejemplo: *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus fémur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*;

Arácnidos, tales como los arácnidos (Acarina), por ejemplo, de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp., tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp., tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp., tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp., tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *Oligonychus pratensis*;

Siphonatera, por ejemplo: *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Los compuestos de la fórmula I se usan preferiblemente para controlar plagas de los órdenes Homoptera y Thysanoptera.

Los compuestos de la fórmula I son también usados preferentemente para

controlar plagas de los órdenes de los himenópteros.

Los compuestos de la fórmula (I) o las composiciones plaguicidas que los comprenden pueden ser usados para proteger plantas en crecimiento o cosechas de los ataques o de la infestación por plagas animales, especialmente insectos o ácaros, contactando la planta/cosecha con una cantidad eficaz como plaguicida de compuestos de la fórmula (I). El término "cosecha" se refiere tanto a las cosechas en crecimiento como a las que ya han sido recogidas.

La plaga animal, especialmente los insectos, ácaros, plantas y/o el suelo o el agua donde crece la planta, pueden ser contactados con el/los presente/s compuesto(s) I o con la/s composición/es que los contienen mediante cualquier método de aplicación conocido en el estado de la técnica. En ese sentido, "contactar" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos / las composiciones directamente sobre la plaga animal, especialmente los insectos y/o ácaros, y/o la planta, típicamente sobre el follaje, el tallo o las raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicando los compuestos/las composiciones en el "locus" de la plaga animal, especialmente los insectos y/o ácaros, y/o de la planta).

Asimismo, las plagas animales, especialmente los insectos y los ácaros, pueden ser controlados contactando la plaga meta, su provisión de alimento o su "locus" con una cantidad eficaz como plaguicida de compuestos de la fórmula (I). En ese sentido, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de haber sido infestado por la plaga el "locus", las cosechas que están creciendo o las que ya han sido recogidas.

"Locus" significa un habitat, un terreno de procreación o cría, una planta, semillas, suelo, área, material o ambiente en el que está creciendo o puede crecer una plaga o un parásito.

Las cantidades eficaces apropiadas que han de usarse en el método de la invención pueden variar según el compuesto particular de la fórmula I que se elija, la plaga que se tome como objetivo, el método de aplicación, los tiempos que se

elijan para la aplicación, las condiciones del tiempo, el hábitat de la plaga animal, especialmente el hábitat de insectos o ácaros, o similares. En general, para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los compuestos I y/o de las composiciones conformes a esta invención pueden estar dentro del intervalo de aproximadamente 0,1 g a aproximadamente 4000 g por hectárea, deseablemente de aproximadamente 25 g a aproximadamente 600 g por hectárea, más deseablemente de aproximadamente 50 g a aproximadamente 500 g por hectárea. Para su uso en el tratamiento de semillas, la tasa típica de aplicación va de aproximadamente 1 g a aproximadamente 500 g por kilogramo de semillas, deseablemente de aproximadamente 2 g a aproximadamente 300 g por kilogramo de semillas, y más deseablemente de aproximadamente 10 g a aproximadamente 200 g por kilogramo de semillas. Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de aproximadamente 0,001 g a aproximadamente 2000 g, deseablemente de aproximadamente 0,005 g a aproximadamente 1000 g, del compuesto activo por cada metro cúbico de material tratado.

Los compuestos I, o las composiciones plaguicidas que los comprenden, pueden ser usados, por ejemplo, en forma de soluciones, emulsiones, microemulsiones, suspensiones, concentrados fluidos, polvillos, polvos, pastas y gránulos. La forma que se use depende del fin particular que se persiga; de cualquier manera, debería garantizar una distribución fina y uniforme del compuesto conforme a la invención.

La composición plaguicida para combatir plagas animales, especialmente insectos y/o ácaros, contiene una cantidad tal de por lo menos un compuesto de la fórmula general I o una sal de I que sea útil en agricultura, y auxiliares que suelen usarse en la formulación de una composición plaguicida.

Las formulaciones son preparadas de manera conocida, por ejemplo diluyendo el ingrediente activo con disolventes y/o portadores, usando, si se lo

~~124~~
124

desea, emulsionantes y dispersantes, siendo posible también usar otros disolventes orgánicos como disolventes auxiliares si el agua se usare como diluyente. Son auxiliares apropiados, esencialmente: disolventes tales como los aromáticos (por ejemplo, xileno), aromáticos clorados (por ejemplo, clorobenzenos), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo, metanol, butanol), cetonas (por ejemplo, ciclohexanona), aminas (por ejemplo, etanolamina, dimetilformamida) y agua; portadores tales como minerales térreos naturales (por ejemplo, caolines, arcillas, talco, creta) y minerales térreos sintéticos (por ejemplo, sílices de alta dispersión, silicatos); emulsionantes tales como emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de alcohol graso y polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos) y dispersantes tales como lejías residuales de ligninsulfito y metilcelulosa.

Son tensioactivos apropiados las sales de metales alcalinos, de metales alcalinotérreos y de amonio de ácido lignosulfónico, ácido naflatenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutylftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos y ácidos grasos y sus sales de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, sales de éter glicólico de alcohol graso sulfatado, condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naflatenosulfónico con fenol o formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, éteres poliglicólicos de alquilfenol, éteres poliglicólicos de tributilfenilo, alcoholes polietéricos de alquilarilo, alcohol isotridecílico, condensados de alcohol graso/ óxido de etileno, aceite castor etoxilado, éteres alquilicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, acetal de éter poliglicólico de alcohol laurílico, ésteres de sorbitol, lejías residuales de ligninsulfito y metilcelulosa.

Sustancias que son apropiadas para la preparación de soluciones directamente rociables, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite son las

fracciones de aceite mineral con punto de ebullición que va de medio a alto, tales como el querosén o el gasoil, como también los aceites de alquitrán de hulla y los aceites de origen vegetal o animal, los hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo benceno, tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, cloroformo, tetracloruro de carbono, ciclohexanol, ciclohexanona, clorobenceno, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo la dimetilformamida, el dimetilsulfóxido, la N-metilpirrolidona y el agua.

Los polvos, los materiales para dispersar y los polvillos pueden ser preparados moliendo o mezclando concomitantemente las sustancias activas con un portador sólido.

Los gránulos, por ejemplo los gránulos revestidos, los gránulos compactados, los gránulos impregnados y los gránulos homogéneos pueden prepararse ligando los ingredientes activos a portadores sólidos. Ejemplos de portadores sólidos son las tierras minerales, tales como las sílices, los silicageles, los silicatos, el talco, el caolín, el attaclay, la piedra caliza, la cal, la creta, la tierra bolar, el loess, la arcilla, la dolomita, la tierra de diatomeas, el sulfato de calcio, el sulfato de magnesio, el óxido de magnesio, los materiales sintéticos térreos molidos, los fertilizantes, por ejemplo el sulfato de amonio, el fosfato de amonio, el nitrato de amonio, las ureas, y productos de origen vegetal, tales como la harina de cereales, la harina de corteza de árbol, la harina de madera y la harina de cáscara de nuez, los polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

Estas formulaciones o composiciones de la presente invención incluyen un compuesto de fórmula I de esta invención (o combinaciones de ese compuesto) mezclado con uno o más portadores inertes aceptables en agronomía, sólidos o líquidos. Estas composiciones contienen una cantidad de ese compuesto o esos compuestos que es eficaz como plaguicida, cantidad que puede variar según el compuesto individual, la plaga que se tenga por objetivo, y el método que se use.

~~126~~
126

En general, las formulaciones comprenden de 0,01 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 90% en peso, del ingrediente activo. Los ingredientes activos se emplean con una pureza del 90% al 100%, preferiblemente del 95% al 100% (de acuerdo con el espectro de RMN).

Las siguientes formulaciones sirven de ejemplo:

- I. 5 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son mezcladas muy bien con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da por resultado un polvillo que comprende un 5% en peso del ingrediente activo.
- II. 30 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son mezcladas muy bien con una mezcla consistente en 92 partes en peso de silicagel pulverulento y 8 partes en peso de aceite de parafina que ha sido rociado sobre la superficie de ese silicagel. Esto da por resultado una formulación del ingrediente activo con buenas propiedades adhesivas (comprende 23% en peso del ingrediente activo).
- III. 10 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son disueltas en una mezcla compuesta de 90 partes en peso de xileno, 6 partes en peso del aducto de 8 a 10 moles de óxido de etileno y 1 mol de N-monoetanolamida de ácido oleico, 2 partes en peso de dodecibencenosulfonato de calcio y 2 partes en peso del aducto de 40 moles de óxido de etileno y 1 mol de aceite de ricino (comprende 9% en peso del ingrediente activo).
- IV. 20 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son disueltas en una mezcla compuesta de 60 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 5 partes en peso del aducto de 7 moles de óxido de etileno y 1 mol de isooctilfenol y 5 partes en peso del aducto de 40 moles de óxido de etileno y 1 mol de aceite de ricino (comprende 16% en peso del ingrediente activo).
- V. 80 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son mezclados

~~112~~
127

a fondo con 3 partes en peso de diisobutilnaftaleno-alfa-sulfonato de sodio, 10 partes en peso de sal de sodio de un ácido lignosulfónico obtenido de una lejía residual de sulfito y 7 partes en peso de silicagel pulverulento, y la mezcla es molida en un molino de martillos (comprende 80% en peso del ingrediente activo).

- VI. 90 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son mezcladas con 10 partes en peso de N-metil- α -pimolidona, lo que da por resultado una solución que es apropiada para ser usada en forma de microgotas (comprende un 90% en peso del ingrediente activo).
- VII. 20 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son disueltos en una mezcla compuesta por 40 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 20 partes en peso del aducto de 7 moles de óxido de etileno y 1 mol de isooctilfenol y 10 partes en peso del aducto de 40 moles de óxido de etileno y 1 mol de aceite de ricino. Si se vierte esa solución en 100.000 partes en peso de agua y se la distribuye finamente en ella, se obtiene una dispersión acuosa que comprende 0,02% en peso del ingrediente activo.
- VIII. 20 partes en peso de un compuesto conforme a la invención son mezcladas a fondo con 3 partes en peso de diisobutilnaftaleno- α -sulfonato de sodio, 17 partes en peso de sal de sodio de un ácido lignosulfónico obtenido a partir de una lejía residual de sulfito y 60 partes en peso de silicagel pulverulento, y esa mezcla es molida en un molino de martillos. Si se distribuye finamente esa mezcla en 20.000 partes en peso de agua, se obtiene una mezcla de rociado que comprende 0,1% en peso del ingrediente activo.

Los ingredientes activos pueden usarse como tales, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de ellas, por ejemplo en forma de soluciones directamente rociables, polvos, suspensiones o dispersiones,

emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, polvillo, materiales para diseminar, o gránulos, por medio de rociado, pulverizado, espolvoreo, esparcimiento o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los fines que se persigan; de cualquier manera, esto tiene por finalidad garantizar la distribución más fina posible de los ingredientes activos conformes a la invención.

Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos rociables, dispersiones en aceite) adicionándoles agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente, pueden ser homogeneizadas en agua por medio de un humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante. Alternativamente, es posible preparar concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante y, si fuese apropiado, de disolvente o aceite, y esos concentrados son apropiados para ser diluidos en agua.

Las concentraciones de ingredientes activos en los productos listos para ser usados pueden variarse dentro de intervalos sustanciales. En general, esos intervalos van de 0,0001 a 10%, preferiblemente de 0,01 a 1%.

Los ingredientes activos pueden ser también usados con éxito en un procedimiento de volumen ultrabajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprendan más del 95% en peso del ingrediente activo, o incluso el ingrediente activo sin aditivos.

Las composiciones que han de usarse de acuerdo con esta invención pueden contener igualmente otros ingredientes activos, por ejemplo otros plaguicidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas, o bactericidas, fertilizantes tales como el nitrato de amonio, la urea, la potasa, y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, protectores y nematocidas. Estos ingredientes adicionales pueden usarse en secuencia o en combinación con las composiciones anteriormente descritas y, si fuese apropiado, se los añadiría

sólo inmediatamente antes de usárselos [tank mix (mezcla en el tanque)]. Por ejemplo, la(s) planta(s) puede(n) ser rociada(s) con una composición de esta invención ya sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

Estos agentes pueden ser mezclados con los agentes usados de acuerdo con la invención en una relación de peso de 1:10 a 10:1. Mezclar los compuestos I o las composiciones que los comprenden en las formas de uso de plaguicidas con otros plaguicidas con frecuencia da por resultado un espectro plaguicida más amplio.

La siguiente lista de plaguicidas juntamente con los cuales pueden ser usados los compuestos de la fórmula I, tiene por finalidad ilustrar las combinaciones posibles, pero no imponer limitación alguna:

Organofosfatos: Acefato, Azinphos-metilo, chlorpyrifos, chlorfenvinphos, diazinona, dichlorvos, dicrotophos, dimetoato, disulfoton, ethion, fenitrothion, fenthion, isoxathion, malathion, methamidophos, methidathion, methyl-parathion, mevinphos, monocrotophos, oxidemeton-metilo, paraoxona, parathion, fentoato, fosadona, fosmet, fosfamidona, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, prothiofos, sulprophos, triazophos, trichlorfon;

Carbamatos: Alanycarb, Benfuracarb, carbaryl, carbosulfano, fenoxycarb, furathiocarb, indoxacarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamato;

Piretroides: bifenthrin, cyfluthrin, cypermethrin, deltamethrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, cihalotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, silafluofen, tau-fluvalinate, teflutrina, tralometrin, zeta-cipermetrina;

Reguladores del crecimiento de artrópodos: a) inhibidores de la síntesis de la quitina: benzollureas: chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazole, clofentazina; b) antagonistas de la ecdisona: halofenozide, metoxifenozide, tebufenozide; c) juvenoides: pyriproxyfen,

Handwritten signature and number 130

metoprene, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: spirodiclofen.

Diversos: abamectin, acequinocyl, amitraz, azadirachtin, bifenazate, cartap, chlorfenapyr, chlordimeform, cyromazine, diafenthiuron, dinetofuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, ethiprole, fenazaquin, fipronil, formetanate, formetanate clorhidrato, hydramethylnon, imidacloprid, indoxacarb, pyridaben, pymetrozine, spinosad, sulfur, tebufenpyrad, thiamethoxam, y thiocyclam.

La presente invención será ahora ilustrada más detalladamente con los ejemplos siguientes:

I. Ejemplos de síntesis.

Ejemplo 1: n-propil-(2-ciano-3-metil-fenil)sulfonamida

1.1: cloruro de 2-ciano-3-metil-fenilsulfonilo

Se cargó inicialmente una solución de 11,6 g (88 mmoles) de 2-amino-6-metilbezónitrilo (preparada, por ejemplo de acuerdo con WO 94/18980) en 120 ml de ácido acético glacial y se le adicionaron lentamente, a temperatura ambiente, 32,2 g de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 10 minutos y seguidamente se le adicionó por goteo, a 5 – 10° C, una solución de 6,4 g (92 mmoles) de nitrito de sodio en 20 ml de agua. La mezcla de reacción fue agitada a 0° C durante una hora para que se obtuviera la sal de diazonio. En un frasco separado que se agitaba, se preparó una solución saturada de dióxido de azufre en ácido acético glacial a 10° C y se adicionó una solución de 5,5 g de cloruro de cobre (II) en 11 ml de agua. La mezcla de reacción de la sal de diazonio que había sido preparada previamente fue entonces añadida por goteo a la solución de la sal de cobre. La mezcla resultante fue agitada a temperatura ambiente durante 45 minutos adicionales. Luego, la mezcla de la reacción fue vertida en agua enfriada con hielo y la fase acuosa fue extraída tres veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas fueron secadas sobre un agente secador y filtradas. El filtrado fue concentrado al vacío para obtener 16,4 g (87% del teórico) del compuesto del

título cuyo punto de fusión es de 75-77° C.

1.2: *n*-propil-(2-ciano-3-metil-fenil)sulfonamida

Una solución de 1 g (5 mmoles) de cloruro de 2-ciano-3-metil-fenilsulfonilo en 10 ml de tetrahidrofurano fue adicionada a una solución de 630 mg (11 mmoles) de *n*-propilamina en 20 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. La mezcla de reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 3 horas antes de adicionársele agua. La fase acuosa fue acidificada con ácido clorhídrico (a una concentración de 10% en peso, solución acuosa) hasta pH = 3 y luego fue extraída tres veces con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre sulfato de sodio y filtrados. El filtrado fue concentrado al vacío para obtener 850 mg (85% del teórico) del compuesto del título cuyo punto de fusión es de 74 – 77° C.

Ejemplo 2: Metil-(2-ciano-3-metoxi-fenil)sulfonamida

2.1: 2-amino-6-metoxi-benzonitrilo.

Se cargó inicialmente una solución de 70 g (0,5 mol) de 2-amino-6-fluoro-benzonitrilo (preparada, por ejemplo de acuerdo con US 4,504,660) en 250 ml de *N,N*-dimetilformamida y, mientras se la agitaba, se le adicionó por goteo una solución de 30,6 g (0,55 mol) de metóxido de sodio en 70 ml de metanol, a temperatura ambiente. La mezcla fue entonces sometida a reflujo durante 5 horas mientras se la agitaba. La compleción de la reacción fue monitoreada mediante TLC. Se añadieron 25 g adicionales de metóxido de sodio en 35 ml de metanol y la mezcla de reacción fue sometida a reflujo durante 4 horas adicionales mientras se la agitaba. La mezcla de reacción fue concentrada bajo presión reducida, el residuo resultante fue triturado con agua, filtrado por succión y los sólidos obtenidos fueron disueltos en acetato de etilo. La solución resultante fue concentrada al vacío. El residuo obtenido fue triturado con éter de petróleo y filtrado por succión para obtener 48 g (63% del teórico) de un sólido pardusco cuyo punto de fusión era de 143-146° C.

2.2: Cloruro de 2-ciano-3-metoxi-fenilsulfonilo

10 g de ácido clorhídrico concentrado fueron adicionados lentamente a una solución de 4,0 (27 mmoles) de 2-amino-6-metoxi-benzonitrilo en 32 ml de ácido acético glacial a temperatura ambiente, mientras se la agitaba. La mezcla fue agitada a temperatura ambiente durante 10 minutos. Luego se adicionó, a 5 – 10° C, una solución de 1,9 g (27,3 mmoles) de nitrito de sodio en 5 ml de agua y la mezcla de reacción fue agitada a 0° C durante una hora para obtener la sal de diazonio. En un frasco separado se preparó, a temperatura ambiente, una solución saturada de dióxido de azufre en 68 ml de ácido acético glacial y se adicionó una solución de 1,7 g de cloruro de cobre (II) en 4 ml de agua. La mezcla de reacción de la sal de diazonio que había sido preparada previamente, fue entonces añadida rápidamente a la solución de la sal de cobre. La mezcla resultante fue agitada a temperatura ambiente durante 2,5 horas adicionales. La mezcla de reacción fue entonces vertida en agua enfriada con hielo. La capa acuosa fue extraída tres veces con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre un agente secador y filtradas por succión. El filtrado fue concentrado al vacío para obtener 5,3 g (85% del teórico) del compuesto del título cuyo punto de fusión era de 96 – 99° C.

2.3: Metil-(2-ciano-3-metoxi-fenil)sulfonamida

Una solución de 1,25 g (5,4 mmoles) de cloruro de 2-ciano-3-metoxi-fenilsulfonilo en 30 ml de tetrahidrofurano fue adicionada a una solución de 960 g (12 mmoles) de una solución acuosa de metilamina (40% en peso) en 20 ml de tetrahidrofurano, a temperatura ambiente. La mezcla de reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 30 minutos antes de que se le adicionara agua. La fase acuosa fue acidificada hasta pH = 3, usándose ácido clorhídrico (a una concentración de 10% en peso, solución acuosa). La fase acuosa fue entonces extraída tres veces con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre sulfato de sodio y filtrados. El filtrado fue concentrado al vacío y el

residuo resultante fue triturado con éter terbutil-metilico para obtener 0,28 g (23% del teórico) del compuesto del título cuyo punto de fusión era de 121 – 128° C.

Ejemplo 3: Etil-(4-cloro-2-ciano-3-metil-fenil)sulfonamida

3.1: 5-cloro-6-metil-2-tiociano-benzonitrilo

30 g (190 mmoles) de 2-metil-3-ciano-4-tiocianatoanilina (preparada de acuerdo con EP 0945449) fueron disueltos en 160 ml de ácido acético glacial y se adicionaron lentamente, por goteo, y mientras se agitaba, 63 g de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla fue agitada durante 10 minutos y luego se le adicionó por goteo, a 5 – 10° C, una solución de 11 g (160 mmoles) de nitrito de sodio en 23 ml de agua, a fin de obtener la sal de diazonio. En un frasco separado, se preparó una solución de 16 g de cloruro de cobre(I) en 50 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción de la sal de diazonio que había sido preparada previamente fue entonces añadida rápidamente por goteo a la solución de la sal de cobre. La resultante mezcla de reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 24 horas. La mezcla de reacción entonces fue vertida en agua enfriada con hielo y la fase acuosa fue extraída tres veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas fueron secadas, filtradas y luego evaporadas. El producto bruto resultante fue purificado mediante cromatografía de columna en silicagel (eluyente: tolueno / acetato de etilo) para arrojar 14,3 g (43% del teórico) del compuesto del título, cuyo punto de fusión era de 78 –80° C.

3.2: Cloruro de 4-cloro-2-ciano-3-metil-fenilsulfonilo

Se cargó inicialmente una suspensión de 3,0 g (21 mmoles) de 5-cloro-6-metil-2-tiocianatobenzonitrilo en 20 ml de metanol y se le adicionó una solución de 1,9 g (14 mmoles) de sulfuro de sodio en 8 ml de agua, mientras la temperatura era mantenida entre 20 y 35° C. La solución amarilla resultante fue agitada a temperatura ambiente durante 2 días. La mezcla fue entonces diluida con agua y extraída con éter terbutil-metilico. La fase acuosa fue ajustada a pH 7 por adición de ácido clorhídrico concentrado y luego extraída con diclorometano. La fase

acuosa fue seguidamente ajustada a pH 1 por adición de ácido clorhídrico concentrado y luego extraída con diclorometano. La capa orgánica fue secada, filtrada y luego concentrada. El residuo obtenido fue suspendido en una mezcla de 20 ml de ácido acético glacial, 5 ml de diclorometano y 18 ml de agua, y fue entonces que se introdujo, a 25-45° C, una corriente de gas cloro, durante un período de 3 horas. La mezcla de la reacción fue diluida con diclorometano y la fase orgánica fue lavada con agua enfriada con hielo. El secado de la fase orgánica sobre sulfato de sodio fue seguida por filtración y concentración de la solución para arrojar 1,3 g (36% del teórico) del compuesto del título, cuyo punto de fusión era de 69 – 72° C.

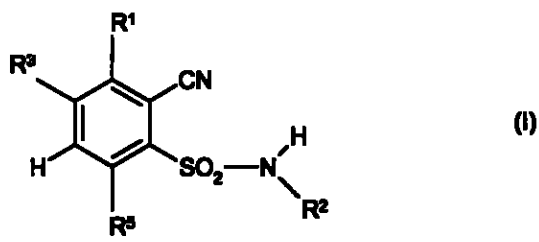
3.3: *Etil-(4-cloro-2-ciano-3-metil-fenil)sulfonamida*

Se cargó inicialmente una solución acuosa de 770 mg (12 mmoles) de etilamina (70% en peso) en 20 ml de tetrahidrofurano y se adicionó por goteo, a temperatura ambiente, una solución de 1,3 g (5,2 mmoles) de cloruro de 4-cloro-2-ciano-3-metilfenilsulfonilo (de 3.2.) en 10 ml de tetrahidrofurano. La mezcla de la reacción fue agitada a temperatura ambiente durante 2 horas, diluida con agua y ajustada a pH 3 por adición de ácido clorhídrico (a una concentración del 10% en peso, solución acuosa). La fase acuosa fue extraída tres veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas fueron secadas sobre sulfato de sodio, filtradas y luego evaporadas al vacío hasta la sequedad, para obtener 0,5 g (28% del teórico) de un sólido pardo, cuyo punto de fusión era de 85-90° C.

Los compuestos Nos 4 a 191 de la fórmula I con $R^4 = H$, que aparecen en la lista de la siguiente Tabla 1 y los compuestos Nos. 192 y 193 de la fórmula I con $R^5 = H$, que aparecen en la Tabla 2, fueron preparados de manera análoga.

750
35

Tabla 1:



Ejemplo N°	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	p.f.[° C]
1	H	H	CH ₃	n-CH ₂ CH ₂ CH ₃	74-77
2	H	H	CH ₃	-CH ₃	121-128
3	Cl	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	85-90
4	CN	CH ₃	CH ₃	-CH ₃	178-180
5	Br	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	112-114
6	Br	H	CH ₃	Ciclopropilo	140-142
7	Br	H	CH ₃	n-C ₄ H ₉	112-116
8	Br	H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	102-103
9	Br	H	CH ₃	n-CH ₂ CH ₂ CH ₃	119-120
10	Br	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	139-140
11	Br	H	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	147-151
12	H	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	117-119
13	H	H	CH ₃	4-(CH ₃) ₃ C-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	97-103
14	H	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	150-151
15	Br	H	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	123-125
16	H	H	CH ₃	3-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	117-122
17	Br	H	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	156-161
18	H	H	CH ₃	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-132
19	Br	H	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	103-108
20	H	H	CH ₃	2-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-130
21	Br	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	127-131
22	Br	H	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	102-108
23	H	H	CH ₃	3-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	118-125
24	Br	H	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	118-125
25	H	H	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	128-131
26	Br	H	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	153-155
27	H	H	CH ₃	4-(F ₃ C)-C ₆ H ₄ -CH ₂ -	135-137
28	Br	H	CH ₃	ciclopropil-CH ₂ -	106-110
29	H	H	CH ₃	-CH ₃	83-89
30	H	H	CH ₃	-CH ₂ CH ₃	98-103
31	H	H	CH ₃	Prop-2-inilo	104-107
32	Br	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	106-110
33	H	H	CH ₃	ciclopropil-CH ₂ -	89-93
34	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	130-134
35	Br	H	CH ₃	prop-2-inilo	¹ H-RMN
36	Br	H	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	112-114
37	H	H	CH ₃	(CH ₃) ₃ C-CH ₂ -	86-93
38	H	H	CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	¹ H-RMN

Ejemplo Nº	R ³	R ⁵	R ¹	R ²	p.f.[° C]
39	H	H	OCH ₃	-CH ₂ CH ₃	121-126
40	H	H	OCH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	108-119
41	H	H	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂	104-113
42	H	H	OCH ₃	prop-2-inilo	122-138
43	H	H	OCH ₃	CH ₂ -CN	¹ H-RMN
44	H	H	OCH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	¹ H-RMN
45	H	H	OCH ₃	H	186-198
46	Cl	H	CH ₃	-CH ₃	112-122
47	Cl	H	CH ₃	H	160-162
48	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₃	91-95
49	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	111-113
50	H	H	OCH ₂ CH ₃	H	183-186
51	Cl	H	CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	132-135
52	Cl	H	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	86-94
53	Cl	H	CH ₃	prop-2-inilo	¹ H-RMN
54	Cl	H	CH ₃	H ₂ C=CHCH ₂ -	95-96
55	Cl	H	CH ₃	FH ₂ CCH ₂ -	115-121
56	H	H	OCH ₂ CH ₃	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	Aceite
57	H	H	OCH ₂ CH ₃	Prop-2-inilo	105-112
58	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CN	129-134
59	H	H	OCH ₂ CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂ -	aceite
60	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	113-115
61	H	H	OCH ₂ CH ₃	ciclopropilo-CH ₂	128-130
62	Cl	H	CH ₃	-CH ₂ -CN	134-138
63	H	H	OCH ₂ CH ₃	-CH ₂ -CF ₃	aceite
64	H	H	OCH ₂ CH ₃ =CH ₂	-CH ₂ -CH ₃	aceite
65	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₃	aceite
66	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₃	98-100
67	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	132-136
68	H	H	OCH(CH ₃) ₂	prop-2-inilo	aceite
69	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CN	aceite
70	H	H	OCH(CH ₃) ₂	ciclopropilo	aceite
71	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃) ₂	aceite
72	H	H	OCH(CH ₃) ₂	C ₆ H ₅ -CH ₂ -	aceite
73	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₃	aceite
74	Br	H	CH ₃	H	149-151
75	H	H	CH ₃	H	171-174
76	H	H	OCH(CH ₃) ₂	O-CH ₂ -CH ₃	aceite
77	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	aceite
78	H	H	OCHF ₂	H	135-137
79	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -C≡CH ₂ -	65-70
80	H	H	OCH ₂ CHClCH ₂ Cl	H	123-129
81	H	H	OCH(CH ₃) ₂	-CH ₃	82-91
82	H	H	OCH ₃	CH ₂ -c-C ₃ H ₅	92-95
83	H	H	OCH ₃	-c-C ₃ H ₅	142-148
84	H	H	OCH ₃	O-CH ₂ -CH ₃	138-143
85	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CN	123-130
86	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	aceite
87	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S(O) ₂ -CH ₃	157-160
88	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CH ₂ F	134-140

132

Ejemplo N°	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	p.f.[° C]
89	H	H	OCHF ₂	H	122-128
90	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CF ₃ -	136-141
91	H	H	OCH ₃	-CH ₂ -CHF ₂ -	116-118
92	H	H	OCH ₃	-O-CH ₃	136-139
93	Br	H	OCH ₃	CH ₂ -C≡CH	110-115
94	H	H	OCH ₃	CH ₂ -CH ₂ -N-(CH ₃) ₂	94-97
95	Br	H	OCH ₃	-CH ₂ -C ₆ H ₅	134-136
96	H	H	OCHF ₂	CH ₂ -CF ₃	120-138
97	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -C ₆ H ₅	115-117
98	H	H	OCHF ₂	-c-C ₃ H ₅	87-91
99	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	¹ H-RMN
100	Br	H	OCHF ₂	-CH ₃	168-173
101	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH=CH ₂ -	75-78
102	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -c-C ₃ H ₅	¹ H-RMN
103	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	54-58
104	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	¹ H-RMN
105	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CH ₂ -CN	83-88
106	H	H	OCHF ₂	-CH-(CH ₃) ₂	72-74
107	H	H	OCHF ₂	-CH ₂ -CHF ₂	92-96
108	H	H	OCHF ₂	-O-CH ₃	aceite
109	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₃	81-86
110	H	H	CF ₃	CH ₂ -C≡CH	106-111
111	H	H	CF ₃	-CH ₂ -C ₆ H ₅	106-108
112	H	H	CF ₃	-CH ₃	104-113
113	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	71-73
114	H	H	CF ₃	-CH-(CH ₃) ₂	65-67
115	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	62-66
116	H	H	CF ₃	-CH ₂ -c-C ₃ H ₅	aceite
117	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CF ₃	aceite
118	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	aceite
119	H	H	CF ₃	-c-C ₃ H ₅	94-96
120	H	H	CF ₃	O-CH ₂ -CH ₃	118-120
121	H	H	CF ₃	-CH ₂ -CH ₂ -SO ₂ -CH ₃	169-171
122	H	H	CH ₃	O-CH ₂ -CH ₃	118-121
123	H	H	CH ₃	O-CH ₃	136-140
124	H	H	CH ₃	Ciclobutilo	HPLC/E M
125	H	H	CH ₃	Ciclopentilo	HPLC/E M
126	H	H	CH ₃	Ciclohexilo	HPLC/E M
127	H	H	CH ₃	Ciclopropilo	HPLC/E M
128	H	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/E M
129	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(C ₂ H ₅) ₂	HPLC/E M
130	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₂	HPLC/E M
131	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	HPLC/E

38

Ejemplo N°	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	p.f.[° C]
					M
132	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₃	HPLC/E M
133	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH ₃	HPLC/E M
134	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/E M
135	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -N[CH(CH ₃) ₂] ₂	HPLC/E M
136	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/E M
137	H	H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅) ₂ -	HPLC/E M
138	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/E M
139	H	H	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅)-CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/E M
140	H	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ -C≡CH	HPLC/E M
141	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/E M
142	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/E M
143	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅	HPLC/E M
144	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/E M
145	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(OCH ₃) ₂	HPLC/E M
146	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₃	HPLC/E M
147	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(OC ₂ H ₅) ₂	HPLC/E M
148	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/E M
149	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/E M
150	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	HPLC/E M
151	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/E M
152	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH ₃	HPLC/E M
153	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -C ₂ H ₅	HPLC/E M
154	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	HPLC/E M
155	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -S-C ₃ H ₅	HPLC/E M
156	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -S-C ₃ H ₃	HPLC/E M

Ejemplo Nº	R ³	R ⁵	R ¹	R ²	p.f.[° C]
157	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -N(CH ₃) ₂	HPLC/E M
158	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -(n-C ₃ H ₇) ₂ - C≡CH	HPLC/E M
159	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH=CH ₂	HPLC/E M
160	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -C(O)-O-CH ₃	HPLC/E M
161	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)-c-C ₃ H ₅	HPLC/E M
162	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CF ₃	HPLC/E M
163	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	HPLC/E M
164	H	H	CH ₃	-C(CH ₃)-C ₂ H ₅	HPLC/E M
165	H	H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	HPLC/E M
166	H	H	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CN	HPLC/E M
167	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	HPLC/E M
168	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/E M
169	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -F	HPLC/E M
170	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-C ₂ H ₅	HPLC/E M
171	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH(CH ₃) ₂	HPLC/E M
172	H	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH ₂ -Cl	HPLC/E M
173	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -Cl	HPLC/E M
174	H	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡C-CH ₂ -Cl	HPLC/E M
175	H	H	CH ₃	-CH ₂ -C(O)-O-CH ₃	HPLC/E M
176	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -Br	HPLC/E M
177	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	HPLC/E M
178	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -S-C ₂ H ₅	HPLC/E M
179	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₃	114-119
180	H	H	CH ₃	-CH ₃	172-175
181	H	H	CH ₃	CH ₂ -C≡CH	95-105
182	H	H	CH ₃	H	aceite
183	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	aceite
184	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	139-142
185	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -F	171-174

Ejemplo N°	R ³	R ⁵	R ¹	R ²	p.f.[° C]
186	H	H	CH ₃	-ciclopropilo	151-155
187	H	H	CH ₃	-O-CH ₃	171-180
188	H	H	CH ₃	-CH ₂ -CH ₃	171-175
189	H	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡CH	
190	H	H	CH ₃	H	
191	H	H	CH ₃	-CH ₃	

p.f.: punto de fusión;

c-C₃H₅: ciclopropilo;

n-C₃H₇: n-propilo.

Algunos compuestos estaban caracterizados por ¹H-RMN. Los signos están caracterizadas por el desplazamiento químico (ppm) vs. tetrametilsilano, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno que están dados). Las siguientes abreviaturas se usan para caracterizar la multiplicidad de los signos: m = multiplete; t = triplete; d = doblete y s = singulete.

Ejemplo 35: 2,06 (t, 1H), 2,72 (s, 3H), 3,92 (m, 2H), 5,56 (t, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), CDCl₃.

Ejemplo 38: 2,66 (s, 3H), 3,67 (m, 2H), 5,12 (d, 1H), 5,21 (d, 1H), 5,30 (t, 1H), 5,74 (m, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,62 (t, 1H), 7,95 (d, 1H), CDCl₃.

Ejemplo 43: 4,04 (s, 3H), 4,13 (d, 2H), 6,15 (t, 1H), 7,30 (m, 1H), 7,72 (m, 2H), CDCl₃.

Ejemplo 44: 3,67 (m, 2H), 4,04 (s, 3H), 5,11 (d, 1H), 5,23 (m, 2H), 5,76 (m, 1H), 7,23 (dd, 1H), 7,68 (m, 2H), CDCl₃.

Ejemplo 53: 2,07 (m, 1H), 2,72 (s, 3H), 3,95 (m, 2H), 5,52 (t, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), CDCl₃.

Ejemplo 99: 2,05 (s, 3H), 2,66 (t, 2H), 3,28 (q, 2H), 5,62 (t, 1H), 6,73 (t, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,77 (t, 1H), 7,99 (d, 1H), CDCl₃.

Ejemplo 102: 0,13 (m, 2H), 0,31 (m, 2H), 0,90 (m, 1H), 2,95 (t, 2H), 5,32 (t, 1H), 6,72 (t, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,77 (t, 1H), 8,00 (d, 1H), CDCl₃.

Ejemplo 104: 3,27 (s, 3H), 3,33 (m, 2H), 3,43 (m, 2H), 5,56 (t, 1H), 6,75 (t, 1H),

~~148~~
141

7,58 (d, 1H), 7,77 (t, 1H), 8,00 (d, 1H), CDCl_3 .

Ejemplo 145: 2,65 (s, 3H), 3,15 (pt, 2H), 3,3 (s, 6H), 4,35 (t, 1H), 5,65 (t, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,6 (t, 1H), 7,9 (d, 1H), CDCl_3 .

Algunos compuestos estaban caracterizados por la Cromatografía líquida de alto rendimiento (High performance liquid chromatography) / espectrometría de masas acopladas (HPLC /EM).

Columna de HPLC: columna RP-18 (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania).

Elución: acetonitrilo + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA) / agua en una relación de 5:95 a 95:5 en 5 minutos a 40° C.

MS: Ionización por electrospray Quadrupol, 80 voltios (modo positivo)

Ejemplo 124: 2,813 min., $m/z = 273$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$

Ejemplo 125: 3,043 min., $m/z = 287$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$

Ejemplo 126: 3,260 min., $m/z = 279$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 127: 2,486 min., $m/z = 237$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 128: 3,198 min., $m/z = 267$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 129: 1,955 min., $m/z = 310$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 130: 3,244 min., $m/z = 267$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 131: 3,438 min., $m/z = 281$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 132: 3,004 min., $m/z = 253$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 133: 3,483 min., $m/z = 303$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 134: 3,533 min., $m/z = 281$ $[\text{M}+\text{Na}]^+$

Ejemplo 135: 2,091 min., $m/z = 324$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 136: 2,534 min., $m/z = 269$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 137: 3,154 min., $m/z = 267$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

Ejemplo 138: 3,413 min., $m/z = 303$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

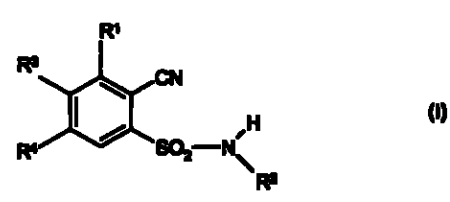
Ejemplo 139: 2,761 min., $m/z = 283$ $[\text{M}+\text{H}]^+$

- Ejemplo 140: 2,740 min., $m/z = 263 [M+H]^+$
Ejemplo 141: 2,802 min., $m/z = 283 [M+H]^+$
Ejemplo 142: 2,596 min., $m/z = 269 [M+H]^+$
Ejemplo 143: 3,225 min., $m/z = 267 [M+H]^+$
Ejemplo 144: 3,836 min., $m/z = 285 [M+H]^+$
Ejemplo 146: 3,430 min., $m/z = 281 [M+H]^+$
Ejemplo 147: 2,934 min., $m/z = 335 [M+Na]^+$
Ejemplo 148: 2,677 min., $m/z = 271 [M+H]^+$
Ejemplo 149: 2,989 min., $m/z = 253 [M+H]^+$
Ejemplo 150: 3,254 min., $m/z = 267 [M+H]^+$
Ejemplo 151: 2,443 min., $m/z = 269 [M+H]^+$
Ejemplo 152: 2,481 min., $m/z = 269 [M+H]^+$
Ejemplo 153: 3,501 min., $m/z = 281 [M+H]^+$
Ejemplo 154: 2,750 min., $m/z = 285 [M+H]^+$
Ejemplo 155: 3,362 min., $m/z = 335 [M+Na]^+$
Ejemplo 156: 3,116 min., $m/z = 321 [M+Na]^+$
Ejemplo 157: 1,740 min., $m/z = 282 [M+H]^+$
Ejemplo 158: 3,249 min., $m/z = 291 [M+H]^+$
Ejemplo 159: 2,985 min., $m/z = 265 [M+H]^+$
Ejemplo 160: 2,364 min., $m/z = 283 [M+H]^+$
Ejemplo 161: 2,919 min., $m/z = 265 [M+H]^+$
Ejemplo 162: 2,644 min., $m/z = 301 [M+Na]^+$
Ejemplo 163: 2,177 min., $m/z = 255 [M+H]^+$
Ejemplo 164: 2,917 min., $m/z = 253 [M+H]^+$
Ejemplo 165: 2,570 min., $m/z = 239 [M+H]^+$
Ejemplo 166: 2,500 min., $m/z = 278 [M+H]^+$
Ejemplo 167: 3,314 min., $m/z = 282 [M+H]^+$
Ejemplo 168: 3,297 min., $m/z = 267 [M+H]^+$

~~143~~
143

- Ejemplo 169: 2,259 min., m/z = 243 [M+H]⁺
- Ejemplo 170: 2,709 min., m/z = 283 [M+H]⁺
- Ejemplo 171: 2,814 min., m/z = 283 [M+H]⁺
- Ejemplo 172: 2,733 min., m/z = 273 [M+H]⁺
- Ejemplo 173: 2,729 min., m/z = 273 [M+H]⁺
- Ejemplo 174: 2,743 min., m/z = 283 [M+H]⁺
- Ejemplo 175: 2,187 min., m/z = 269 [M+H]⁺
- Ejemplo 176: 2,935 min., m/z = 317 [M+H]⁺
- Ejemplo 177: 3,090 min., m/z = 253 [M+H]⁺
- Ejemplo 178: 2,956 min., m/z = 285 [M+H]⁺

Tabla 2:



Ejemplo N°	R ³	R ⁴	R ¹	R ²	p.f.[° C]
191	H	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₃	119-123
192	H	Br	CH ₃	CH ₂ CH ₃	141-144

II. Ejemplos de acción contra plagas

La acción de los compuestos de la fórmula I contra plagas fue demostrada con los siguientes experimentos:

Áfido verde del durazno (*Myzus persicae*)

Los compuestos activos fueron formulados en acetona:agua 50:50 y 100 ppm del tensioactivo Kineti[®].

Plantas de pimientos en la segunda etapa de pares de hojas (variedad 'California Wonder') fueron infestadas con aproximadamente 40 áfidos criados en

laboratorio colocando secciones infestadas de hojas en la copa de las plantas de ensayo. Las secciones de hojas fueron quitadas al cabo de 24 horas. Las hojas de las plantas intactas fueron sumergidas en soluciones gradientes del compuesto de ensayo, y se las dejó secar. Las plantas de ensayo se mantuvieron bajo luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) a unos 25° C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas control, fue determinada al cabo de 5 días.

En este ensayo, los compuestos Nos. 1, 2, 3, 5, 12, 23, 29, 30, 31, 33, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, y 55 a 300 ppm mostraron una mortalidad de más del 85% en comparación con las plantas control no tratadas.

Áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

Los compuestos activos fueron formulados en acetona:agua 50:50 y 100 ppm del tensioactivo Kineti[®].

Las plantas de algodón, que se hallaban en la etapa del cotiledón (variedad 'Delta Pine', una planta por maceta), fueron infestadas colocando una gran hoja gravemente infestada por la colonia principal encima de cada cotiledón. Se permitió a los áfidos pasar a la planta hospedante durante la noche, y la hoja usada para transferir los áfidos fue quitada. Los cotiledones fueron sumergidos en la solución de ensayo y se los dejó secar. Al cabo de 5 días, se hizo el recuento de la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos Nos. 2, 3, 5, 6, 8, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, y 55, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de más del 85% en comparación con las plantas control no tratadas.

Áfido del poroto (*Aphis fabae*)

Los compuestos activos fueron formulados en acetona:agua 50:50 y 100 ppm del tensioactivo Kineti[®].

~~145~~
145

Plantas de berro (variedad 'Mixed Jewel') que habían crecido en Metro, mix en primera etapa de pares de hojas, fueron infestadas con aproximadamente 2-30 áfidos criados en laboratorio, colocando plantas cortadas e infestadas encima de las plantas de ensayo. Las plantas cortadas fueron quitadas al cabo de 24 horas. Cada planta fue sumergida en la solución de ensayo con el fin de dar cobertura completa al follaje, al tallo, a la superficie de semilla que pujaba por salir, y a la superficie cúbica circundante y se la dejó secar en la campana de humeado. Las plantas tratadas fueron conservadas a unos 25° C con luz fluorescente continua. La mortalidad de los áfidos fue determinada al cabo de 3 días.

En este ensayo, los compuestos Nos. 30, 38, 5, 6, 7, 8, 23, 29, 32, 33, 34, 35, 40, 41, 42 y 45, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de más del 85% en comparación con las plantas control no tratadas.

Mosca blanca de hoja plateada (*Bemisia argentifolii*)

Los compuestos activos fueron formulados en acetona:agua 50:50 y 100 ppm del tensioactivo Kineti[®].

Plantas de algodón seleccionadas fueron cultivadas hasta llegar a la etapa cotiledónea (una planta por maceta). Los cotiledones fueron sumergidos en la solución de ensayo para dar cobertura completa al follaje y colocados en un lugar bien ventilado para que se secaran. Cada maceta con una planta de semillero tratada fue colocada en una cubeta de plástico y se le introdujeron 10 a 12 moscas adultas (de aproximadamente 3 a 5 días de edad). Los insectos fueron recogidos usando un aspirador y un tubo Tygon[®] no tóxico de 0,6 cm (R-3603), conectado a la punta de una pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recogidos, fue entonces insertada suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, permitiéndose a los insectos que salieran fuera de la punta para alcanzar el follaje a fin de alimentarse. Las cubetas fueron cubiertas con una tapa de criba reusable (criba de poliéster con malla de 150 micrones PeCap de Tetko Inc.). Las plantas de ensayo fueron mantenidas en la habitación donde se las guardaba a unos 25°

C y 20 a 40% de humedad durante 3 días, evitándose la exposición directa a la luz fluorescente (24 fotoperíodos) a fin de impedir que dentro de la cubeta se acumulara calor. La mortalidad fue evaluada 3 días después del tratamiento de las plantas.

En este ensayo, los compuestos Nos. 5 y 42, a 300 ppm, dieron prueba de una mortalidad de más del 70% en comparación con las plantas control no tratadas.

Gorgojo araña de dos manchas (*Tetranychus urticae*, cepa resistente a OP)

Plantas de porotos sieva lima (variedad 'Henderson') con hojas primarias que se habían expandido hasta los 7-12 cm, fueron infestadas colocando sobre cada una de ellas un pequeño trozo de una hoja infestada (con unos 100 gorgojos) sacada de la colonia principal. Esto fue hecho dos horas antes del tratamiento para permitir a los gorgojos que pasaran a la planta para depositar sus huevos. El trozo de hoja usado para transferir los gorgojos fue quitado. Las plantas recién infestadas fueron sumergidas en la solución de ensayo y se las dejó secar. Las plantas de ensayo fueron mantenidas bajo luz fluorescente (24 horas de fotoperíodo) a unos 25° C y 20-40% de humedad relativa. Al cabo de 5 días, se retiró una hoja y se hizo el recuento de la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos Nos. 8 y 30, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de más del 75% en comparación con las plantas bajo control no tratadas.

Hormiga carpintero de Florida (*Camponotus floridanus*)

Los ensayos se realizaron en placas de Petri. A las hormigas se les dio una fuente de agua y luego se las privó de fuente de alimento por 24 horas. Se prepararon cebos con una solución de 20% de miel/agua. Una solución del ingrediente activo en acetona fue adicionada para alcanzar una concentración del ingrediente activo de 1% en peso (w/w). 0,2 ml del ingrediente activo que contenía la solución miel/agua, colocados en una tapa, fueron adicionados a cada placa.

~~167~~
167

Las placas fueron cubiertas y mantenidas a una temperatura del agua de 22° C. Las hormigas fueron observadas diariamente para comprobar la mortalidad habida. La mortalidad fue determinada al cabo de diez días.

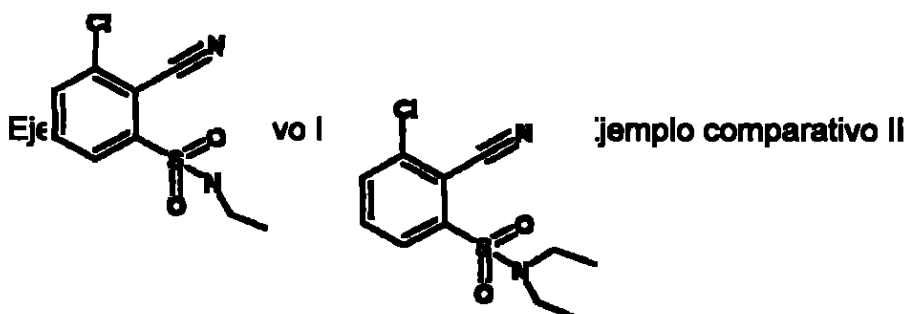
En estos ensayos, los compuestos Nos. 66, 78 y 79 mostraron una mortalidad de más del 85% en comparación con las plantas control no tratadas.

Hormigas argentinas (*Linepithema humile*)

- a) Los ensayos se realizaron en placas de Petri. A las hormigas se les dio una fuente de agua y luego se las privó de fuente de alimento por 24 horas. Se prepararon cebos con una solución de 20% de miel/agua. Una solución del ingrediente activo en acetona fue adicionada para alcanzar una concentración del ingrediente activo de 1% en peso (w/w). 0,2 ml del ingrediente activo que contenía la solución miel/agua, colocados en una tapa, fueron adicionados a cada placa. Las placas fueron cubiertas y mantenidas a una temperatura del agua de 22° C. Las hormigas fueron observadas diariamente para comprobar la mortalidad habida. La mortalidad fue determinada al cabo de diez días.

En estos ensayos, los compuestos Nos. 66, 78 y 79 mostraron una mortalidad del 100% en comparación con las plantas control no tratadas.

- b) Los ensayos se llevaron a cabo como en el ejemplo a). Se utilizaron los siguientes compuestos I y II de acuerdo con EP 33984 como ejemplos comparativos. Se observaron las hormigas para comprobar la mortalidad después de 6 días. Los resultados se muestran en la Tabla 3.



~~AE~~
148

Tabla: 3: bioactividad contra hormigas argentinas, *Linepithema humile*

Tratamiento	% ai ¹⁾ (p/p)	Mortalidad % acumulativo medio 6 días después del tratamiento ²⁾
Compuesto N° 66	1,0	100,0
Ejemplo comparativo I	1,0	35,6
Ejemplo comparativo II	1,0	35,6
Control ²⁾	Na	17,8

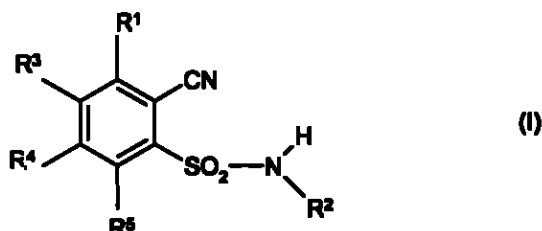
¹⁾ % de ingrediente activo

²⁾ cada media se basa en 45 hormigas (3replicaciones/tratamiento)

~~SECRET~~
169

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de 2-ciano-bencenosulfonamida caracterizado porque tiene la fórmula general I



en la que

- R¹** es alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ ó haloalcoxi-C₁-C₄;
- R²** es hidrógeno, alquilo-C₁-C₈, alquenilo-C₂-C₈, alquinilo-C₂-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, o alcoxi-C₁-C₄, en el que los cinco radicales mencionados en último término pueden estar no sustituidos, halogenados parcial o totalmente y/o portar uno, dos o tres radicales seleccionados de entre el grupo compuesto por alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfinilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, ciano, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, cicloalquilo-C₃-C₈, y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o totalmente halogenado y/o que porte uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de entre el grupo compuesto por alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄; y
- R³, R⁴ y R⁵**, independientemente el uno del otro, están seleccionados de entre el grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfinilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alquenilo-C₂-C₈, alquinilo-C₂-C₈, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, amino, (alquil-C₁-

~~SECRET~~
150

C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, aminocarbonilo, (alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo y di(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo;

y/o sus sales aceptables en agricultura.

2. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado** porque en la fórmula I R¹ es alquilo-C₁-C₂ o alcoxi-C₁-C₂.

3. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, **caracterizado** porque en la fórmula I R¹ es metilo.

4. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, **caracterizado** porque en la fórmula I R¹ es metoxi.

5. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado** porque en la fórmula I R¹ es haloalcoxi-C₁-C₄.

6. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 5, **caracterizado** porque en la fórmula I R¹ es haloalcoxi-C₁, en particular difluorometoxi.

7. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado** porque en la fórmula I R² está seleccionado de entre el grupo compuesto por hidrógeno, un radical hidrocarburo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio-alquilo-C₁-C₄, y alquínilo-C₂-C₄.

8. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 5, **caracterizado** porque en la fórmula I R² es hidrógeno, metilo, etilo, 1-metiletilo, o

prop-2-in-1-ilo.

9. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado** porque en la fórmula I por lo menos uno de los radicales R^3 , R^4 y R^5 es distinto de hidrógeno.

10. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 9, **caracterizado** porque R^3 es halógeno.

11. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, **caracterizado** porque en la fórmula I los radicales R^3 , R^4 o R^5 representan hidrógeno.

12. Una composición agrícola **caracterizada** porque comprende una cantidad tal de por lo menos un compuesto de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de I útil en agricultura tal como se lo define en la reivindicación 1 y por lo menos un portador inerte aceptable en agronomía, líquido y/o sólido, que tenga acción plaguicida, y, si se lo desea, por lo menos un tensioactivo.

13. Un método para combatir plagas animales **caracterizado** porque comprende poner en contacto con las plagas animales, su habitat, su campo de reproducción, fuente de alimento, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en los que las plagas animales crezcan o puedan crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que han de protegerse de ataques o infestación animales, con una cantidad eficaz como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de éste, que sea aceptable en agricultura.

14. Un método tal como se lo define en la reivindicación 13, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los homópteros.
15. Un método tal como se lo define en la reivindicación 13, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los himenópteros.
16. Un método tal como se lo define en la reivindicación 13, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los tisanópteros.
17. Un método para proteger cosechas del ataque o de la infestación por plagas animales, caracterizado porque comprende poner una cosecha en contacto con una cantidad eficaz como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de ese compuesto, tal como se la define en la reivindicación 1.

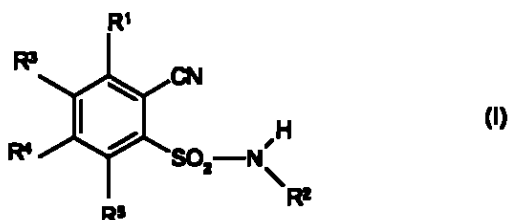
WPCL0361/ID-4392

RESUMEN

2-CIANOBOENCENOSULFONAMIDAS PARA COMBATIR PLAGAS

ANIMALES

Compuestos de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula I



en la que las variables R¹ a R⁵ son como se las define en la reivindicación 1, y/o a sus sales útiles en agricultura.

Además:

- al uso de compuestos I y/o a sus sales, para combatir plagas animales;
- a composiciones agrícolas que comprenden una cantidad tal de por lo menos un compuesto de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de I que sea útil en agricultura, y por lo menos a un portador inerte agronómicamente aceptable, líquido y/o sólido, que tenga acción plaguicida y, si se lo desea, por lo menos un tensioactivo; y
- a un método para combatir plagas animales, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, su campo de reproducción, fuente de alimentos, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el que las plagas animales crezcan o puedan crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que han

~~152~~
~~150~~
154

de protegerse de los ataques o de la infestación por animales, con una cantidad eficaz como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de ese compuesto que sea aceptable en agricultura.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP2004/011004

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07C311/16 C07C311/29 A01N41/06

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07C 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, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	FR 2 179 985 A (DU PONT DE NEMOURS AND CY,US; DU PONT DE NEMOURS AND CY) 23 November 1973 (1973-11-23) page 14; example 5	1,7,9, 11,12
X	US 3 997 603 A (MARTIN ET AL) 14 December 1976 (1976-12-14) example 5	1,7-9, 11,12
X	EP 0 033 984 A (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.V) 19 August 1981 (1981-08-19) cited in the application compounds 21,22	1-17
A	EP 0 778 267 A (OTSUKA KAGAKU KABUSHIKI KAISHA) 11 June 1997 (1997-06-11) the whole document	1-17

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

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 February 2005

Date of mailing of the international search report

23/02/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. 5818 Potsdamer 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 631 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-8016

Authorized officer

Österle, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/011004

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
FR 2179985	A	23-11-1973	US 3888897 A	10-06-1975
			AR 197132 A1	15-03-1974
			AU 5419673 A	10-10-1974
			FR 2179985 A1	23-11-1973
			GB 1421811 A	21-01-1976
			IT 981616 B	10-10-1974
			JP 49007428 A	23-01-1974
			US 3997603 A	14-12-1976
US 3997603	A	14-12-1976	US 3888897 A	10-06-1975
			AR 197132 A1	15-03-1974
			AU 5419673 A	10-10-1974
			FR 2179985 A1	23-11-1973
			GB 1421811 A	21-01-1976
			IT 981616 B	10-10-1974
			JP 49007428 A	23-01-1974
EP 0033984	A	19-08-1981	AR 226871 A1	31-08-1982
			AT 7787 T	15-06-1984
			AU 6636081 A	30-07-1981
			BR 8100281 A	04-08-1981
			CA 1167043 A1	08-05-1984
			CS 219348 B2	25-03-1983
			DD 157071 A5	13-10-1982
			DE 3162624 D1	12-07-1984
			DK 24181 A	24-07-1981
			EP 0033984 A1	19-08-1981
			ES 8200654 A1	01-02-1982
			ES 8201965 A1	01-04-1982
			GR 72782 A1	05-12-1983
			HU 186379 B	29-07-1985
			IE 50835 B1	23-07-1986
			IL 61942 A	29-11-1985
			JP 56120664 A	22-09-1981
			NZ 196046 A	12-04-1983
			PL 229285 A1	13-04-1982
			RO 81451 A1	02-04-1984
			SU 1093247 A3	15-05-1984
			US 4379157 A	05-04-1983
			YU 14981 A1	31-10-1983
			ZA 8100382 A	24-02-1982
EP 0778267	A	11-06-1997	EP 0778267 A1	11-06-1997
			WO 9700857 A1	09-01-1997
			JP 9227501 A	02-09-1997

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference m44238-PCT	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/PEA416	
International application No. PCT/EP2004/011004	International filing date (day/month/year) 01.10.2004	Priority date (day/month/year) 02.10.2003
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07C311/16, C07C311/29, A01N41/08		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		
1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☒ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of 3 sheets, as follows: ☒ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 807 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in Item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (Indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).		
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the opinion ☐ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement ☐ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application		
Date of submission of the demand 27.07.2005	Date of completion of this report 27.12.2005	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80389 Munich Tel. +49 89 2369 - 0 Fax: 523656 epnu d Fax: +49 89 2369 - 4465	Authorized Officer Österle, C Telephone No. +49 89 2369-8120 	

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2004/011004

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.
- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language, which is the language of a translation furnished for the purposes of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
2. With regard to the elements* of the international application, this report is based on *(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)*.

Description, Pages

1-61 as originally filed

Claims, Numbers

1-18 filed with telefax on 28.07.2005

- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages
- ☐ the claims, Nos.
- ☐ the drawings, sheets/figs
- ☐ the sequence listing (specify):
- ☐ any table(s) related to sequence listing (specify):

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages
- ☐ the claims, Nos.
- ☐ the drawings, sheets/figs
- ☐ the sequence listing (specify):
- ☐ any table(s) related to sequence listing (specify):

* If item 4 applies, some or all of these sheets may be marked "superseded."

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2004/011004

22
159

Box No. 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	1-17
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	1-17
	No: Claims	
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-17
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

Re item V

**Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;
citations and explanations supporting such statement**

D1: FR-A-2 179 985 (DU PONT DE NEMOURS AND CY,US; DU PONT DE NEMOURS AND CY) 23 November 1973 (1973-11-23)

D2: US-A-3 997 603 (MARTIN ET AL) 14 December 1976 (1976-12-14)

D3: EP-A-0 033 984 (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.V) 19 August 1981 (1981-08-19)

1. Novelty (Article 33(2) PCT):

- 1.1 The compound of example 1 of D1 and example 5 of D5 have been excluded from the subject-matter of the present claims by disclaimer.

Compounds 21 and 22 of D3 differ from the compounds of the present invention in that the amine group of the sulfonamide is bisubstituted.

The subject-matter of present compound claims 1-12 therefore is considered novel.

- 1.2 The subject-matter of claims 13-18 relating to compositions comprising said compound as well as methods using said compounds then can be considered novel as well.

2. Inventive Step (Article 33(3) PCT):

- 2.1 D1 and D2 disclose compounds which are structurally related to compounds of present claim 1. The compounds of D1 and D2 however are used as herbicides. Since the present compounds are used as pesticides, D1 and D2 are not relevant for the assessment of inventive step of the present claims.
- 2.2 D3 discloses compounds which are structurally related to compounds of present claim 1 and are used as pesticides, in particular as aphicides. In particular compounds 21 and 22 differ from the compounds of the present invention only in that

the amine group of the sulfonamide is bisubstituted.

Applicant has supplied experimental data comparing the compounds of D3 (examples 21 and 22) to the compounds of the present invention. The data shows that the claimed compounds have superior pesticidal properties.

The technical problem then can be formulated as the provision of compounds with improved pesticidal properties.

The compounds for which this effect has been shown as well as compounds which are close analogues thereof therefore can be considered inventive over D3.

2.3 Substituents R3-R5 of the tested compounds showing the desired pesticidal activity all are defined as hydrogen or halogen.

In present claims 1-10 the substituents R3-R5 can be any one of a large selection of different substituents. From the data disclosed in the present description one cannot assume that all compounds defined in claims 1-10 will have the desired activity. This is particularly important in view of the fact that the structural difference between some compounds falling within the subject-matter of claims 1-10 will be far greater than the structural difference between for example compound 66 and comparative examples I and II.

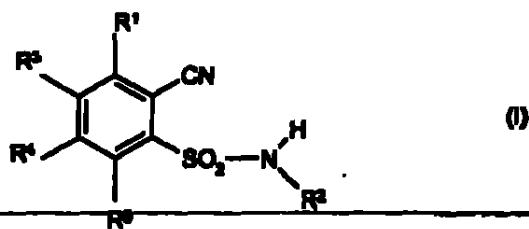
The subject-matter of claims 1-17 therefore are considered to lack inventive activity.

3. Industrial Applicability (Article 33(4) PCT):

The subject-matter of claims 1-17 is industrially applicable.

We claim:

1. A 2-cyanobenzenesulfonamide compound of the general formula I



where

- 10 R^1 is C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_4 -alkoxy or C_1-C_4 -haloalkoxy;
- 15 R^2 is hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkinyl, C_2-C_6 -cycloalkyl or C_1-C_4 -alkoxy, wherein the five last-mentioned radicals may be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or may carry one, two, or three radicals selected from the group consisting of C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylsulfinyl, C_1-C_4 -alkylsulfonyl, C_1-C_4 -haloalkoxy, C_1-C_4 -haloalkylthio, C_1-C_4 -alkoxycarbonyl, cyano, amino, $(C_1-C_4$ -alkyl)amino, di- $(C_1-C_4$ -alkyl)amino, C_2-C_6 -cycloalkyl and phenyl, it being possible for phenyl to be unsubstituted, partially or fully halogenated and/or to carry one, two or three substituents selected from the group consisting of C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -haloalkoxy; and
- 20 R^3 , R^4 and R^5 are independently of one another selected from the group consisting of hydrogen, halogen, cyano, nitro, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_4 -haloalkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylsulfinyl, C_1-C_4 -alkylsulfonyl, C_1-C_4 -haloalkoxy, C_1-C_4 -haloalkylthio, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkinyl, C_1-C_4 -alkoxycarbonyl, amino, $(C_1-C_4$ -alkyl)amino, di- $(C_1-C_4$ -alkyl)amino, aminocarbonyl, $(C_1-C_4$ -alkyl)aminocarbonyl and di- $(C_1-C_4$ -alkyl)aminocarbonyl;
- 25 and/or the agriculturally useful salts thereof, except for 5-bromo-2-cyano-3,6-dipropylbenzene sulfonamide.
- 30 2. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^1 is C_1-C_2 -alkyl or C_1-C_2 -alkoxy.
- 35 3. A compound as claimed in claim 2 wherein in formula I R^1 is methyl.
4. A compound as claimed in claim 2 wherein in formula I R^1 is methoxy.

5. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^1 is C_1 - C_4 -haloalkoxy.
6. A compound as claimed in claim 5 wherein in formula I R^1 is C_1 -haloalkoxy, in particular difluoromethoxy.
- 5 7. A compound as claimed in claim 1 wherein in formula I R^2 is selected from the group consisting of hydrogen, a hydrocarbon radical having from 1 to 4 carbon atoms, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl and C_2 - C_4 -alkynyl.
- 10 8. A compound as claimed in claim 5 wherein R^2 is hydrogen, methyl, ethyl, 1-methylethyl, or prop-2-yn-1-yl.
9. A compound as claimed in claim 1 where in formula I at least one of the radicals R^3 , R^4 and R^5 is different from hydrogen.
- 15 10. A compound as claimed in claim 9 where R^3 is halogen.
11. A compound as claimed in claim 10, where R^4 and R^5 are hydrogen. ✓
- 20 12. A compound as claimed in claim 1 where in formula I the radicals R^3 , R^4 or R^5 represent hydrogen.
13. An agricultural composition comprising such an amount of at least one compound of the general formula I and/or at least one agriculturally useful salt of I as defined in claim 1 and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant.
- 25 14. A method of combating animal pests which comprises contacting the animal pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material or environment in which the animal pests are growing or may grow, or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from animal attack or infestation with a pesticidally effective amount of at least one 2-cyano-benzenesulfonamide compound of the general formula I and/or at least one agriculturally acceptable salt thereof.
- 30 15. A method as defined in claim 14 where the animal pest is from the order Homoptera.
- 35 16. A method as defined in claim 14 where the animal pest is from the order Hymenoptera.
- 40 17. A method as defined in claim 14 where the animal pest is from the order Thysanoptera.

29
164

64

18. A method for protecting crops from attack or infestation by animal pests which comprises contacting a crop with a pesticidally effective amount of at least one 2-cyano-benzenesulfonamide compound of the general formula I and/or at least one salt thereof as defined in claim 1.

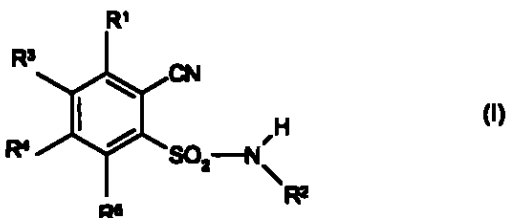
REIVINDICACIONES MODIFICADAS

PARA EFECTUAR

EXAMEN DE PATENTABILIDAD

REIVINDICACIONES (ANEXOS DEL IPRP)

1. Un compuesto de 2-ciano-bencenosulfonamida caracterizado porque tiene la fórmula general I



en la que

- R¹ es alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ ó haloalcoxi-C₁-C₄;
- R² es hidrógeno, alquilo-C₁-C₈, alqueno-C₂-C₈, alquino-C₂-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, o alcoxi-C₁-C₄, en el que los cinco radicales mencionados en último término pueden estar no sustituidos, halogenados parcial o totalmente y/o portar uno, dos o tres radicales seleccionados de entre el grupo compuesto por alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfinilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, ciano, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, cicloalquilo-C₃-C₈, y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o totalmente halogenado y/o que porte uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de entre el grupo compuesto por alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄; y
- R³, R⁴ y R⁵, independientemente el uno del otro, están seleccionados de entre

el grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₈, cicloalquilo-C₃-C₈, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfinilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alquenilo-C₂-C₈, alquinilo-C₂-C₈, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, aminocarbonilo, (alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo y di(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo;

y/o sus sales aceptables en agricultura.

2. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es alquilo-C₁-C₂ o alcoxi-C₁-C₂.

3. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es metilo.

4. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es metoxi.

5. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es haloalcoxi-C₁-C₄.

6. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 5, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es haloalcoxi-C₁, en particular difluorometoxi.

7. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1,

caracterizado porque en la fórmula I R^2 está seleccionado de entre el grupo compuesto por hidrógeno, un radical hidrocarburo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi- C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_4 , alquil- C_1-C_4 -tio-alquilo- C_1-C_4 , y alquínilo- C_2-C_4 .

8. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 5, caracterizado porque en la fórmula I R^2 es hidrógeno, metilo, etilo, 1-metiletilo, o prop-2-in-1-ilo.

9. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I por lo menos uno de los radicales R^3 , R^4 y R^5 es distinto de hidrógeno.

10. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 9, caracterizado porque R^3 es halógeno.

11. Un compuesto tal como se reivindica en la reivindicación 10 en donde R^4 y R^5 son hidrógeno.

12. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I los radicales R^3 , R^4 o R^5 representan hidrógeno.

13. Una composición agrícola caracterizada porque comprende una cantidad tal de por lo menos un compuesto de la fórmula general I y/o por lo

menos una sal de I útil en agricultura tal como se lo define en la reivindicación 1 y por lo menos un portador Inerte aceptable en agronomía, líquido y/o sólido, que tenga acción plaguicida, y, si se lo desea, por lo menos un tensioactivo.

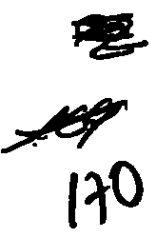
14. Un método para combatir plagas animales caracterizado porque comprende poner en contacto con las plagas animales, su habitat, su campo de reproducción, fuente de alimento, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en los que las plagas animales crezcan o puedan crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que han de protegerse de ataques o infestación animales, con una cantidad eficaz como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de éste, que sea aceptable en agricultura.

15. Un método tal como se lo define en la reivindicación 14, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los homópteros.

16. Un método tal como se lo define en la reivindicación 14, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los himenópteros.

17. Un método tal como se lo define en la reivindicación 14, caracterizado porque la plaga animal es del orden de los tisanópteros.

18. Un método para proteger cosechas del ataque o de la infestación por plagas animales, caracterizado porque comprende poner una cosecha en

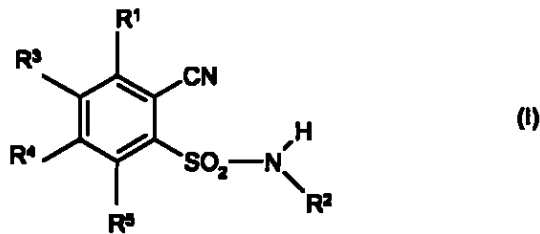

contacto con una cantidad eficaz como plaguicida de por lo menos un compuesto de 2-cianobencenosulfonamida de la fórmula general I y/o por lo menos una sal de ese compuesto, tal como se la define en la reivindicación 1.

WPCL0361/ID-4392

PC Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCTd3	
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07C 311/18	
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BASF AKTIENGESELLSCHAFT	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad 60/507.507	(32) Fecha 02-10-2003	(33) País US
		(72) Inventor(es) WOLFGANG VON DEYN ERNST BAUMANN MICHAEL HOFMAN Y OTROS	
		(74) Apoderado: EMILIO FERRERO	
(85) Fecha límite inicio fase nacional: 31-03-2006		(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 21-04-2005	
Fecha de presentación de la solicitud: 01/10/2004		N° publicación: WO 2005/035486 A1	
No. de solicitud: PCT/EP2004/011004			
(54) Título: 2-CIANO BENCENOSULFONAMIDAS PARA COMBATIR PLAGAS ANIMALES			

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de 2-ciano-bencenosulfonamida caracterizado porque tiene la fórmula general I



en la que

R¹ es alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ ó haloalcoxi-C₁-C₄;

R² es hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, o alcoxi-C₁-C₄, en el que los cinco radicales mencionados en último término pueden estar no sustituidos, halogenados parcial o totalmente y/o portar uno, dos o tres radicales seleccionados de entre el grupo compuesto por alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfínilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, ciano, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, cicloalquilo-C₃-C₆, y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o totalmente halogenado y/o que porte uno, dos o tres sustituyentes seleccionados de entre el grupo

compuesto por alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄; y

R³, R⁴ y R⁵, independientemente el uno del otro, están seleccionados de entre el grupo compuesto por hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, alquil-C₁-C₄-tio, alquil-C₁-C₄-sulfínilo, alquil-C₁-C₄-sulfonilo, haloalcoxi-C₁-C₄, haloalquil-C₁-C₄-tio, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, amino, (alquil-C₁-C₄)amino, di(alquil-C₁-C₄)amino, aminocarbonilo, (alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo y di(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo;

y/o sus sales aceptables en agricultura.

2. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es alquilo-C₁-C₂ o alcoxi-C₁-C₂.

3. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es metilo.

4. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 2, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es metoxi.

5. Un compuesto tal como se lo reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque en la fórmula I R¹ es haloalcoxi-C₁-C₄.



FORMATO DE DIGITALIZACI N
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Ingeniería de Software y Servicios

172

Expediente No		06032149	No de Follo
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	1	✓
10	OTROS:		

Observaciones: arte final

172
173

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 19,919
FECHA : MARZO 13 DE 2006

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 06032149 00000000 Folios: 172
Fecha (MM): 2006-03-31 17:58:24
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACT 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	030-00110-6	49933721	13/03/2006	38,686,520.00

***** C O N C E P T O *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	463,000.

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Qdo 00361-841-082-7



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 06032149 00000000
Fecha (MM): 2006-03-31 17:59:24
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

folios 172

174

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

PATENTE DE INVENCION ☒	MODELO DE UTILIDAD ☐	USUARIO ☐	RADICADOR ☐
-Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	☐	☐	☒
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	☐	☐	☒
-Descripción de la invención.	☐	☐	☒
-Dibujos de ser estos pertinentes.	☐	☐	☐
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	☐	☐	☒
COMPLETA ☐	INCOMPLETA ☐	☐	☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	☐	☐
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	☐	☐
-Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	☐	☐
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	☐	☐
COMPLETA ☐	INCOMPLETA ☐	☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	☐	☐
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	☐	☐
-Representación gráfica del Esquema Trazado.	☐	☐
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	☐	☐
COMPLETA ☐	INCOMPLETA ☐	☐

Firma Responsable:

Fecha:


MARZO 31 de 2006.

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

175

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	6 32149
	Solicitud internacional	EP2004/011004
	Fecha inicio fase nacional	02/05/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio No.	5648

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

1. 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 No.10 de 2001.



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

El anterior, requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 28 MAYO 2006
adpall

200506

..

●

●