



**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

**PCT**  
SOLICITUD

**PATENTE DE INVENCION**

**06-53415**

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

USO DE DERIVADOS DE N-ARILHIDRACINA PARA  
COMBATIR PESTES

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO  
C.C. 438,019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

**PETITORIO**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad. 06-053415- -00000-0000

Fec 2006-05-02 16:49:46 Dep 2020 NUECREACIONES

Tra. 11 PATENTE IYI

Eve 379 FASE NACIONAL II

Act 411 PRESENTACION

Folios 109

**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****SOLICITANTE  
(71)**Nombre **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**  
sociedad constituida y existente bajo las  
leyes de la República Federal de AlemaniaDirección Ludwigshafen- 67056  
República Federal de AlemaniaDomicilio 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@camyp.com](mailto:clientes@camyp.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,  
Neustadt- 67435  
República Federal de Alemania  
**3. David, G. KUHN**  
1208 Dalgavren Drive,  
Apex, Carolina del Norte- 27502,  
Estado Unidos de América  
**5. Christopher KORADIN**  
Scheibergarten 1,  
Stadtallendorf- 35260,  
República Federal de Alemania**2. Hassan OLOUMI-SADEGHI**  
12105 Pawley's Mill Circle,  
Raleigh, Carolina del Norte- 27614,  
Estados Unidos de América  
**4. Nigel ARMES**  
8001 Kukui Court,  
Raleigh, Carolina del Norte- 27613  
Estados Unidos de América**5****PCT (86)**Solicitud Internacional No. PCT/EP2004/013687Fecha: 2 de diciembre de 2004Publicación Internacional No. WO 2005/053403 A3Fecha: 16 de junio de 2005**6****Título (54)****USO DE DERIVADOS DE N-ARILHIDRACINA PARA COMBATIR PESTES****7****Clasificación Internacional (51) A01N 37/52****8****Prioridad**

(33) País de Ongen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐US4 de diciembre de 200360/526.609**9****Comprobante de pago No.: 06- 36,153****Fecha: 15 de mayo de 2006**

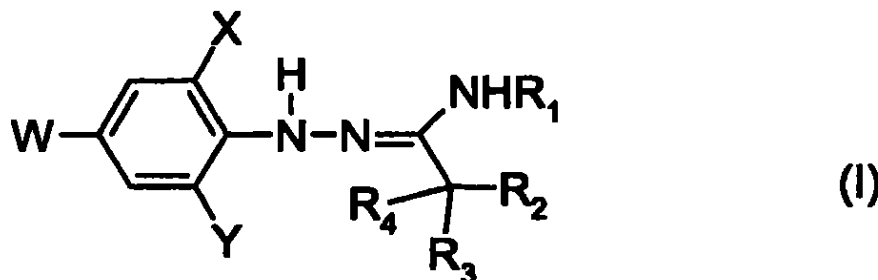
10

## An xos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000 oo.
- ☐ 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

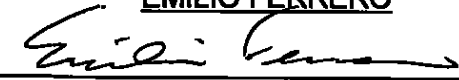
11

## FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERREROFIRMA: 

C.C. 438 019 de Usaquén T.P. 31 929

**DOCUMENTOS ANEXOS**

1. ☒ Publicación Internacional WO 2005/053403 A3

Descripción:

Páginas 24 en el idioma original

Páginas 40 en español

Reivindicaciones. Número (s) 14

Figuras. Número (s)

2. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE PRESENTARON MODIFICACIONES EN LA FASE INTERNACIONAL**

## REPRESENTACION Y PODER

Yo (nosotros) abajo firmado (s)  
BASF Aktiengesellschaft

domiciliado(s) en Ludwigshafen, República  
Federal de Alemania

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832 GONZALO PERDOMO, tpa. 831 ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519 y EMILIO FERRERO tpa. 31929 domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1° del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como nuestros representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos el representante principal, o el primero, o segundo suplente en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público o Cónsul de Colombia, en el extranjero y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso. Además, y bajo las mismas reglas, conferimos poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo(amos) a los dichos apoderados para que me(nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo concerniente a los siguientes asuntos a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales el registro de marcas de fábrica, colectivas defensivas y de servicios el depósito de nombres comerciales y enseñas su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos b) Las acciones de oposición, cancelación, nulidad, medidas cautelares, con cesión de licencias y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos acciones y juicios que promovamos o se nos promuevan Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir desistirse cancelar recibir renunciar y ratificar los actos hechos por agentes oficiosos.

Dado, firmado hoy 17 de marzo de 1989

en D-6700 Ludwigshafen

BASF Aktiengesellschaft

Firma  
ppa Welzel

(Für Patente, Modelle und Zeichnungen; Warenzeichen und Servicezeichen; Handelsnamen und -zeichen).

## VERTRETUNG UND VOLLMACHT

Ich (wir) unten Unterzeichnender (de)

BASF Aktiengesellschaft

wohnhaft in Ludwigshafen, Republica Federal de Alemania

verleihen durch dieses Schreiben an GERMAN CAVELIER, tpa. 832 GONZALO PERDOMO, tpa. 831 ERNESTO CAVELIER, tpa. 11519 und EMILIO FERRERO tpa. 31929 wohnhaft in der Carrera 4ª N° 72-38, Bogotá, Kolumbien, um die Verfügung des Absatzes 1 im Artikel 543 des Handelsgesetzbuch zu beachten, der erste als Hauptvertreter und die übrigen als Stellvertreter beziehungsweise als unsere Vertreter in allen was sich auf das industrielle Eigentum bezieht, berechtigt Meldungen zu empfangen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte zu ernennen. Der erste Stellvertreter wird den Hauptvertreter ersetzen wegen zeitweiliger oder definitiver Abwesenheit oder Hindernisses des ersten. Dieselbe Regel wird angewandt werden wenn der zweite Stellvertreter den ersten ersetzen muss, oder der dritte den zweiten. In solchen Fälle der Hauptvertreter oder der erste oder der zweite Stellvertreter beziehungsweise, oder beide, werden ihre Absicht aussprechen um nicht die Vertretung auszuüben mittelst Aussage notariell beglaubigt in Kolumbien, oder vor Notar oder vor einem anderen öffentlichen Beamten oder Kolumbianischen Konsul im Auslande und wenn es ein Hindernis sei, mittelst der betreffenden Beglaubigung. Wenn einer der Genannten immerfort abwesend wäre, der Folgende wird ihn ersetzen. Im Falle dass die Abwesenheit oder das Hindernis des Hauptvertreters, oder diejenigen seines ersten, zweiten oder dritten Vertreters, beziehungsweise, beendeten, einer oder anderen, ordnungsgemäss werden die Vertretung ausüben und sie werden befähigt sein auf Grund sie auszuüben, mit Aufheben zur Zeit der Abwesenheit der Vertretung durch den ersten, den zweiten oder den dritten Stellvertreter beziehungsweise. Ausserdem, und unter dieser Bedingung, verleihen den genannten Rechtsanwälten die Vollmacht, und um den Schutz meines (unseres) industriellen Eigentums zu erhalten, und gegen den unlauteren Wettbewerb zu diesem Zweck ich (wir) die genannten Bevollmächtigten ernenne(n) damit sie als vorbestimmten Institutionen oder Personen, die die Rechtsprechung ausüben oder nicht, vor allem vor denen mit Verwaltungs, streitigem Verwaltungs, und juristischem Charakter in allen was sich auf folgende Angelegenheiten bezieht, zu vertreten a) Erlangung von Patenten, Modellen und Zeichnungen Registrierung von Waren, Marken, Defensiv- und Servicezeichen Aufbewahrung von Handelsnamen- und zeichen ihre Erneuerung und Übertragung, Namen und Wohnsitzänderung, freiwillige Annullierung und die Registrierung von Vertragsskizzen b) Die Oppositionsklagen, Annullierung, Ungültigkeit, Vorsichtsmaßnahmen, Lizenzen und im allgemeinen die Zivil Straf Verwaltungs- oder streitigen Verwaltungsprozesse die mit diesen Rechten verbunden sind, Aktionen und Verhandlungen, die wir vorantreiben oder die man uns vorantreibt und c) damit sie in allen oben bestimmten Angelegenheiten dieses Mandat ersetzen, regeln, davon Abstand nehmen, annullieren, empfangen, verzichten, Meldungen annehmen und gerichtliche und aussergerichtliche Bevollmächtigte ernennen, und die Handlungen der halbamtlichen Vertreter bestätigen.

Unterzeichnet heute am 17 März 1989  
in D-6700 Ludwigshafen

Unterschrift  
ppa Richters



U R Nr 1407/89

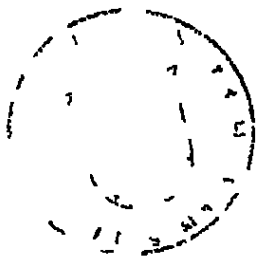
Ich beglaubige hiermit die Echtheit der vorstehend  
eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der für  
die Firma BASF Aktiengesellschaft Ludwigshafen am Rhein  
handelnden Herren

- 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-  
scheinige 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 Dr. Kohler

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors

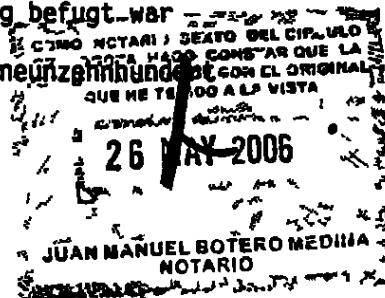
Thomas Walter

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

LIZ ARRIAGA DE REPER  
DUCTORA N. 1711  
Reducción No. 509 M. 1981



El suscrito Cónsul 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 Notar O. Thomas Walter con  
FOTOCOPIA CON LA VISTA DEL ORIGINAL  
----- es(son) su(s) representan-  
te(s) legal(es) en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad por el  
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 ABR 1989

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE

Por 405 6- del Law 8844

M-0077

Martha Niño de Stand  
Cónsul General de Colombia

Die konsularische Legalisierung ist notwendig

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO Según los artículos 65 del C de P C y 480 del C de  
Co si el poderdante es una sociedad el señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de  
su existencia que ejerce su objeto social que quien confiere el poder es su representante y puede otorgar  
poder seguidamente autenticar la firma de éste



COMO NO ARIU SEATO DEL CIRCULO  
DE BOGO A M GO CONSTAR QUE LA  
FOTOCOPIA CO I ID CON EL ORIGINAL  
QUE HE TENIDO A LA VISTA  
26 MAY 2016  
JUAN MANUEL BOTTA MEDINA  
NOTARIO

**MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES**  
**LEGALIZACIONES**  
 Bogotá, ~~12~~ **12** ~~ABR.~~ **ABR.** 1989 No. **8506**  
 HACE CONSTAR  
 Que el señor Martha Nino  
 cuyo firma esta en el presente documento, declara para el presente las funciones a la referida

[Signature]  
**MANUEL LOPEZ ACUÑA**  
 Jefe de Oficina

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO  
 DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA  
 FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL  
 QUE HE VISTO A LA VISTA  
**26 MAY 2006**  
**JUAN MANUEL LOPEZ ACUÑA**  
 NOTARIO

7

LA LAS INSTRUCCIONES GENERALES  
REQUIEREN QUE TODOS LOS

DEBEN ESTAR JUNTAS CON ALGUN VALOR, A

A CERO (0)

881051599854

16 013 01 000045 1  
RECIBO DE IMPUESTOS  
16 013 01 000045 1

|                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                 |                                                                          |              |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------|--------------------------------------------------------------------------|--------------|
| 1 Administración de Impuestos de                                                                                                                                                                                                                                 |                                 | Código                                                                   | 2 Teléfono   |
| BOGOTÁ                                                                                                                                                                                                                                                           |                                 | 03                                                                       | 2120100      |
| 3 Documento de identificación (marque X)                                                                                                                                                                                                                         |                                 | 4 Apellidos y Nombres o Razón Social de los payes (límite 80 caracteres) |              |
| CC o TI <input type="checkbox"/> C <input type="checkbox"/> NIT <input type="checkbox"/> A <input checked="" type="checkbox"/> Y No.                                                                                                                             | D.V. <input type="checkbox"/> 3 | CAVELIER ABOGADOS                                                        |              |
| CC o TI <input type="checkbox"/> C <input checked="" type="checkbox"/> NIT <input type="checkbox"/> A <input type="checkbox"/> No.                                                                                                                               | D.V. <input type="checkbox"/>   | 5 Apellidos y Nombres o Razón Social de los payes (límite 80 caracteres) |              |
| 19'301 629                                                                                                                                                                                                                                                       |                                 | FORERO ROCHA JAIME                                                       |              |
| 7 Dirección (de la persona o entidad identificada en la casilla 4)                                                                                                                                                                                               |                                 | Municipio                                                                | Departamento |
| Cra 4a. No 72-35                                                                                                                                                                                                                                                 |                                 | BOGOTÁ                                                                   | CUNDINAMARCA |
| 8 Relación oficial tipo(a) de documento(s), indicando número, fecha, valor y naturaleza de la transacción                                                                                                                                                        |                                 |                                                                          |              |
| TIMBRE TRADUCCION OFICIAL No 2048 DE ABRIL 26 DE 1999<br>PAGO DERECHOS TRADUCCION DE UN PODER<br>COLO 0361-52-218-8<br>REVISADO<br>SECCION DE NEGOCIOS GENERALES<br>ASUNTOS CONSULARES<br>RELACIONES EXTERIORES<br>MANUEL FORERO MEDINA<br>NOTARIO<br>6 MAR 2006 |                                 |                                                                          |              |

|                      |
|----------------------|
| Responsable del pago |
| Nombre               |
| CC. No. 19301629     |

|                            |    |     |
|----------------------------|----|-----|
| VALOR DEL IMPUESTO A PAGAR | VP | 750 |
| Categoría                  | VS | 0   |
| Impuesto de m...           | IM | 0   |
| IMPORTE A PAGAR (en pesos) | TP | 750 |



1 037  
750 00

CON PAGO

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 -

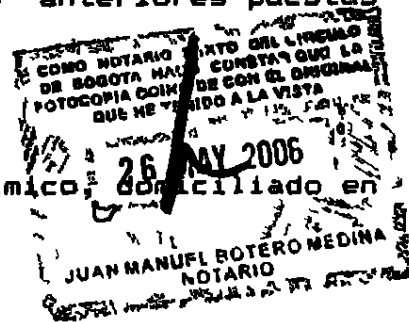
(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER GONZALO PERDOMO, ERNESTO CAVELIER y EMILIO FERRERO, domiciliados en la Cra 4 No 72-35 Bogotá, el 17 de marzo de 1989, por la sociedad BASF Aktiengesellschaft, domiciliada en Ludwigshafen RFA:)

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



Certifico, por haber tenido a la vista el registro de comercio HR B 3000, del juzgado de Ludwigshafen, que los doctores Wlzel 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 ante el 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 mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial

COMO NOTARIO SEXTO URL C RECUP  
DE BOGOTA, HAJO CONSTAR QUE LA  
FIRMA DEL DR. SIEGFRIED KOHLER  
QUE HA VISTO A LA VISTA  
20 MAR 1989  
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA  
NOTARIO

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

LUZ ARRIAGA DE HERBEN  
TRADUCCION INTERPRETE JURIA  
No 599 M I 16

El Presidente del Tribunal Regional

Fdn.: firma ilegible (sello redondo:)

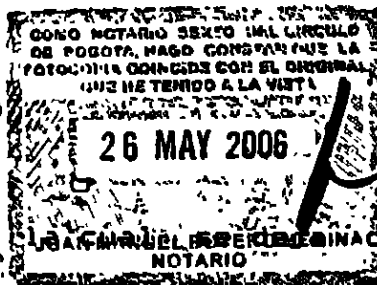
(Franz Serfas)

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

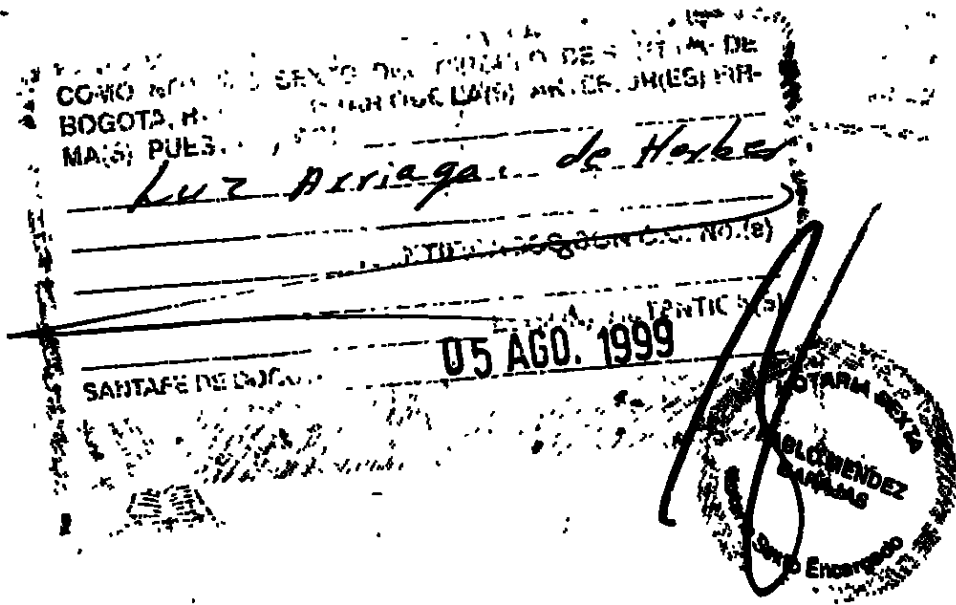


ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la copia, en  
los archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 26 de abril de 1989

LUZ ARRIAGA DE HERBEN  
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
Regulación No. 599 Ministerio

*Luz Arriaga de Herben*



**MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES**

**LEGALIZACIONES**

Bogotá 28 ABR 1983 No. 890

HACE CONSTAR

Que el señor WILFRED DE HERRERA  
 cuya firma aparece al pie del presente  
 documento, desempeñaba en esa fecha  
 las funciones allí indicadas.

COMO NOTARIO SE TO DE HCLM  
 RE COGOTA HAGO CONSTAR QUE LA  
 FOTOCOPIA CONCURRE CON EL ORIGINAL  
 QUE ME TENGO A LA VISTA

26 MAY 2008

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA  
 NOTARIO

General  
 Generales  
 División Consular  
 Encargado

RECEIVED  
 MAY 28 1983  
 DIVISION CONSULAR

**CAVELIER**

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 49 No 72 35  
BOGOTÁ 8 COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL CAVE

TELEFONO (57) (1) 2120100

CABLES CAVELEYES

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

£                      §                      ¶

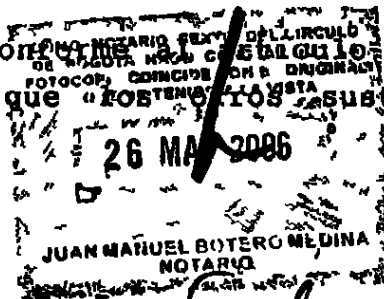
Poderdante    BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el    17-03-89

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente 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 con arreglo al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros requisitos faltan en este momento

Señor Jefe,



GERMAN CAVELIER

T P A No 832

C C No 2 877 924 de Bogota

Acepto

A handwritten signature of Emilio Ferrero.

EMILIO FERRERO

T P A No 31 929

C C No 438 019 de Usaquen

2e-780-2

DILIGENCIA DE AUTENTICACION DE FIRMA  
CON PRESENTACION PERSONAL

(Art 1º del Decreto 2282 de 1989)

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

quien exhibió la cedula de ciudadanía numero 43997  
expedida en VIAGUERA y la tarjeta profesional  
numero 31 929 del Ministerio de Justicia con  
el presente documento dirigido a D. A. HUARIN (N.º 2000000000)  
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 AUTENTICACION DE FIRMA  
CON PRESENTACION PERSONAL

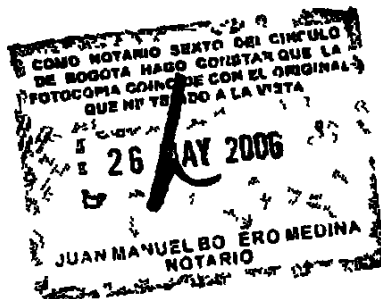
(Art 1º del Decreto 2282 de 1989)  
Ante el Notario Cincuenta (50) del Circulo de Santafé de  
Bogotá compareció el Doctor GERARDO GARCIA

quien exhibió la cedula de ciudadania numero 2872724  
expedida en 27 y la tarjeta profesional  
numero 637 del Ministerio de Justicia con  
el presente documento dirigido a División Nueva Creación  
y declaro que la firma que aparece en el es suya.

FIRMA AUTOGRAFA DEL DECLARANTE

Santafé de Bogotá, D. C. 01 OCT 1993

AUTORIZO LA ANTERIOR



**APOSTILLE**  
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

- 1 COUNTRY **UNITED STATES OF AMERICA**
- 2 This Public Document  
has been signed by HIPATIA POLANCO
- 3 acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS  
WILLIE L. COVINGTON, REGISTER OF DEEDS
- 4 bears the seal/stamp of COUNTY OF DURHAM, NORTH CAROLINA

**CERTIFIED**

- 5 at Raleigh, North Carolina
- 6 the 30TH DAY OF DECEMBER, 2004
- 7 by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
- 8 No 30469
- 9 Seal/Stamp



10. Signature

Clair S. Marshall

**CESION**

**ASSIGNMENT**

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

domiciliado(s) en

*Wolfgang von Deyn*  
*An der Bleiche 24, 67435 Neustadt*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*  
*Hassan Oloumi-Sadeghi*  
*12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614*  
*United States of America*  
*Citizen of United States of America*  
*David G. Kuhn*  
*1208 Dalgarn Drive, Apex, NC 27502*  
*United States of America*  
*Citizen of United States of America*  
*Nigel Armes*  
*8001 Kukui Court, Raleigh, NC 27613*  
*United States of America*  
*Citizen of United States of America*  
*Christopher Koradin*  
*Scheibelgarten 1, 35260 Stadtlendorf*  
*Germany*  
*Citizen of Germany*

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)  
inventor(es) de la invención.

state(s) under oath to be sole and true inventor(s) of the  
invention:

*The use of N-arylhydrazine derivatives for  
combating pests*

declaro(amos) así mismo que cedo(emos) y  
transfiero(erimos), sin limitación, a favor de la sociedad

state as well, that assign, without reservations or limitations  
in favour of

*BASF Aktiengesellschaft*

constituída y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with  
the laws of

*Germany*

domiciliada en

domiciled in

*67056 Ludwigshafen, Germany*

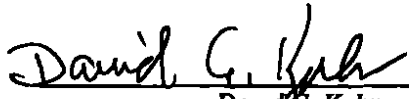
todos los derechos inherentes a dicha invención y que la  
citada Compañía queda facultada para solicitar en su  
nombre la patente correspondiente en la República de  
Colombia.

all rights inherent to said invention and that the above  
mentioned company hereby is enabled to apply, in its name,  
for the corresponding patent in the Republic of Colombia

12  
14

Dado y firmado hoy      Given and signed this  
Firma      Signature

  
\_\_\_\_\_  
Wolfgang von Deyn  
  
\_\_\_\_\_  
Hassan Oloumi-Sadeghi

  
\_\_\_\_\_  
David G. Kuhn

  
\_\_\_\_\_  
Nigel Armes

  
\_\_\_\_\_  
Christopher Koradin

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS  
WFFODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

14  
15

State of North Carolina )  
County of Durham ) ss.:

I, Deborah Martin, a Notary Public for said County and State, do hereby certify that **NIGEL ARMES** personally appeared before me this day and acknowledged the due execution of the foregoing instrument

Witness my hand and official seal  
this 30<sup>th</sup> day of November 2004.

Deborah Martin  
Signature of Notary Public

My Commission Expires 10-13-2009

STATE OF NORTH CAROLINA  
DURHAM COUNTY

CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT NOTARY  
PUBLIC WAS ACTING NOTARY AT TIME OF SIGNATURE

WILLIE L. COVINGTON, Register of Deeds

I, Hipatia Blanco, Deputy Register of Deeds of the aforesaid County and

State, do hereby certify that Deborah Martin was, at the time of signing the foregoing (or annexed) certificate, a duly commissioned and qualified Notary Public in and for the County of Durham, State of North Carolina, and as such full and faithful credit it is due to his official acts and further, that his signature thereto is in his own proper handwriting. IN TESTIMONY WHEREOF, I hereunto set my hand and seal of this office, this

the 9<sup>th</sup> day of December, 2004

WILLIE L. COVINGTON, Register of Deeds

By: Hipatia Blanco  
Deputy Register of Deeds

**State of North Carolina**           )  
                                                      ) ss.:  
**County of Durham**             )

I, Nicholas Martin, a Notary Public for said County and State, do hereby certify that **DAVID G. KUHN** personally appeared before me this day and acknowledged the due execution of the foregoing instrument.

Witness my hand and official seal  
this 30<sup>th</sup> day of November 2004.

Selma Marki  
Signature of Notary Public

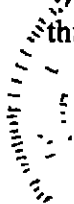
My Commission Expires 10-13-2009

16  
17

State of North Carolina     )  
                                                  ) ss.:  
County of Durham     )

I, Rehmat Wairhi , a Notary Public for said County and State, do  
hereby certify that **HASSAN OLOUMI-SADEGHI** personally appeared before me this day  
and acknowledged the due execution of the foregoing instrument.

Witness my hand and official seal  
this 30<sup>th</sup> day of November 2004.



Rehmat Wairhi  
Signature of Notary Public

My Commission Expires 10-13-2009

17  
18

TRADUCCIÓN OFICIAL NÚMERO 135/2006 AL ESPAÑOL DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN IDIOMA INGLÉS, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL, RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA DE COLOMBIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA.

CESION

Los abajo firmantes *Wolfgang von Deyn, An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania, ciudadano de Alemania;*

*-Hasan Oloumi-Sadeghi, 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614, Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América;*

*-Daid G. Kuhn, 1208 Dalgaven Drive, Apex, NC 27502 Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América;*

*-Nigel Armes, 8001 Kukui Court, Raleigh, NC 27613 Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América*

*-Christopher Koradin, Scheibelgarten 1, 35260 Stadthallendorf, Alemania, ciudadano de Alemania*

declaramos bajo juramento ser los inventores únicos y verdaderos de la invención **USO DE DERIVADOS DE N-ARILHIDRACINA PARA COMBATIR PESTES**, y declaramos asimismo que cedemos y transferimos sin limitación a favor de **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania, domiciliada en **67056, Ludwigshafen, Alemania** con todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia.

Dado y firmado hoy 25 de noviembre de 2004.

Firmado: HASSAN OLOUMI-SADEGHI, DAVID G. KUHN, Y NIGEL ARMES

18  
19

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE DURHAM

DECLARACIÓN JURADA

Yo, Deborah Martin, notario público para dicho condado y estado, certifico que NIGEL ARMES compareció personalmente hoy y reconoció haber firmado debidamente el documento precedente.

Atestiguo mediante mi firma y sello oficial hoy 30 de noviembre de 2004.

Firmado: DEBORAH MARTIN

Mi cargo vence el 13 de octubre de 2009.

SELLO: ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE DURHAM.

CERTIFICADO DE REGISTRO DE ESCRITURAS EN EL SENTIDO QUE EL NOTARIO PUBLICO ERA NOTARIO ENCARGADO AL MOMENTO DE LA FIRMA

WILLIE L COVINGTON, registrador de escrituras

Yo, HIPATIA POLANCO, registrador suplente de escrituras de dicho condado y estado, por el presente certifico que DEBORAH MARTIN, era al momento de firmar el certificado precedente, un notario público debidamente calificado y nombrado para el condado de Durham, estado de Carolina del Norte, y en su calidad debe darse pleno crédito a sus actos oficiales. Además que su firma está escrita en su caligrafía. En testimonio de lo cual, he firmado y sellado hoy 9 de diciembre de 2004.

WILLIE L. COVINGTON, registrador de escrituras

POR: HIPATIA POLANCO, registradora suplente de escrituras

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE DURHAM

DECLARACIÓN JURADA

Yo, Deborah Martin, notario público para dicho condado y estado, certifico que HASSAN OLOUMI-SADEGHI compareció

personalmente hoy y reconoció haber firmado debidamente el documento precedente.

Atestiguo mediante mi firma y sello oficial hoy 30 de noviembre de 2004.

Firmado: DEBORAH MARTIN:

Mi cargo vence el 13 de octubre de 2009

#### APOSTILLA

(CONVENCIÓN DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961)

1. PAÍS: ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA
2. ESTE DOCUMENTO PÚBLICO HA SIDO FIRMADO POR HIPATIA POLANCO
3. QUIEN ACTÚA EN CALIDAD DE REGISTRADORA SUPLENTE DE ESCRITURAS WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE ESCRITURAS
4. LLEVA EL SELLO/ESTAMPILLA DEL CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE

#### CERTIFICADO

5. EN RALEIGH, CAROLINA DEL NORTE
6. EL 30 DE DICIEMBRE DE 2004
7. POR EL SECRETARIO DE ESTADO SUPLENTE, ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE.
8. NÚMERO 30469
9. SELLO/ESTAMPILLA
10. FIRMA: ELAINE F. MARSHALL

COLO- 00361-841-109 8

WPCL002G ID 7812

Bogotá, 31 de mayo de 2006.

*Eduardo Calado*

Eduardo Calado Reguera  
 TRADUCTOR OFICIAL  
 INGLÉS - ESPAÑOL  
 Res. 541. Febrero de 1976

MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERIORES

451531  
*Edvardo Calado*  
COPIA FIRMADA EN EL  
DOCUMENTO QUE EMPENA  
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 JUN -1 A 11:55

*Uru*  
JEFE DE LEGATIZACIONES  
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE  
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE  
*Edvardo Calado*  
\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_  
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR  
EL( ELLOS) EN ESTA NOTARIA  
SANTAFE DE BOGOTA. 01 JUN 2006



CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

domiciliado(s) en

— Wolfgang von Deyn  
An der Bleiche 24, 67435 Neustadt  
Germany  
Citizen of Germany  
— Hassan Oloumi-Sadeghi  
12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614  
United States of America  
Citizen of United States of America  
— David G. Kuhn  
1208 Dalgarn Drive, Apex, NC 27502  
United States of America  
Citizen of United States of America  
— Nigel Armes  
8001 Kukui Court, Raleigh, NC 27613  
United States of America  
Citizen of United States of America  
— Christopher Koradin  
Scheibelgarten 1, 35260 Stadtlendorf  
Germany  
Citizen of Germany

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)  
inventor(es) de la invención:

state(s) under oath to be sole and true inventor(s) of the  
invention:

USO de derivados de N-ARYLhidrazina  
PARA COMBATIR PESTES

The use of N-arylhydrazine derivatives for  
combating pests

declaro(amos) así mismo que cedo(emos) y  
transfiero(emos), sin limitación, a favor de la sociedad

state as well, that assign, without reservations or limitations  
in favour of

BASF Aktiengesellschaft

BASF Aktiengesellschaft

constituida y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with  
the laws of

Alemania

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Alemania

67056 Ludwigshafen, Germany

todos los derechos inherentes a dicha invención y que la  
citada Compañía queda facultada para solicitar en su  
nombre la patente correspondiente en la República de  
Colombia

all rights inherent to said invention and that the above  
mentioned company hereby is enabled to apply, in its name,  
for the corresponding patent in the Republic of Colombia.

Dado y firmado hoy      Given and signed this      25. Nov. 2004  
Firma      Signature

  
Wolfgang von Deyn

  
Hassan Oloumi-Sadeghi

  
David G. Kuhn

  
Nigel Armes

  
Christopher Koradin

Notarization and legalized by means of Apostille

28  
23

Urk.R.Nr. 2882/2004

I, Ludwig Draxel-Fischer, notary public at Ludwigshafen/Rhine, Federal Republic of Germany, hereby testify and confirm that the foregoing signatures of

1. Mr. Wolfgang **von Deyn**, residing at An der Bleiche 24, 67435 Neustadt/Germany, personally known to me,
2. Mr. Christopher **Koradin**, residing at Scheibeltgarten 1, 35260 Stadtallendorf/Germany, personally known to me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 25<sup>th</sup> day of November, 2004



Notary Public

Wert: 5.112,92 Euro

25  
24

## APOSTILLE

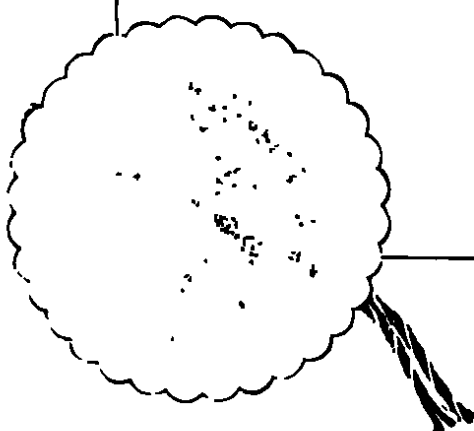
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland  
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar  
D r a x e l - F i s c h e r
3. in seiner Eigenschaft als  
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel  
des Notars Ludwig Draxel-Fischer  
in Ludwigshafen am Rhein

### Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 17. Dezember 2004
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1915-1918/04

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift  
Im Auftrag



.....  
(Christian Koneke)  
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:  
Gebühr 12,-- €

24  
25

**TRADUCCION OFICIAL No. 11387**

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

Traducción de las legalizaciones en alemán que se encuentran a continuación de un documento de cesión, escrito en español e inglés, por medio del cual los señores

- Wolfgang von Deyn  
An der Bleiche 24, 67435 Neustadt  
Alemania  
Ciudadano de Alemania  
- Hassan Otoumi-Sudeghi  
12105 Pawley 's Mill Circle, Raleigh, NC 27614  
United States of America  
Ciudadano de United States of America  
- David G Kuhn  
1208 Dalgaven Drive, Apex, NC 27502  
United States of America  
Ciudadano de United States of America  
- Nigel Armes  
8001 Kukui Court, Raleigh, NC 27613  
United States of America  
Ciudadano de United States of America  
- Christopher Koradin  
Scheibergarten 1, 3526Ö Stüdtallendorf  
Alemania  
Ciudadano de Alemania

declaran bajo juramento ser los únicos y verdaderos inventores de la invención

**Uso de derivados de N-arilhidrazina para combatir pestes**

y ceden sin limitación a la sociedad BASF Aktiengesellschaft, 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia. Hay dos firmas ilegibles de los señores von Deyn y Koradin. Dado y firmado el 25 de noviembre de 2004

**LUZ ARRIAGA DE HERBER**  
**TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL**  
  
Resolución No 599 Minjusticia

28  
26

Sigue. Autenticación notarial en inglés de las dos firmas antecedentes (individuo)  
por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, bajo el No.  
2882/2004 del 25 de noviembre de 2004. Fdo.: firma ilegible; hilo y oblea notarial.,  
Valor: 5.112,92 Euros

APÖSTILLE  
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 1. País: República Federal de Alemania  
Este documento público
- 2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer
- 3. Actuando en calidad de notario público
- 4. Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,  
notario de Ludwigshafen am Rhein

Certificado

- 5. en Frankenthal (Pfalz)
- 6. el 17 de diciembre de 2004
- 7. por el Presidente del Tribunal Regional
- 8. bajo el No 91 Eb – 1915-1918/04
- 9 Sello  
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

- 10. Firma  
Fdo.: firma ilegible  
(Christian Koneke)  
Juez Presidente del Tribunal Regional  
Costas.  
Derechos 12,00 €

28.11.2004  
013111  
2882/2004  
LUDWIG DRAXEL-FISCHER  
NOTARIO  
LUDWIGSHAFEN AM RHEIN  
PFLZ  
17.12.2004  
91 Eb – 1915-1918/04  
JUEZ PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL  
FRANKENTHAL  
PFLZ

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

Bogotá, 28 de mayo de 2006  
C 2001

LUZ ARRIAGA DE HERBER  
TRADUCTORA e INTERPRETE OFICIAL  
Resolución No 599 Minjusticia

MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERIORES

*Luz Arango*  
451528  
CUYA FIRMA APARECE EN EL  
DOCUMENTO QUE SE PONE A  
LAS FUNCIONES INDICADAS.

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO  
2006 JUN -1 A 11:55  
*Luz*  
JEFE DE DELEGACIONES  
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE  
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE  
*Luz Arango*  
*of. J. Arango*  
COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR  
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA  
SANTA FE DE BOGOTA.  
01 JUN 2006



TRADUCCIÓN OFICIAL NÚMERO 134/2006 AL ESPAÑOL DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN IDIOMA INGLÉS, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL, RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA DE COLOMBIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA.

CESION

Los abajo firmantes Wolfgang von Deyn, An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania, ciudadano de Alemania;

-Hasan Oloumi-Sadeghi, 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614, Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América;

-Daid G. Kuhn, 1208 Dalgarn Drive, Apex, NC 27502

Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América;

-Nigel Armes, 8001 Kukui Court, Raleigh, NC 27613

Estados Unidos de América, ciudadano de Estados Unidos de América

-Christopher Koradin, Scheibelgarten 1, 35260 Stadthallendorf, Alemania, ciudadano de Alemania

declaramos bajo juramento ser los inventores únicos y verdaderos de la invención **USO DE DERIVADOS DE N-ARILHIDRACINA PARA COMBATIR PESTES**, y declaramos asimismo que cedemos y transferimos sin limitación a favor de **BASF AKTIENGESELLSCHAFT**, constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania, domiciliada en **67056, Ludwigshafen, Alemania** con todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia.

Dado y firmado hoy 25 de noviembre de 2004.

Firmado: WOLFGANG VON DEYN y CHRISTOPHER KORADIN

URK R. NR. 2882/2004

706394  
Cognitive Psychology  
PSY 212

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 MAY 31 A 11:55

*UP*  
JEFE DE LEGALIZACIONES  
BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE  
RELACIONES EXTERIORES

451529  
*Edgardo Colorado*  
CUIA FIRMA ATRECE EN EL  
DOCUMENTO DESEMPENA  
LAS FUNCIONES INDICADAS



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

**(19) World Intellectual Property  
Organization  
International Bureau**

[illegible]

**(43) International Publication Date**  
**16 June 2005 (16.06.2005)**

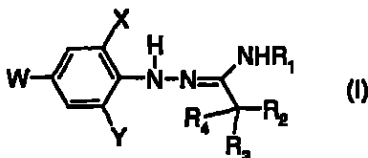
**PCT**

**(10) International Publication Number**  
**WO 2005/053403 A3**

- (51) International Patent Classification<sup>7</sup>: A01N 37/52
- (21) International Application Number:  
PCT/EP2004/013687
- (22) International Filing Date: 2 December 2004 (02.12.2004)
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data:  
60/526,609 4 December 2003 (04.12.2003) US
- (71) Applicant (for all designated States except US): BASF AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE], 67056 Ludwigshafen (DE)
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (for US only): VON DEYN, Wolfgang [DE/DE], An der Bleiche 24, 67435 Neustadt (DE) OLOUMI-SADEGHI, Hassan [US/US], 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614 (US) KUHN, David, G. [US/US], 1208 Dalgarven Drive, Apex, NC 27502 (US) ARMES, Nigel [US/US], 8001 Kuku Court, Raleigh, NC 27613 (US) KORADIN, Christopher [DE/DE], Riedlangstr 15, 67067 Ludwigshafen (DE)
- (74) Common Representative: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, 67056 Ludwigshafen (DE)
- (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, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, 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, SL, SZ, TZ, UG, TM, 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, IS, IT, LT, 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
- (88) Date of publication of the international search report:  
28 July 2005
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette

*For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette*

**(54) Title:** THE USE OF N-ARYLHYDRAZINE DERIVATTIVES FOR COMBATING NON-CROP PESTS



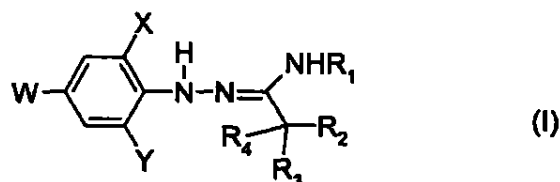
**(S7) Abstract:** Use of hydrazine derivatives of formula (I) wherein W is chlorine or trifluoromethyl, X and Y are each independently chlorine or bromine, R<sup>1</sup> is alkyl, alkenyl, alkynyl, or cycloalkyl which may be substituted with 1 to 3 halogen atoms, or alkyl which is substituted by alkoxy, R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are alkyl or may be taken together to form cycloalkyl which may be unsubstituted or substituted by 1 to 3 halogen atoms, R<sup>4</sup> is hydrogen or alkyl, or the enantiomers or salts thereof, for combating non-crop pests Use of compounds of formula (I) for the protection of non-living organic materials and for the protection of animals against non-crop pests

**WO 2005/053403 A3**

The use of N-arylhydrazine derivatives for combating pests

Description

5 The present invention relates to the use of hydrazine derivatives of formula I:



wherein

- W is chlorine or trifluoromethyl;
- 10 X and Y are each independently chlorine or bromine;
- R<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkynyl, or  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl which may be substituted with 1 to 3 halogen atoms, or  
15 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl which is substituted by C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy;
- R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or may be taken together to form C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl which may  
be unsubstituted or substituted by 1 to 3 halogen atoms;
- 20 R<sup>4</sup> is hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,
- or the enantiomers or salts thereof,
- for combating non-crop pests.
- 25 The invention also relates to a method for controlling non-crop pests comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breeding grounds or their locus with a pesticidally effective amount of a compound of formula I.
- 30 The invention also relates to compositions containing compounds of formula I for in pesticidally effective amounts for controlling non-crop pests.

The invention further relates to the use of compounds of formula I for the protection of non-living organic materials against non-crop pests

35

Typical problems arising with the use of presently available non-crop pest control agents such as pyrethroids are e.g. resistance of pests or unfavorable environmental or toxicological properties. Another problem encountered concerns the need to have available non-crop pest control agents which are effective against a broad spectrum of

non-crop pests. Accordingly, there is a need to provide new and improved non-crop pest control agents that overcome these problems.

5 It is therefore an object of the present invention to provide new non-crop pest control agents, preferably exhibiting an enhanced pesticidal spectrum of action.

We have found that these objects are achieved by use of compounds of formula I and compositions comprising them.

10 Non-crop pests are pests of the classes Chilopoda and Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes and Acaridida.

15 The compounds of the formula I are especially suitable for efficiently combating the following pests:

centipedes (Chilopoda), e.g. *Scutigera coleoptrata*,

20 millipedes (Diplopoda), e.g. *Narceus spp.*,

spiders (Araneida), e.g. *Latrodectus mactans*, and *Loxosceles reclusa*,

scabies (Acaridida): e.g. *Sarcoptes sp.*,

25 ticks and parasitic mites (Parasitiformes): ticks (Ixodida), e.g. *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* and parasitic mites (Mesostigmata), e.g. *Ornithonyssus bacoti* and *Dermanyssus gallinae*,

30 termites (Isoptera), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*, and *Coptotermes formosanus*,

35 cockroaches (Blattaria - Blattodea), e.g. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, and *Blatta orientalis*,

40 flies, mosquitoes (Diptera), e.g. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya*

- hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sencata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, and *Tabanus similis*,

Earwigs (Dermaptera), e.g. *forficula auricularia*,

- 15 true bugs (Hemiptera), e.g. *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius prolixus*, and *Arius critatus*,

- ants, bees, wasps, sawflies (Hymenoptera), e.g. *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomymex barbatus*, *Pogonomymex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, and *Linepithema humile*,

- 25 crickets, grasshoppers, locusts (Orthoptera), e.g. *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozelus vanegatus*, *Hieroglyphus deganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortocetes terminifera*, and *Locustana pardalina*,

- 35 fleas (Siphonaptera), e.g. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, and *Nosopsyllus fasciatus*,

silverfish, firebrat (Thysanura), e.g. *Lepisma saccharina* and *Thermobia domestica*,

- 40 lice (Phthiraptera), e.g. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* and *Solenopotes capillatus*.

The hydrazine derivatives of formula I which can be used according to the invention are known from and can be prepared according to preparation methods described or referenced in EP-A 604 798. This document relates to plant protection in the agricultural field and discloses the insecticidal and acaricidal activity of compounds of formula I and other compounds against crop pests of the Coleoptera, Lepidoptera and Acarina orders.

In J. A. Furch et al., "Amidrazones: A New Class of Coleopteran Insecticides", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc., 1998, Chapter 18, p. 178 ff, the use of certain amidrazones against southern corn rootworm is exemplified, some of which amidrazones are compounds of formula I. It is taught that these compounds target specifically certain coleopteran insects while being little toxic or non-toxic to Lepidoptera and other insects as well as to Acarina.

In D. G. Kuhn et al., "Cycloalkyl-substituted Amidrazones: A Novel Class of Insect Control Agents", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc., 1998, Chapter 19, p. 185 ff, it is taught that certain amidrazones, some of which amidrazones are compounds of formula I wherein  $R^2$  and  $R^3$  together form a cyclopropyl ring, are active against certain Coleopteran and Lepidoptera species. Biological tests show that the compounds are quite selective, only some exhibiting good activity against both Coleoptera or Lepidoptera.

Activity of a compound against pests for plant protection in the agricultural field, that is, against crop pests, does not generally suggest activity of that compound against non-crop pests. Crop pest control always is a part of plant protection. Non-crop pest control, on the contrary, e.g. relates to protection of non-living organic materials, or hygiene and disease prevention (public health).

The differences in requirements for crop / non-crop pest control generally and mainly – beside a possible difference in biochemical targets – emerge from the differences in the food and / or habitat of the pests.

Crop pests like that of the order Homoptera feed on the green parts of the plant by piercing them and sucking the plant liquids. Other crop pests of the Lepidoptera and Coleoptera order feed on the green parts of plants by biting off parts. On the contrary, non-crop pests do not live on plants and do not or only in rare occasions feed on the green parts of the plant. Non-crop pests e.g. feed on non-living organic materials such as the homes, clothing and the food etc of human beings and animals but also on electric wires etc thereby introducing pathogenic germs into the human being's environment and destroying their homes and food. An example is the termite (order Isoptera) that primarily feeds on cellulose which is the major component of wood and paper

products. Another example is the mosquito (order Diptera) whose larvae feed on microorganisms and organic matter in the water and whose adults feed on blood.

5 The properties of pesticides need to be adapted to their specific use. Systemic pesticides for example that by virtue of their water-solubility are introduced into the plant parts are suitable for controlling piercing-sucking or biting (i.e. crop) pests. However, they cannot generally be expected to show equal activity against non-crop pests who do not feed on the green plant parts but are controlled by mostly water-insoluble pesticides in baiting systems or by direct treatment. In many cases crop pest control pesticides are not suitable for non-crop pest controlling and vice versa. The market insecticides pirimicarb, acephate, pyrimidifen, and pyridaben are examples. They are active  
10 against crop insects but show low activity against non-crop pests.

15 Summing up, prior art teaches the artisan that amidrazones of formula I and of similar structure exhibit selective activity against certain crop pests of the orders Coleoptera or Lepidoptera and that small changes of the structure have a tremendous effect on selectivity.

20 Surprisingly, it has now been found that a certain group of amidrazones, namely the compounds of formula I, exhibit broad spectrum activity against non-crop pests.

The compounds of formula I and compositions containing them are especially useful for the control of pests of the classes Chilopoda and Diplopoda.

25 The compounds of formula I and compositions containing them are particularly useful for the control of pests from the orders Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, and Phthiraptera.

30 Furthermore, the compounds of formula I and compositions containing them are especially useful for the control of pests from the orders Parasitiformes, Araneida and Acaridida.

35 Moreover, the compounds of formula I and compositions containing them are especially useful for the control of pests from the orders Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera and Ixodida.

40 More particularly, the compounds of formula I and compositions containing them are especially useful for the control of pests from the orders Isoptera, Blattana (Blattodea), Diptera, Hymenoptera and Siphonaptera.

34  
35

In particular, the compounds of formula I and compositions containing them are useful for the control of Isoptera (*Hodotermitidae*, *Kalotermitidae*, *Rhinotermitidae*, *Termitidae*), Blattaria/Blattodea (*Cryptocercidae*, *Blattidae*, *Polyphagidae*, *Blattellidae*), Diptera (*Culicidae*, *Simuliidae*, *Ceratopogonidae*, *Tabanidae*, *Muscidae*, *Calliphoridae*,  
5 *Oestridae*, *Sarcophagidae*, *Hippoboscidae*), Hymenoptera (*Xyelidae*, *Argidae*, *Cimbicidae*, *Tenthredinidae*, *Anaxyelidae*, *Cephidae*, *Aphidiidae*, *Formicidae*, *Vespoidae*, *Sphecidae*), and Siphonaptera (*Pulicidae*, *Rhopalopsyllidae*, *Ceratophyllidae*)

Moreover, the use of the compounds of formula I and compositions containing them for  
10 combating pests of the Isoptera order is especially preferred.

The use of the compounds of formula I and compositions containing them for combat-  
ing pests of the Blattaria/Blattodea order is a further preferred embodiment of the pre-  
sent invention

15 Furthermore, the use of the compounds of formula I and compositions containing them for combating pests of the Hymenoptera order, especially ants, is especially preferred.

The use of the compounds of formula I and compositions containing them for combat-  
20 ing pests of the Diptera order, especially flies and mosquitoes, is a further preferred embodiment of the present invention.

Furthermore, the use of the compounds of formula I and compositions containing them  
for combating pests of the Orthoptera order, is especially preferred.

25 Moreover, the use of the compounds of formula I and compositions containing them for combating pests of the Siphonaptera is especially preferred.

The use of the compounds of formula I and compositions containing them for combat-  
30 ing pests of the Ixodida order, especially flies and mosquitoes, is a further preferred embodiment of the present invention.

Furthermore, the use of the compounds of formula I and compositions containing them  
for combating pests of the Mesostigmata order is a further preferred embodiment of the  
35 present invention

Besides, the use of the compounds of formula I and compositions containing them for  
combating pests of the Acandida order is a further preferred embodiment of the present  
invention.

40 In a preferred embodiment of the present invention, compounds of formula I and compositions containing them are used for the protection of non-living organic materials,

38  
36

including but are not limited to house-hold goods such as fats, oils, mono- oligo- or polyorganosaccharides, proteins, or fresh or decaying fruits; cellulose-containing materials e.g. wooden materials such as houses, trees, board fences, or sleepers and also paper; and also construction materials, furniture, leathers, animal, plant and synthetic fibers, vinyl articles, electric wires and cables as well as styrene foams.

More preferably, compounds of formula I and compositions containing them are used for the protection of non-living organic materials against non-crop pests selected from the group consisting of the class Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, and Thysanura.

The present invention also relates to a method for the protection of non-living organic materials against non-crop pests, preferably against non-crop pests selected from the group consisting of the class Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, and Thysanura, comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breeding grounds, their locus or the non-living organic materials themselves with a pesticidally effective amount of a compound of formula I or a composition containing it.

Moreover, compounds of formula 1 or compositions containing them are preferably used for protecting cellulose-containing non-living organic materials.

Preferably, compounds of formula 1 or compositions containing them are used for protecting cellulose-containing non-living organic materials against non-crop pests from the Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, and Orthoptera orders, most preferably the Isoptera orders

The present invention also provides a method for protecting cellulose-containing non-living organic materials against non-crop pests, preferably from the Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, and Orthoptera orders, most preferably the Isoptera orders, comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breeding grounds, their locus or the cellulose-containing non-living organic materials themselves with a pesticidally effective amount of a compound of formula I or a composition containing it.

In another preferred embodiment of the present invention, compounds of formula 1 or compositions comprising them are used for protecting mono- oligo- or polysaccharides and proteins.

Preferably, compounds of formula 1 or compositions comprising them are used for protecting mono- oligo- or polysaccharides and proteins against non-crop pests selected from the Dermaptera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera,

36  
37

Orthoptera and Tysanura orders, most preferably the Isoptera, Diptera, Blattana (Blattodea), and Hymenoptra orders

5 The present invention also provides a method for protecting mono- oligo- or polysac-  
charides and proteins against non-crop pests, preferably selected from the Dermap-  
10 5 tera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, Orthoptera and  
Tysanura orders, most preferably the Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), and Hy-  
menoptra orders, comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breed-  
ing grounds or their locus with a pesticidally effective amount of a compound of formula  
1 or a composition containing it.

15 Furthermore, compounds of formula 1 are preferably used for protection of animals  
against non-crop pest of the class Chilopoda, and of the orders Araneida, Hemiptera,  
Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes and Acaridida by treatment of the  
20 15 pests in water bodies and/ or in and around buildings, including but not limited to walls,  
ground, manure piles, turf grass, pastures, sewers and materials used in the construc-  
tion of buildings and also mattresses and bedding, with a pesticidally effective amount  
of a compound of formula 1 or a composition containing it. Most preferably, compounds  
of formula 1 are used for protection of animals against non-crop pest of the Diptera,  
20 20 Phthiraptera, Siphonaptera, and Parasitiformes orders.

Animals include warm-blooded animals, including humans and fish. Compounds of  
formula 1 are preferably used for protection of warm-blooded animals such as cattle,  
25 25 sheep, swine, camels, deer, horses, poultry, rabbits, goats, dogs and cats.

25 In the definition of formula 1 shown above, the substituents have the following mean-  
ings:

30 "Halogen" will be taken to mean fluoro, chloro, bromo and iodo.

35 The term "alkyl" as used herein refers to a branched or unbranched saturated hydro-  
carbon group having 1 to 4 or 6 carbon atoms, especially C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl such as methyl,  
ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl,  
pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl,  
40 35 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 and 1-ethyl-2-  
methylpropyl

40 "Alkoxy" refers to a straight-chain or branched alkyl group having 1 to 4 carbon atoms  
(methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-

dimethylethyl) bonded through an oxygen linkage, at any bond in the alkyl group. Examples include methoxy, ethoxy, propoxy, and isopropoxy.

5 "Cycloalkyl" refers to a monocyclic 3- to 6-membered saturated carbon atom ring, i.e. cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, and cyclohexyl.

10 With respect to the intended use of the compounds of formula I, particular preference is given to the following meanings of the substituents, in each case on their own or in combination:

Preference is given to compounds of formula I wherein W is trifluoromethyl.

15 Preference is further given to compounds of formula I wherein X and Y are both chlorine

Moreover, preferred are compounds of formula I wherein R<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, especially ethyl.

20 Preference is further given to compounds of formula I wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are both methyl.

Moreover, preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> form a cyclopropyl ring which is unsubstituted or substituted by 1 to 3 halogen atoms, especially chlorine and bromine.

25 Moreover, particularly preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> form a cyclopropyl ring which is substituted by 2 halogen atoms.

30 Moreover, particularly preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> form a cyclopropyl ring which is substituted by 2 chlorine atoms.

Particularly preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> form a 2,2-dichlorocyclopropyl ring.

35 Preference is further given to compounds of formula I wherein R<sup>4</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alkyl, especially methyl.

Particularly preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> are all methyl.

40 Moreover, particularly preferred are compounds of formula I wherein R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> form a moiety 1-methyl-2,2-dichlorocyclopropyl.

28  
39

Preference is further given to compounds of formula I wherein

W is trifluoromethyl;

X and Y are each independently chlorine or bromine;

R<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

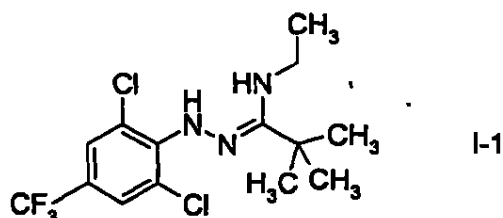
- 5 R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or may be taken together to form C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl which is substituted by 1 to 2 halogen atoms;

R<sup>4</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

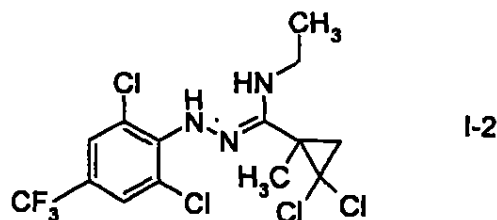
or the enantiomers or salts thereof.

- 10 Particular preference is given to N-ethyl-2,2-dimethylpropionamide-2-(2,6-dichloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolyl)hydrazone and N-Ethyl-2,2-dichloro-1-methylcyclopropane-carboxamide, 2-(2,6-dichloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolyl)hydrazone.

- 15 Furthermore, particular preference with respect to the use in the present invention is given to the compound of formula I-1 (N-ethyl-2,2-dimethylpropionamide-2-(2,6-dichloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone).



- 20 Moreover, particular preference with respect to the use in the present invention is given to the compound of formula I-2 (N-Ethyl-2,2-dichloro-1-methylcyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -tri-fluoro-p-tolyl)hydrazone)



- 25 With respect to their use, particular preference is given to the compounds I-A compiled in the tables below. Moreover, the groups mentioned for a substituent in the tables are on their own, independently of the combination in which they are mentioned, a particularly preferred embodiment of the substituent in question.

- 30 With respect to their use, particular preference is also given to the hydrochloric acid, maleic acid, dimaleic acid, fumaric acid, difumaric acid, methane sulfenic acid, methane sulfonic acid, and succinic acid adducts of the compounds of the tables below.

Some of the compounds of formula I are new. These are also subject-matter of this invention.

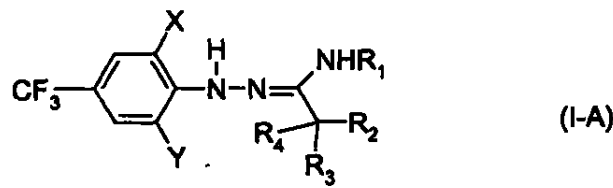


Table A

| No.  | R <sup>1</sup>                                  | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>  | X  | Y  |
|------|-------------------------------------------------|---------------------------------|-----------------|-----------------|----|----|
| A-1  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-2  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-3  | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-4  | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-5  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-6  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-7  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-8  | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-9  | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-10 | CH <sub>3</sub>                                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-11 | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-12 | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-17 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-18 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-19 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-20 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-21 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-22 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-23 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-24 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-25 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-26 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-27 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-28 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-29 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-30 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-31 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-32 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-33 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |

40  
41

| No.  | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>  | X  | Y  |
|------|--------------------------------------------------|---------------------------------|-----------------|-----------------|----|----|
| A-34 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-35 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-36 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-37 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-38 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-39 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-40 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-41 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-42 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-43 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-44 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-45 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-46 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-47 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-48 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                    | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-49 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-50 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-51 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-52 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-53 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-54 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-55 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-56 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-57 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-58 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-59 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-60 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-61 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-62 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Cl | Cl |
| A-63 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-64 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-65 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-66 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-67 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | H               | Br | Br |
| A-68 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | H               | Br | Br |
| A-69 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-70 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-71 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dichlorocyclopropyl         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-72 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromocyclopropyl          |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |

41  
42

For use according to the present invention, the compounds I can be converted into the customary formulations, e.g. solutions, emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes and granules. The use form depends on the particular purpose; it is intended to ensure in each case a fine and uniform distribution of the compound according to the invention.

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. Solvents/auxiliaries, which are suitable, are essentially:

- 10 - water, aromatic solvents (for example Solvesso products, xylene), paraffins (for example mineral fractions), alcohols (for example methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (for example cyclohexanone, gamma-butyrolactone), pyrrolidones (NMP, NOP), acetates (glycol diacetate), glycols, fatty acid dimethylamides, fatty acids and fatty acid esters. In principle, solvent mixtures may also be used.
- 15 - 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 nonionic and anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates) and dispersants such as lignin-sulfite waste
- 20 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

25 alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenyl polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, tristearylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty

30 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 and ethylene oxide / propylene oxide block copolymers.

35 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, for example toluene, xylene, paraffin, tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol,

40 ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, strongly polar solvents, for example dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone and water

42  
43

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

- 5 Granules, for example coated 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 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, such as, 10 for example, 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.

- 15 In general, the formulations comprise 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 examples of formulations: 1. Products for dilution with water

20 A Soluble concentrates (SL)

10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in water or in a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active ingredient dissolves upon dilution with water.

25 B Dispersible concentrates (DC)

20 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in cyclohexanone with addition of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion.

30 C Emulsifiable concentrates (EC)

15 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5% strength). Dilution with water gives an emulsion.

35 D Emulsions (EW, EO)

- 40 40 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5% strength). This mixture is introduced into water by means of an emulsifier (Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion.

43  
44**E Suspensions (SC, OD)**

In an agitated ball mill, 20 parts by weight of a compound according to the invention are milled with addition of dispersant, wetters and water or an organic solvent to give a fine active ingredient suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active ingredient.

**F Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG)**

50 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely with addition of dispersants and wetters and made into water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active ingredient.

**G Water-dispersible powders and water-soluble powders (WP, SP)**

75 parts by weight of a compound according to the invention are ground in a rotor-stator mill with addition of dispersant, wetters and silica gel. Dilution with water gives a stable dispersion or solution with the active ingredient.

**2. Products to be applied undiluted****H Dustable powders (DP)**

5 parts by weight of a compound according to the invention are ground finely and mixed intimately with 95% of finely divided kaolin. This gives a dustable product.

**I Granules (GR, FG, GG, MG)**

0.5 parts by weight of a compound according to the invention is ground finely and associated with 95.5% carriers. Current methods are extrusion, spray drying or the fluidized bed. This gives granules to be applied undiluted.

**J ULV solutions (UL)**

10 parts by weight of a compound according to the invention are dissolved in an organic solvent, for example xylene. This gives a product to be applied undiluted.

The active ingredients can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, eg. in the form of directly sprayable solutions, powders, gels, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dustable products, materials for spreading, or granules, microcapsules (CS), pellets or tablets, by means of spraying, atomizing, dusting, spreading or pouring. The use forms depend entirely on the intended purposes; it is intended to ensure in each case the finest possible distribution of the active ingredients according to the invention

94  
45

Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances, as such or dissolved in an oil or solvent, can be homogenized in water by means of a wetter, tackifier, dispersant or emulsifier.

- 5 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 relatively wide ranges. In general, they are from 0.0001 to 10%, preferably from 0.01 to 1%.

- 15 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 to apply the active ingredient without additives.

- 20 Various types of oils, wetters, adjuvants, herbicides, fungicides, other pesticides, or bactericides may be added to the active ingredients, if appropriate just immediately prior to use. These agents usually are admixed with the agents according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1.

The compounds of formula I are effective through both direct and indirect contact and ingestion, and also through trophallaxis and transfer.

- 25 Preferred application methods are into water bodies, via soil, cracks and crevices, pastures, manure piles, sewers, into water, on floor, wall, or by perimeter spray application and bait.

- 30 According to a preferred embodiment of the invention, the compounds of formula I are employed via soil application. Soil application is especially favorable for use against ants, termites, wasps, crickets, or cockroaches.

- 35 According to another preferred embodiment of the invention, for use against non crop pests such as ants, termites, wasps, flies, mosquitoes, crickets, locusts, cockroaches, and firebrats the compounds of formula I are prepared into a bait preparation.

- 40 The bait can be a liquid, a solid or a semisolid preparation (e.g. a gel). Solid baits can be formed into various shapes and forms suitable to the respective application e.g. granules, blocks, sticks, disks. Liquid baits can be filled into various devices to ensure proper application, e.g. open containers, spray devices, droplet sources, or evaporation

915  
46

sources. Gels can be based on aqueous or oily matrices and can be formulated to particular necessities in terms of stickiness, moisture retention or aging characteristics

- 5 The bait employed in the composition is a product which is sufficiently attractive to incite insects such as ants, termites, wasps, flies, mosquitoes, crickets etc or cockroaches to eat it. This attractant may be chosen from feeding stimulants or para and / or sex pheromones. Suitable feeding stimulants are chosen, for example, from animal and/or plant proteins (meat-, fish- or blood meal, insect parts, crickets powder, egg yolk), from fats and oils of animal and/or plant origin, or mono-, oligo- or polyorgano-
- 10 saccharides, especially from sucrose, lactose, fructose, dextrose, glucose, starch, pectin or even molasses or honey, or from salts such as ammonium sulfate, ammonium carbonate or ammonium acetate. Fresh or decaying parts of fruits, crops, plants, animals, insects or specific parts thereof can also serve as a feeding stimulant.
- 15 Pheromones are known to be more insect specific. Specific pheromones are described in the literature and are known to those skilled in the art.

- Formulations of compounds of formula I as aerosols (e.g in spray cans), oil sprays or pump sprays are highly suitable for the non-professional user for controlling pests such as flies, fleas, ticks, mosquitoes, locusts or cockroaches. Aerosol recipes are preferably
- 20 composed of the active compound, solvents such as lower alcohols (e.g methanol, ethanol, propanol, butanol), ketones (e.g. acetone, methyl ethyl ketone), paraffin hydrocarbons (e.g. kerosenes) having boiling ranges of approximately 50 to 250 °C, dimethylformamide, N-methylpyrrolidone, dimethyl sulphoxide, aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene, water, furthermore auxiliaries such as emulsifiers such as sorbitol monooleate, oleyl ethoxylate having 3-7 mol of ethylene oxide, fatty alcohol ethoxylate, perfume oils such as ethereal oils, esters of medium fatty acids with lower alcohols, aromatic carbonyl compounds, if appropriate stabilizers such as sodium benzoate, amphoteric surfactants, lower epoxides, triethyl orthoformate and, if required, propellants such as propane, butane, nitrogen, compressed air, dimethyl ether, carbon
- 25 dioxide, nitrous oxide, or mixtures of these gases.
- 30

The oil spray formulations differ from the aerosol recipes in that no propellants are used.

- 35 The compounds of formula I and its respective compositions can also be used in mosquito coils and fumigating coils, smoke cartridges, vaporizer plates, long-term vaporizers, or other heat-independent vaporizer systems.

- 40 Methods to control infectious diseases transmitted by insects (e.g malaria, dengue and yellow fever, lymphatic filariasis, and leishmaniasis) with compounds of formula I and its respective compositions also comprise treating surfaces of huts and houses, air spraying and impregnation of curtains, tents, clothing items, bed nets, tsetse-fly trap or

46  
47

the like. Insecticidal compositions for application to fibers, fabric, knitgoods, nonwovens, netting material or foils and tarpaulins preferably comprise a mixture including the insecticide, optionally a repellent and at least one binder.

- 5 The impregnation of curtains and bed nets is mostly done by dipping the textile material into emulsions or dispersions of the insecticide or spraying them onto the nets.

- The following list of pesticides together with which the compounds according to the invention can be used, is intended to illustrate the possible combinations, but not to  
10 impose any limitation:

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

- Carbamates: Alanycarb, Benfuracarb, Carbaryl, Carbosulfan, Fenoxycarb, Furathiocarb, Indoxacarb, Methiocarb, Methomyl, Oxamyl, Pinmicarb, Propoxur, Thiodicarb,  
20 Triazamate;

- Pyrethroids: Bifenthrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, alpha-Cypermethrin, Deltamethrin, Esfenvalerate, Ethofenprox, Fenpropathrin, Fenvalerate, Cyhalothrin, Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Tralomethrin, Zeta-Cypermethrin,  
25

- Arthropod growth regulators a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas: Chlorfluazuron, Diflubenzuron, Flucyclohexuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Teflubenzuron, Triflumuron; Buprofezin, Diofenolan, Hexythiazox, Etoxazole, Clofentazine; b) ecdysone antagonists: Halofenozide, Methoxyfenozide, Tebufenozide, c) juvenoids: Pyriproxyfen, Methoprene, Fenoxycarb; d) lipid biosynthesis inhibitors: Spirodiclofen;  
30

- 35 Neonicotinoids. Acetamiprid, Clothianidin, Flonicamid, Imidacloprid, Nitenpyram, Thiacloprid, Thiamethoxam;

- Various Abamectin, Acequinocyl, Amitraz, Azadirachtin, Bifenazate, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus subtilis*, Cartap, Chlorfenapyr, Chlordimeform, Cyromazine, Diafenthiuron, Dinetofuran, Diofenolan, Enamectin, Endosulfan, Ethiprole, Fenazaquin, Fipronil, Formetanate, Formetanate hydrochloride, Hydramethylnon, Indoxacarb,  
40 4-((2Z)-2-((4-(trifluoromethoxy)anilino) carbonyl) hydrazono)-2-[3-(trifluoromethyl)-

Customary application rates in the protection of materials are, for example, from 0.01 g to 1000 g of active compound per m<sup>2</sup> treated material, desirably from 0.1 g to 50 g per m<sup>2</sup>.

- 5 Insecticidal compositions for use in the impregnation of materials typically contain from 0.001 to 95 weight %, preferably from 0.1 to 45 weight %, and more preferably from 1 to 25 weight % of at least one repellent and / or insecticide.

- 10 For use in bait compositions, the typical content of active ingredient is from 0.0001 weight % to 15 weight %, desirably from 0.001 weight % to 5% weight % of active compound. The composition used may also comprise other additives such as a solvent of the active material, a flavoring agent, a preserving agent, a dye or a bitter agent. Its attractiveness may also be enhanced by a special colour, shape or texture.

- 15 For use in spray compositions, the content of active ingredient is from 0.001 to 80 weights %, preferably from 0.01 to 50 weight % and most preferably from 0.01 to 15 weight %.

#### Examples of action against pests

20

#### Test Methodology

1. Activity against Argentine ant, harvester ant, acrobat ant, carpenter ant, fire ant, house fly, stable fly, flesh fly, yellowfever mosquito, house mosquito, malaria mosquito, 25 German cockroach, cat flea, and brown dog tick via glass contact

- 30 Glass vials (20 ml scintillation vials) were treated with 0.5 ml of a solution of active ingredient in acetone. Each vial was rolled uncapped for ca 10 minutes to allow the a.i. to completely coat the vial and to allow for full drying of the acetone. Insects or ticks were placed into each vial. The vials were kept at 22 °C and were observed for treatment effects at various time intervals. Results are presented in Table I.

2. Activity against Argentine ant, acrobat ant, carpenter ant, fire ant, and eastern subterranean termite via soil contact

35

- 40 For ants, tests were conducted in Petri dishes. A thin layer of 1 % agar in water was dispensed into the dishes and Florida sandy soil was spread over the agar (5 g for the small dishes and 11 g for the larger dishes). The active ingredient was dissolved in acetone and dispensed over the sand. Dishes were vented to evaporate the acetone, infested with ants, and covered. A 20% honey water solution was placed in each dish. The dishes were maintained at 22°C and observed for mortality at various time intervals.

49  
50

For termites, a thin layer of 1% agar was dispensed into Petri dishes. A thin layer of pre-treated soil was spread over the agar. For soil treatment, the active ingredient was diluted in acetone on a weight-to-weight basis and incorporated into 100 g of soil. The soil was placed in a jar and vented for 48 hours. The moisture level of the soil was brought to field capacity by adding 7 ml of water. Termite workers were introduced into each dish. A small piece of filter paper was placed into each dish after 1 day as a food source, and additional water was added as needed to maintain soil moisture. Test dishes were held at a dark incubator at 25°C and appr. 80% relative humidity. Termites were observed daily for mortality (dead or unable to stand upright and showing only weak movement). Results are shown in Table I.

3. Activity against Argentine ant, acrobat ant, carpenter ant, fire ant, house fly, eastern subterranean termite, formosan subterranean termite, and German cockroach via bait

For Argentine ant, acrobat ant, and carpenter ant, 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 either 20% honey/water solutions or ground cat chow. Active ingredient in acetone was added to the bait. 0.2 ml of treated honey water solution or 150 mg of treated cat chow, placed in a cap, was added to each dish. The dishes were covered and maintained at a temperature of 22°C. The ants were observed for mortality daily. Results are shown in Table I.

For the fire ants, corn grit was used as a bait matrix. Corn grit bait was prepared using a mixture of defatted corn grit (80%), soybean oil (19.9%), acetone, and the active ingredient (0.1%). Petri dishes were supplied with a water source. Fire ant adults were placed into each dish. The next day, 250 mg of bait in bait containers was placed into the dishes. The ants were observed for mortality daily. Results are shown in Table I.

For house flies. Bait tests were conducted with adults aged 2-5 days post-emergence. Active ingredient in acetone was applied to a bait matrix consisting of a 1:1 mixture of powdered milk and sugar which was then allowed to dry. Assays were conducted in jars with 250 mg of bait in a pan placed in the bottom of each jar. House flies were placed into the bait jars which were covered. The test jars were held at 22°C. Test jars were observed at 4 hours after treatment for knockdown (death plus morbidity (unable to stay upright)). Results are shown in Table I.

For termites, active ingredient in acetone was applied to filter papers. % a.i. were calculated on basis of the weight of the filter paper. Acetone only was applied for untreated controls. Treated papers were vented to evaporate the acetone, moistened with ml water, and placed Petri dishes with sand. Water was added during the test as

~~50~~  
51

needed. Bioassays were conducted with one treated filter and ca. 30 termite workers per test dish. Test dishes were maintained at 25°C and appr. 85% relative humidity and observed daily for mortality (dead or moribund insects) or intoxication. Dead or moribund insects were removed daily. Results are shown in Table I.

5

For cockroaches, plastic roach boxes with ventilated lids were used as test arenas. The top 3-4 cm of the arenas was treated with Vaseline and mineral oil to prevent roaches from escaping. Water was provided as needed. The bait was prepared using ground cat chow, and the active ingredient in acetone was incorporated on a weight- to-weight ratio. The treated chow was allowed to dry. The cockroaches were placed in the boxes and starved for 24 hours prior to bait introduction. 0.03 grams of bait per box were placed in a weigh boat. The boxes were maintained at 22°C and observed daily for mortality of the cockroaches. Results are shown in Table I.

10

15    4.    Activity against yellowfever mosquito, southern house mosquito, and malaria mosquito larvae via water treatment

Well plates were used as test arenas. The active ingredient was dissolved in acetone and diluted with water to obtain the concentrations needed. The final solutions containing appr 1% acetone were placed into each well. Approximately 10 mosquito larvae (4<sup>th</sup>-instars) in 1 ml water were added to each well. Larvae were fed one drop of liver powder each day. The dishes were covered and maintained at 22°C. Mortality was recorded daily and dead larvae and live or dead pupae were removed daily. At the end of the test remaining live larvae were recorded and percent mortality was calculated.

20

25    Results are shown in Table I.

Each test was replicated at least 3 times.

ST  
52

## Results

Tests conducted with compounds of formula I-1 and I-2 showed the following results:

## 5 Table I Activity against various species.

| Pest Common Name           | Pest Latin Name                  | Rate    | Days or Hours to achieve 100% mortality |
|----------------------------|----------------------------------|---------|-----------------------------------------|
| Activity via glass contact |                                  |         |                                         |
| Argentine ant              | <i>Linepithema humile</i>        | 10 ppm  | 1-2 days                                |
| harvester ant              | <i>Pogonomyrmex californicus</i> | 10 ppm  | 2-3 days                                |
| acrobat ant                | <i>Crematogaster spp.</i>        | 10 ppm  | 1-2 days                                |
| carpenter ant              | <i>Camponotus floridanus</i>     | 10 ppm  | 1 day                                   |
| fire ant                   | <i>Solenopsis invicta</i>        | 10 ppm  | 4 hours                                 |
| house fly                  | <i>Musca domestica</i>           | 10 ppm  | 4 hours                                 |
| stable fly                 | <i>Stomoxys calcitrans</i>       | 10 ppm  | 4 hours                                 |
| flesh fly                  | <i>Sarcophaga sp.</i>            | 10 ppm  | 4 hours                                 |
| yellowfever mosquito       | <i>Aedes aegypti</i>             | 10 ppm  | 4 hours                                 |
| house mosquito             | <i>Culex quinquefasciatus</i>    | 0.5 ppm | 4 hours                                 |
| malaria mosquito           | <i>Anopheles albimanus</i>       | 1 ppm   | 1 day                                   |
| German cockroach           | <i>Blattella germanica</i>       | 100 ppm | 5-24 hours                              |
| cat flea                   | <i>Ctenocephalides felis</i>     | 100 ppm | 2 days                                  |
| brown dog tick             | <i>Rhipicephalus sanguineus</i>  | 10 ppm  | 3-5 days                                |
| Activity via soil contact  |                                  |         |                                         |
| Argentine ant              | <i>Linepithema humile</i>        | 0.1w%   | 1-2 days                                |
| acrobat ant                | <i>Crematogaster spp.</i>        | 0.01w%  | 2 days                                  |
| carpenter ant              | <i>Camponotus floridanus</i>     | 0.01w%  | 1 day                                   |
| fire ant                   | <i>Solenopsis invicta</i>        | 0.01w%  | 1 day                                   |
| subterranean termite       | <i>Reticulitermes flavipes</i>   | 0.005w% | 1-3 days                                |
| Activity via bait          |                                  |         |                                         |
| Argentine ant              | <i>Linepithema humile</i>        | 1.0w%   | 2-3 days                                |
| acrobat ant                | <i>Crematogaster spp.</i>        | 1.5w%   | 6-7 days                                |
| carpenter ant              | <i>Camponotus floridanus</i>     | 2.0w%   | 1-3 days                                |
| fire ant                   | <i>Solenopsis invicta</i>        | 0.7w%   | 3 days                                  |
| house fly                  | <i>Musca domestica</i>           | 0.1w%   | 3 hours                                 |
| subterranean termite       | <i>Reticulitermes flavipes</i>   | 0.1w%   | 1-2 days                                |
| Formosan termite           | <i>Coptotermes formosanus</i>    | 0.1w%   | 5 days                                  |

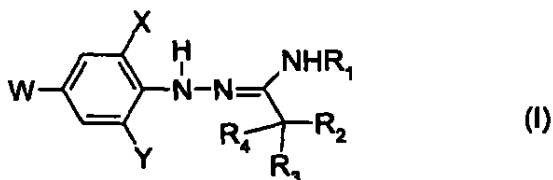
82  
53

| Pest Common Name             | Pest Latin Name               | Rate    | Days or Hours to achieve 100% mortality |
|------------------------------|-------------------------------|---------|-----------------------------------------|
| German cockroach             | <i>Blattella germanica</i>    | 0.3w%   | 1-2 days                                |
| Activity via water treatment |                               |         |                                         |
| yellowfever mosquito         | <i>Aedes aegypti</i>          | 10 ppm  | 2 days                                  |
| house mosquito               | <i>Culex quinquefasciatus</i> | 10 ppm  | 1 day                                   |
| malana mosquito              | <i>Anopheles albimanus</i>    | 1.0 ppm | 1 day                                   |

83  
54

## Claims

1. The use of compounds of formula I



5

wherein

W is chlorine or trifluoromethyl;

10

X and Y are each independently chlorine or bromine,

R<sup>1</sup> is C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkynyl, or  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl which may be substituted with 1 to 3 halogen atoms, or  
C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl which is substituted by C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy,

15

R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or may be taken together to form C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cycloalkyl  
which may be unsubstituted or substituted by 1 to 3 halogen atoms,

R<sup>4</sup> is hydrogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

20

or the enantiomers or salts thereof,

for combating non-crop pests.

25

2. The use according to claim 1 wherein the non-crop pests are selected from the group consisting of the classes Chilopoda and Diplopoda and of the orders Isop-  
tera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Or-  
thoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes and  
Acaridida.

30

- 3 The use according to claims 1 or 2 wherein the non-crop pests are selected from  
the group consisting of the orders Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymen-  
optera, Siphonaptera, Orthoptera, and Ixodida

35

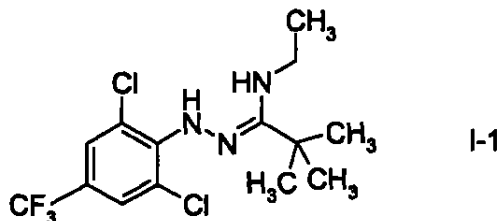
4. The use of the compounds of formula I as defined in claim 1 for the protection of  
non-living organic materials.

SA  
55

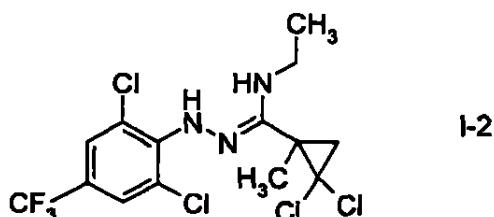
5. The use according to claim 4 for the protection of non-living organic materials against non-crop pests selected from the group consisting of the class Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, and Thysanura.

5

6. The use according to claims 1 to 5 wherein the compound of formula I is a compound of formula I-1.



- 10 7. The use according to claims 1 to 5 wherein the compound of formula I is a compound of formula I-2.



- 15 8. A method for controlling non-crop pests comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breeding grounds or their locus with a pesticidally effective amount of a compound of formula I as defined in claims 1, 6 or 7.
- 20 9. A method according to claim 8 wherein the non-crop pests are selected from the group consisting of the classes Chilopoda and Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes and Acaridida
- 25 10. A method according to claims 8 or 9 wherein the non-crop pests are selected from the group consisting of the orders Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera, and Ixodida.
- 30 11. A method for the protection of non-living organic materials against non-crop pests selected from the group consisting of the class Diplopoda and of the orders Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, and Thysanura comprising contacting the pests or their food supply, habitat, breeding grounds, their locus or the non-living organic materials with a

SS  
56

pesticidally effective amount of a compound of formula I as defined in claims 1, 6 or 7.

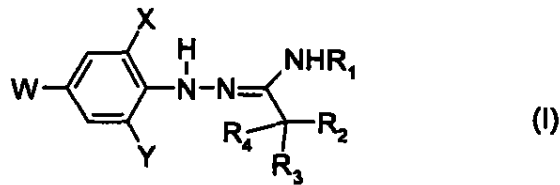
- 5 12. A method for the protection of animals against non-crop pests selected from the group consisting of the class Chilopoda and of the orders Araneida, Hemiptera, Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes and Acaridida, comprising treatment of the pests in water bodies and/or in and around buildings with a pesti-  
cidally effective amount of a compound of formula I as defined in claims 1, 6 or 7.
- 10 13. A method according to claim 12 wherein the non-crop pests are selected from the group consisting of the Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, and Parasitiformes orders.
- 15 14. A bait composition which comprises a pestidally effective amount of a compound of formula I as defined in claims 1, 6 or 7 and an attractant.

86  
57

## The use of N-arylhydrazine derivatives for combating pests

## Abstract

## 5 Use of hydrazine derivatives of formula I:



wherein

W is chlorine or trifluoromethyl;

X and Y are each independently chlorine or bromine;

- 10  $R^1$  is alkyl, alkenyl, alkynyl, or cycloalkyl which may be substituted with 1 to 3 halogen atoms, or alkyl which is substituted by alkoxy;

$R^2$  and  $R^3$  are alkyl or may be taken together to form cycloalkyl which may be unsubstituted or substituted by 1 to 3 halogen atoms;

$R^4$  is hydrogen or alkyl,

- 15 or the enantiomers or salts thereof,

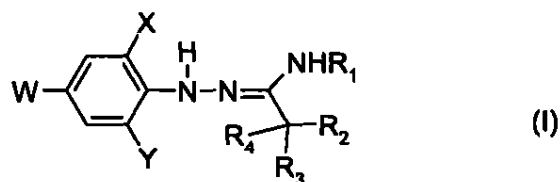
for combating non-crop pests,

Use of compounds of formula I for the protection of non-living organic materials and for the protection of animals against non-crop pests

Uso de derivados de N-arilhidracina para combatir pestes

Descripción

5 La presente invención se refiere al uso de derivados de hidracina de la fórmula I:



donde

10 W es cloro o trifluorometilo,

X e Y significan, independientemente, cloro o bromo,

R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o  
 15 cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, o  
 alquilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> sustituido por alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> significan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o pueden formar juntos cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, que puede  
 ser no sustituido o estar sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno;

20

R<sup>4</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

o los enantiómero o las sales de los mismos,

Se ha encontrado, que estos objetos se alcanzan usando los compuestos de la fórmula I y las composiciones que las contienen.

Pestes no agrícolas son pestes de las clases: quilópodos y diplópodos y del orden de  
5 los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, fitrípteros, araneidos, parasitiformes y acáridos.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente apropiados para combatir los siguientes pestes:

10

centípedos (quilópodos), p ej. *Scutigera coleoptrata*,

milípedos (diplópodos), p ej. *Narceus spp.*,

15 arañas (araneidos), p ej *Latrodectus mactans* y *Loxosceles reclusa*,

sarna (acáridos): p ej. *sarcoptes sp*,

garrapatas y ácaros parasíticos (parasitiformes) garrapatas (ixódidos), p.ej. *Ixodes*  
20 *scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros tuncata* y ácaros parasíticos (mesostigmata), p ej. *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

termes (isópteros), p.ej. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*, y *Coptotermes formosanus*,

- 5 cucarachas (blattaria - blattodea), p ej *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

- moscas, mosquitos (dípteros), p ej *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*,  
10 *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellana*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides*  
15 *furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sencata*, *Lycoria*  
20 *pectoralis*, *Mansonina spp.*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga sp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,

- 25 tijeretas (dermápteros), p.ej. *forficula auncularia*,

hemípteros, p ej. *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius prolixus*, y *Arilus critatus*,

hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (himenópteros), p ej. *Crematogaster* spp ,

- 5 *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis nchten*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus flondanus*, y
- 10 *Linepithema humile*,

gnillos, saltamones, langostas (ortópteros), p.ej. *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacns septemfasciata*,

- 15 *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus vanegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, y *Locustana pardalina*,

- 20 pulgas (sifonápteros), p ej. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,

pececillos de plata, termobia doméstica (tisanuros), p ej *Lepisma saccharina* y *Termobia domestica*,

62  
63

piojos (fitirápteros), p.ej *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*

- 5 Los derivados de hidracina de la fórmula I, que pueden ser usados según la invención-  
se conocen de la EP-A 604 798 o pueden ser preparados según los métodos allí des-  
critos. Este documento se refiere a la protección de plantas in el campo agrícola y di-  
vulga la actividad insecticida y acaricida de compuestos de la fórmula I y otros com-  
puestos contra pestes en cultivos del orden de los coleópteros, lepidópteros y acári-  
10 dos.

En J. A Furch et al., "Amidrazones: A New Class of Coleopteran Insecticides", ACS  
Symposium Series 686, Am. Chem. Soc., 1998, Capítulo 18, p 178 y sig., se describe  
el uso de determinadas amidrazonas contra el escribano del maíz, donde algunas  
15 amidrazonas pertenecen a los compuestos de la fórmula I Se enseña que estos com-  
puestos se dingan específicamente a ciertos insectos coleópteros, siendo al mismo  
tiempo muy poco tóxicos o no tóxicos para lepidópteros y otros insectos, inclusive acá-  
ridos.

- 20 En D. G. Kuhn et al., "Cicloalquil-substituted Amidrazones A Novel Class of Insect  
Control Agents", ACS Symposium Series 686, Am Chem Soc., 1998, Capítulo 19, p.  
185 y sig., se enseña que ciertas amidrazonas, algunas de las cuales son compuestos  
de la fórmula I, donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> forman juntos un anillo ciclopropilo, son activas contra  
ciertas especies de coleópteros y lepidópteros Ensayos biológicos demuestran, que

los compuestos son bastante selectivos, y solo algunos de ellos presentan una buena actividad tanto contra coleópteros y lepidópteros.

- Que un compuesto sea activo contra pestes en la protección de plantas, es decir pestes agrícolas, no quiere decir necesariamente, que el compuesto sea activo contra pestes no agrícolas. Por el contrario, el control de pestes no agrícolas se refiere a la protección de materiales orgánicos no vivos o a la higiene o la prevención de enfermedades (sanidad pública).
- 10 Generalmente, las diferentes exigencias para el control de pestes no agrícolas/ pestes agrícolas surgen, mayormente, además de posibles destinos bioquímicos diferentes, en los diferentes alimentos y/o el diferente habitat de los pestes.

- Pestes vegetales como p.ej. del orden de los homópteros, se alimentan de las partes verdes de las plantas, perforándolas y chupando los líquidos de las plantas. Otros pestes del orden de los lepidópteros y coleópteros se alimentan de las partes verdes de las plantas mordiendo partes de las plantas. Por el contrario, pestes no agrícolas no viven en las plantas y no se alimentan o muy raras veces se alimentan de partes verdes de plantas. Pestes no agrícolas se alimentan, por ejemplo, de materiales orgánicos no vivos, tales como casas, vestidos y los alimentos de seres humanos y animales, pero también de cables eléctricos, etc. introduciendo gérmenes patógenos en el medio ambiente del hombre y destruyendo sus casas y sus alimentos. Por ejemplo, los termites (orden de los isópteros) se alimentan, primordialmente, de celulosa, que es el componente principal de productos de madera y papel. Otro ejemplo es el mosquito

64  
65

(orden de los dípteros), cuyas larvas se alimentan de microorganismos y otras materias orgánicas en el agua y cuyos animales adultos se alimentan de la sangre humana

Las propiedades de pesticidas tienen que ser adaptadas a su uso específico. Pesticidas sistémicos, por ejemplo, que gracias a su solubilidad en agua son introducidos en las partes de las plantas, son apropiados para controlar plagas perforadoras-chupadores o mordedores (es decir plantas de cultivo). Sin embargo, no se puede contar, generalmente, con que estos pesticidas presentan la misma actividad contra plagas no agrícolas, que no se alimentan de las partes verdes de plantas, y que suelen ser controlados con pesticidas mayormente insolubles en agua en sistemas de cebo o tratamiento directo. En muchos casos, los pesticidas para el control de plagas agrícolas no son apropiados para controlar plagas no agrícolas y viceversa. Los insecticidas comerciales: pirimicarb, acephate, pyrimidifen, y pyridaben son algunos ejemplos. Son activos contra insectos en cultivos, pero presentan poca actividad contra plagas no agrícolas.

En resumen se puede decir, que el estado de la técnica enseña al pento, que amidrazonas de la fórmula I y de estructura similar presentan una actividad selectiva contra ciertas plagas agrícolas del orden de los coleópteros o lepidópteros y que pequeños cambios de la estructura tienen un efecto tremendo sobre la selectividad

Sorprendentemente, se ha encontrado, que un determinado grupo de amidrazonas, sobre todo, los compuestos de la fórmula I, presentan un amplio espectro de actividad contra plagas no agrícolas.

68  
66

Los compuesto de la fórmula I y las combinaciones que los contienen son especial-  
mente apropiados para controlar pestes de la clase de los y diplópodos.

Los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son especial-  
5 mente útiles para el control de pestes del orden de los isópteros, blattaria (blattodea),  
dípteros, dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, y  
firápteros

Además, los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son  
10 especialmente útiles para el control de pestes del orden de los parasitiformes, aranei-  
da y acándos.

Además, los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son  
especialmente útiles para el control de pestes del orden de los isópteros, blattaria  
15 (blattodea), dípteros, himenópteros, sifonápteros, ortópteros y ixodida

Especialmente, los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen  
son especialmente útiles para el control de pestes del orden de los isópteros, blattaria  
(blattodea), dípteros, himenópteros y sifonápteros.

20

Sobre todo, los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son  
útiles para controlar isópteros (*Hodotermitidae*, *Kalotermitidae*, *Rhinotermitidae*, *Termi-*  
*tidae*), blattana/blattodea (*Cryptocercidae*, *Blattidae*, *Polyphagidae*, *Blattellidae*), dípte-  
ros (*Culicidae*, *Simuliidae*, *Ceratopogonidae*, *Tabanidae*, *Muscidae*, *Calliphoridae*,  
25 *Oestridae*, *Sarcophagidae*, *Hippoboscidae*), himenópteros (*Xyelidae*, *Argidae*, *Cimbici-*

*dae, Tenthredinidae, Anaxyelidae, Cephidae, Aphidiidae, Formicidae, Vespoidae, Sphecidae*), y sifonápteros (*Pulicidae, Rhopalopsyllidae, Ceratophyllidae*).

Además, se prefiere, especialmente, usar los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los isópteros.

El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los blattaria/blattodea es otra modalidad preferida de la presente invención

10

Además, es especialmente preferido usar los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los himenópteros, sobre todo, hormigas.

15 El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los dípteros, especialmente moscas y mosquitos, es otra modalidad preferida de la presente invención

Adicionalmente, es especialmente preferido usar los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los ortópteros

20

Además, es especialmente preferido usar los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir plagas del orden de los sifonápteros.

El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir pestes del orden de los ixódidos, especialmente, moscas y mosquitos, es otra modalidad preferida de la presente invención

- 5   Adicionalmente, otra modalidad preferida de la presente invención es el uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir pestes del orden de los mesostigmata

- Además, el uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir pestes del orden de los acáridos es otra modalidad preferida de la presente invención.
- 10

- En una modalidad preferida de la presente invención se usan los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para la protección de materiales orgánicos no vivos, inclusive pero no limitativamente, bienes domésticos, tales como grasas, aceites, mono- oligo- o poliorganosacáridos, proteínas o frutas frescas o extremamente maduras, materiales conteniendo celulos, p.ej. materiales de madera, tales como casas, árboles, estacadas o durmientes y también papel, así como materiales de construcción, muebles, cueros, animales, plantas y fibras sintéticas, artículos de vinilo, cables eléctricos y cables, así como espumas de estireno.
- 15
- 20

Muy preferentemente, se usan los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para la protección de materiales orgánicos no vivos contra pestes no agrícolas seleccionados del grupo que comprende la clase de los diplópodos y del

orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, y tisanura

La presente invención se refiere, también a un método para la protección de materia-  
5 les orgánicos no vivos contra pestes no agrícolas, preferentemente, contra pestes no agrícolas seleccionados del grupo, que abarca la clase de los diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, y tisanura, que consiste en contactar los pestes o su suministro de comida, habitat, terreno de cría, su loci o los materiales orgánicos no vivos con una cantidad  
10 efectiva de un compuesto de la fórmula I o una composición que lo contiene.

Además, los compuestos de la fórmula 1 o las composiciones que los contienen se usan, preferentemente, para proteger materiales orgánicos no vivos, que contienen celulosa

15

Preferentemente, los compuestos de la fórmula 1 o las composiciones que los contienen se usan para proteger materiales orgánicos no vivos, que contienen celulosa contra pestes no agrícolas del orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), himenópteros, y ortópteros, muy preferentemente, del orden de los isópteros.

20

La presente invención provee igualmente un método para proteger materiales orgánicos no vivos, que contienen celulosa contra pestes no agrícolas, preferentemente, del orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), himenópteros, y ortópteros, muy preferentemente, del orden de los isópteros, que consiste en contactar los pestes o su  
25 suministro de comida, habitat, terreno de cría, su loci o los materiales orgánicos no

vivos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I o una composición que lo contiene

En otra modalidad de la presente invención, se usan los compuestos de la fórmula 1 o  
5 las composiciones que los contienen para proteger mono- oligo- o polisacáridos y proteínas

Preferentemente, se usan los compuestos de la fórmula 1 o las composiciones que los contienen para proteger mono- oligo- o polisacáridos y proteínas contra pestes no  
10 agrícolas seleccionados del orden de los dermápteros, diplópodos, isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), himenópteros, ortópteros y tisanura, muy preferentemente, el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), y himenópteros.

La presente invención también provee un método para proteger mono- oligo- o polisacáridos y proteínas contra pestes no agrícolas, preferentemente, seleccionados del  
15 orden de los dermápteros, diplópodos, isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), himenópteros, ortópteros y tisanura, muy preferentemente, del orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), y himenópteros, que consiste en contactar los pestes o su suministro de comida, habitat, terreno de cría, su loci o los materiales orgánicos no  
20 vivos con una cantidad efectiva de un compuesto de la fórmula I o una composición que lo contiene.

Adicionalmente, los compuestos de la fórmula I se usan, preferentemente, para la protección de animales contra pestes no agrícolas de la clase de los quilópodos y del orden de araneida, hemípteros, dípteros, fitirápteros, sifonápteros, parasitiformes y acári-  
25

70  
71

dos, tratando los pestes en cuerpos de agua y/o en y alrededor de edificios, incluyendo  
pero no limitativamente, paredes, suelos, estercoleros, césped, pastos, desagaderos  
y materiales usados en la construcción de edificios, al igual de colchones y ropa de  
cama, con una cantidad presticida de un compuesto de la fórmula I o una composición  
5 que los contiene. Muy preferentemente, los compuestos de la fórmula I se usan para la  
protección de animales contra pestes no agrícolas del orden de los dípteros, fitirápte-  
ros, sifonápteros, y parasitiformes

Animales incluyen animales de sangre caliente, incluso hombres y peces. Los com-  
10 puestos de la fórmula I se usan, preferentemente, para la protección de animales de  
sangre caliente, tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, cérvidos, caballos,  
aves, cabras, perros y gatos

En la definición de la fórmula I amba representada, los sustituyentes tienen los signifi-  
15 cados siguientes.

"Halógeno" significa fluoro, cloro, bromo e iodo

El término "alquilo" usado en la presente representa un grupo hidrocarburo lineal o  
20 ramificado con 1 a 4 ó 6 átomos de carbono, especialmente, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, por ejem-  
plo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-  
dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-  
etilpropilo, 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 y 1-etil-2-metilpropilo.

"Alcoxi" se refiere a un grupo alquilo lineal o ramificado con 1 a 4 átomos de carbono (metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo) ligado por medio de un enlace de oxígeno, en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos son: metoxi, etoxi, propoxi, y isopropoxi.

"Cicloalquilo" se refiere a un anillo de carbono monocíclico saturado de 3 a 6 miembros, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, y ciclohexilo

Con respecto al uso a que están destinado los compuestos de la fórmula I, son especialmente preferidos los siguientes significados de los sustituyentes, tanto por si solos, como también en combinaciones.

15

Son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde W es trifluorometilo.

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde X y Y significan cloro.

20 Adicionalmente, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, especialmente, etilo

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> significan metilo.

25

Adicionalmente, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$  y  $R^3$  forman un anillo ciclopropilo que no es sustituido o está sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, especialmente, cloro y bromo

- 5 Además, son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$  y  $R^3$  forman un anillo ciclopropilo sustituido por 2 átomos de halógeno.

Igualmente, son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$  y  $R^3$  forman un anillo ciclopropilo sustituido por 2 átomos de cloro.

10

Son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$  y  $R^3$  forman un anillo de 2,2-diclorociclopropilo.

Adicionalmente, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^4$  es alquilo  $C_1$ -

- 15  $C_6$ , especialmente, metilo.

Son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$  significan metilo.

- 20 Además, son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I, donde  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$  forman un grupo 1-metil-2,2-diclorociclopropilo

Además, son preferidos los compuestos de la fórmula I, donde

W es trifluorometilo;

- 25 X y Y significan, independientemente, cloro o bromo;

R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>,

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> significan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o pueden formar juntos cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> sustituido por 1 a 2 átomos de halógeno,

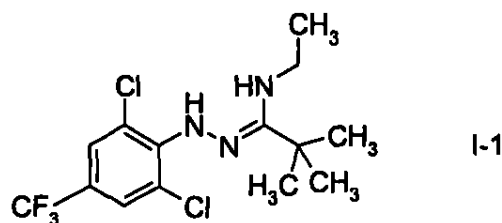
R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>,

5 o los enantiómeros o las sales de los mismos

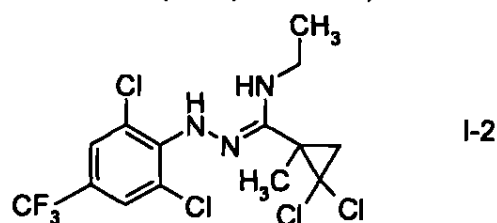
Se prefieren, especialmente, N-etil-2,2-dimetilpropionamido-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona y N-etil-2,2-dicloro-1-metilciclopropano-carboxamida, 2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona.

10

Con respecto a su uso en la presente invención, es especialmente preferido el compuesto de la fórmula I-1 (N-etil-2,2-dimetilpropionamido-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)-hidrazona):



15 Además, con respecto a su uso en la presente invención, es especialmente preferido el compuesto de la fórmula I -2 (N-etil-2,2-dicloro-1-metilciclo-propanecarboxamido-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona):



74  
75

Con respecto a su uso se prefieren, especialmente, los compuestos I-A relacionadas en las Tablas siguientes. Además, los grupos mencionados para un sustituyente en las Tabla abajo indicadas representan por si solas, independientemente, de la combinación en que se mencionan, una variante especialmente prefenda del sustituyente respectivo.

Con respecto a su uso, se prefieren, especialmente, los aductos de ácido clorhídrico, ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumánico, ácido difumánico, ácido metanosulfénico, ácido metanosulfónico y ácido succínico de los compuestos indicados en las Tablas siguientes

Algunos de los compuestos de la fórmula I son nuevos. Estos también son objeto de la presente invención.

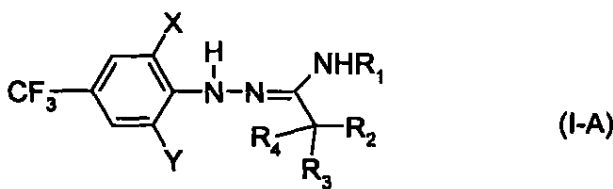


Tabla A

| No.  | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>  | X  | Y  |
|------|-----------------|---------------------------------|-----------------|-----------------|----|----|
| A-1  | CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-2  | CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-3  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-4  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-5  | CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-6  | CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-7  | CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-8  | CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-9  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-10 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |

75  
76

| No.  | R <sup>1</sup>                                  | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>  | X  | Y  |
|------|-------------------------------------------------|---------------------------------|-----------------|-----------------|----|----|
| A-11 | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-12 | CH <sub>3</sub>                                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-13 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-14 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-15 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-16 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-17 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-18 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-19 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-20 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-21 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-22 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-23 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-24 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-25 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-26 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-27 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-28 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-29 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-30 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-31 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-32 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-33 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-34 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-35 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-36 | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-37 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-38 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-39 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-40 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-41 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-42 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-43 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-44 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-45 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-46 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-47 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-48 | C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>                   | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |

76  
77

| No.  | R <sup>1</sup>                                   | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>  | X  | Y  |
|------|--------------------------------------------------|---------------------------------|-----------------|-----------------|----|----|
| A-49 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-50 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-51 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-52 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-53 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-54 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-55 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-56 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-57 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-58 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-59 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-60 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                 | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-61 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-62 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Cl | Cl |
| A-63 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-64 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-65 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-66 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Cl | Cl |
| A-67 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-68 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | H               | Br | Br |
| A-69 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-70 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-71 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-diclorociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |
| A-72 | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 2,2-dibromociclopropilo         |                 | CH <sub>3</sub> | Br | Br |

Para su uso según la invención se pueden convertir los compuestos I en las formulaciones usuales, p ej. soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y granulados. La forma de uso depende del fin de aplicación y debe en cada caso

5    asegurar una distribución fina y uniforme del compuesto según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, diluyendo el ingrediente activo con disolventes y/o soportes, en caso de desearlo, usando emulsionantes y dispersantes. Como disolventes/sustancias auxiliares son apropiados, substancial-

mente, para este fin:

- agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos. Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes,
- sustancias soporte, tales como polvos de piedras naturales (p.ej. caolines, arcillas, talco, tiza) y polvos de piedra sintéticos (p.ej. ácido silícico altamente disperso, silicatos); emulsionantes, tales como emulsionantes no ionógenos y aniónicos (p.ej. éteres de polioxietileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo) y dispersantes, tales como lejías residuales sulfiticas y metilcelulosa.

Tensoactivos apropiados son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, poliéter alcoholes de alquilarilo, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol, lejías residuales lignino-sulfiticas y metilcelulosa.

Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de punto de ebullición mediano hasta elevado, como p ej. keroseno o aceite diesel, además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina, tetrahidro-  
5 naftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

- 10 Polvos, agentes de pulverización y rociado pueden ser preparados mezclando o moliendo conjuntamente las sustancias activas con un soporte sólido

Los granulados (p ej granulados recubiertos, impregnados o homogéneos) se pueden preparar uniendo el ingrediente activo con un soporte sólido. Ejemplos de cargas sólidas son: tierras minerales, tales como silicagel, ácidos silícicos, geles silícicos, silicatos, talco, caolín, caliza, cal, bol, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, plásticos molidos, así como abonos, tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos vegetales, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras  
15 de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.  
20

Generalmente, las formulaciones contienen entre 0,01 y 95% en peso, preferentemente, entre 0,1 y 90% en peso del ingrediente activo. Los ingredientes activos se usan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, de 95% a 100% (según espectro de  
25 NMR).

39  
80

Ejemplos de formulaciones son: 1 Productos para la dilución con agua

A) Concentrados solubles en agua (SL)

- 5 10 partes en peso de los ingredientes activos son disueltas en agua o en un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se pueden adicionar humectantes u otros auxiliares. El ingrediente activo se disuelve cuando es diluido con agua.

B) Concentrados dispersables (DC)

10

20 partes en peso de los ingredientes activos son disueltas en ciclohexanona adicionando un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión.

15 C) Concentrados emulsionables (EC)

15 partes en peso de los ingredientes activos son disueltas en xileno adicionando dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión.

20

D) Emulsiones (EW, EO)

- 40 partes en peso de los ingredientes activos son disueltas en xileno adicionando dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (al 5% respectivamente). Esta mezcla es introducida en agua por medio de un emulsionante (Ultraturax) y
- 25

transformada en una emulsión homogénea. Diluyendo con agua, se obtiene una emulsión

E) Suspensiones (SC, OD)

5

En un molino de bolas se trituran 20 partes en peso de los ingredientes activos adicionando un dispersante, humectante y agua o un disolvente orgánico, obteniéndose una suspensión fina de ingrediente activo. Diluyendo con agua, se obtiene una suspensión estable del ingrediente activo.

10

F) Granulados dispersables en agua y granulados solubles en agua (WG, SG)

50 partes en peso de los ingredientes activos son molidas finamente, adicionando dispersantes y humectantes, y transformadas en granulados dispersables en agua o solubles en agua mediante dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusora, torre de pulverización, lecho fluidizado). Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable del ingrediente activo.

15

G) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP)

20

75 partes en peso de los ingredientes activos son molidas en un molino de rotor-estator adicionando dispersante, humectantes y gel de sílice. Diluyendo con agua, se obtiene una dispersión o solución estable con el ingrediente activo.

## 2. Productos para la aplicación directa

### H) Polvos pulverizables (DP)

- 5 5 partes en peso de los ingredientes activos son molidas finamente y mezcladas íntimamente con 95% de un caolín finamente dividido. Se obtiene un polvo pulverizable.

### I) Granulados (GR, FG, GG, MG)

- 10 0,5 partes en peso de los ingredientes activos son molidas finamente y asociadas con 95.5% de soporte. Métodos actuales son: extrusión, secado por pulverización y lecho fluidizado. Se obtienen granulados que pueden ser aplicados sin dilución.

### J) Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

- 15 10 partes en peso de los ingredientes activos son disueltas en un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. Se obtiene un producto que puede ser aplicado sin dilución.

Los ingredientes activos pueden ser usados como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas, por ejemplo, como soluciones, polvos, geles, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite directamente pulverizables, pastas, productos de empolvado, materiales de extensión, granulados, microcápsulas (CS), pellets o tabletas, por pulverización, atomización, empolvado, extensión o regado. Las formas de aplicación dependen enteramente del fin de aplicación, pero en todo caso hay que asegurar una

20

25 distribución lo más fina posible de los ingredientes activos según la invención.

Las formas de aplicación acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) adicionando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite se pueden homogeneizar las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente en  
5 agua con la ayuda de un humectante, agente adherente, dispersante o emulsionante. Alternativamente, se pueden preparar concentrados compuestos de la sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante, en caso dado, disolvente o aceite, y tales concentrados son apropiados para ser diluidos con agua.

- 10 Las concentraciones en ingrediente activo en las preparaciones listas para el uso pueden variar ampliamente. En general, varían de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a 1%

Los ingredientes activos también pueden ser usado con éxito en el procedimiento de  
15 volumen ultrabajo (ULV), pudiéndose aplicar formulaciones con más del 95% en peso de ingrediente activo, o aún el ingrediente activo sin aditivos.

A los ingredientes activos se pueden adicionar varios tipos de aceite, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, u otros pesticidas o bactericidas, en caso dado,  
20 recién antes de la aplicación. Estos agentes pueden ser mezclados con los agentes según la invención en una relación ponderal de 1:10 hasta 10:1

Los compuestos de la fórmula I son efectivos tanto mediante contacto directo como indirecto e ingestión y también por trofalaxis y transferencia.

Métodos de aplicación preferidos son en cuerpos de agua, por suelos, grietas y ranuras, praderas, estiércoles, desagüaderos, en agua, sobre el suelo, paredes, o mediante pulverización perimetral y cebo.

- 5 Según una variante preferida de la invención se aplican los compuestos de la fórmula I sobre el suelo. La aplicación sobre el suelo es especialmente apropiada contra hormigas, termites, avispas, grillos o cucarachas.

- Según una variante preferida de la invención, para ser usados contra plagas no agrícolas, tales como hormigas, termites, avispas, moscas, mosquitos, grillos, langostas, cucarachas y termobia doméstica, se preparan los compuestos de la fórmula I en una preparación de cebo
- 10

- El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (p.ej. un gel). Cebos sólidos pueden ser conformados en varios diseños y formas apropiadas para la aplicación respectiva, p.ej. granulados, bloques, barritas, discos. Cebos líquidos pueden ser llenados en diferentes dispositivos para asegurar una aplicación correcta, p.ej. contenedores, dispositivos de pulverización, fuentes de goteo o fuentes de evaporación.
- 15

- Geles pueden basarse en matrices acuosas o aceitosas y pueden ser formuladas según las demandas específicas con respecto a la pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento
- 20

El cebo usado en la composición es un producto que es suficientemente atractivo para los insectos a atraer, como p.ej. hormigas, termites, avispas, mosquitos, grillos, etc o

para cucarachas para comerlo. El cebo puede ser seleccionado de entre estimulantes de alimentación o para y/o feromonas sexuales. Estimulantes de alimentación apropiados se seleccionan, por ejemplo, de entre las proteínas animales y/o vegetales (carne, pescado o sangre, partes de insectos, polvos para grillos, yema de huevo),  
5 grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono, oligo o poliorganosacáridos, especialmente, sucrosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o melasa o miel, sales, tales como sulfato de amonio, carbonato de amonio o acetato de amonio, partes de frutas frescas o podridas, productos agrícolas, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos, también pueden servir de estimulante de  
10 comida. Las feromonas son más específicos para insectos. Feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas al pento.

Formulaciones de compuestos de la fórmula I, tales como aerosoles (p ej. en latas de pulverización), esprays de aceite o de bombeo son excelentemente apropiadas para  
15 usuarios no profesionales para controlar pestes, tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos, langostas o cucarachas. Recetas de aerosol se componen, preferentemente, del compuesto activo, disolventes, tales como alcoholes inferiores (p ej. metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (p ej. acetona, metil etil cetona), parafina hidrocarburos (p.ej querosenos) con intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a  
20 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno, agua, además, auxiliares, tales como emulsionantes, como p.ej monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo con 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume, tales como aceites esenciales, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo  
25 aromáticos, en caso dado, estabilizantes, tales como benzoato de sodio, tensoactivos

85  
86

anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, impelentes, tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, éter dimetilico, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

- 5 Las formulaciones de pulverización de aceite se diferencian de las recetas de aerosoles en que no se usan impelentes.

Los compuestos de la fórmula I y sus respectivas composiciones pueden ser usados en serpentines para mosquitos y serpentines de fumigación, cartuchos de humo, platos de vaporización, vaporizadores de largo plazo u otros sistemas de vaporización independientes de calor.

Métodos para controlar enfermedades infecciosas, transmitidas por insectos (p ej malaria, dengue y fiebre amarilla, filarisis linfática, y leishmaniasis) con compuestos de la fórmula I y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento de superficies de cabañas o casas, la pulverización del aire e impregnación de cortinas, toldos, artículos de vestir, mosquiteros, trampas para moscas tsetse o similares. Composiciones insecticidas para ser aplicadas sobre fibras, tejidos, tricotados, no tejidos, mallas o láminas y telas impermeables contienen, preferentemente, una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente, un repelente y, por lo menos un aglutinante.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se efectúa, generalmente, sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o pulverizándolo sobre las redecillas.

76  
07

La siguiente lista de fungicidas que pueden ser usadas en combinación con los compuestos según la invención es ilustrativa de las combinaciones posibles pero no debe entenderse como limitativa.

- 5 organofosfatos acefato, azinfos-metilo, cloropirifos, clorofenvinfos, diazinona, dichlorvos, dicrotofos, dimethoato, disulfotona, etona, fenitrothiona, fentiona, isoxationa, malathion, metamidofos, metidationa, metil-parationa, mevinfos, monocrotofos, oxidemetonametilo, paraoxona, parationa, fentoato, fosadona, fosmet, fosfamidona, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, protiofos, sulprofos, terbufos, triazofos, trclorofona,
- 10 carbamatos: alanícarb, benfuracarb, carbarilo, carbosulfan, fenoxiícarb, furatiocarb, indoxacarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimícarb, propoxur, tiodicarb, triazamato,
- piretroides: bifentrina, cflutrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, cihalotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, tralometrina, zeta-cipermetrina;
- 15 reguladores del crecimiento artrópodos: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzolureas: clorofluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, teflubenzurona, trflumurona; buprofecina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clofentacina; b) antagonistas de ecdisona: halofenocida, metoxifenocida, tebufenocida, c) juvenoides: piriproxiifeno, metopreno, fenoxiícarb; d) inhibidores de la biosíntesis lípida: espiroclifeno;
- 20

neonicotinoides: acetamiprida, clotianidina, flonicamida, imidacloprida, nitenpiram, tiametoxam, tiametoxam;

Vanos: abamectina, acequinocilo, amitraz, azadiractina, bifenazato, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus subtilis*, cartap, clorfenapir, clorodimeform, ciromacina, diafenthiurona, dinetofurano, diofenolano, emamectina, endosulfana, etiprol, fenazaquina, fipronilo, formetanato, formetanato clorhidrato, hidrametilnona, indoxacarb, 4-((2Z)-2-((4-(trifluorometoxi)anilino) carbonil) hidrazono)-2-[3-(trifluorometil)-fenil]etil} benzo-nitrilo, piridabeno, pimetrocina, espinosad, azufre, tebufenpirada y tiociclam

10

Los insectos pueden ser controlados contactando el parásito/peste destino, su suministro de comida, habitat, terreno de cría o su loci con una cantidad efectiva pesticida de compuesto o composiciones de la fórmula I.

15 "Loci" quiere decir un habitat, terreno de cría, suelo, área, material o medio ambiente donde un peste o parásito crece o puede crecer.

Generalmente, "cantidad efectiva pesticida" significa una cantidad de ingrediente activo, necesano para alcanzar un efecto notable sobre el crecimiento, inclusive los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o la disminución de la presencia y actividad del organismo destino. La cantidad pesticida efectiva puede variar para los diferentes compuestos/composiciones según la invención. Una cantidad pesticida efectiva de las composiciones también puede variar dependiendo de las condiciones prevalecientes, por ejemplo el efecto pesticida deseado y la duración, el tiempo, las especies destino, loci, modo de aplicación, etc.

25

88  
19

Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones pueden ser usados para proteger materiales de madera, tales como árboles, estacadas, durmientes, etc y edificios, tales como casas, retretes exteriores, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc frente a

5 hormigas y/o termites, y para controlar hormigas y termites de causar daños en cultivos y seres humanos (p.ej. cuando los pestes entran en casas y edificios públicos). Los compuestos de la fórmula I se aplican no solamente sobre la superficie del suelo rodeante o el sub-suelo para proteger materiales de madera, sino también pueden ser aplicados sobre artículos de carpintería, tales como superficies de subsuelos de hormigón, pos-

10 tes de hornacinas, vigas, madera contrachapeada, muebles, etc., artículos de madera, tales como tableros de virutas, tableros medios, etc., artículos de vinilo, tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, materiales de aislamiento térmico, tales como espumas de estireno, etc. En caso de la aplicación contra hormigas que causan daños en cultivos y a seres humanos, se aplica la composición de la presente

15 invención directamente sobre el hormiguero o sus alrededores o mediante contacto de cebo.

Los compuestos o las composiciones de la invención pueden ser aplicados preventivamente a los lugares en que se cuenta con la aparición de pestes.

20 En el caso del tratamiento del suelo o de una aplicación sobre los lugares donde viven los pestes o sus nidos, varía la cantidad de aplicación de ingrediente activo de 0.0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferentemente, de 0.001 a 20 g por 100 m<sup>2</sup>. Una modalidad especialmente preferida de la presente invención es el tratamiento del suelo en caso de termites (isópteros).

Cantidades de aplicación habituales para la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0.01 g a 1000 g de compuesto activo por m<sup>2</sup> de material tratado, preferentemente, de 0.1 g a 50 g por m<sup>2</sup>.

- 5 Composiciones insecticidas destinadas a ser usadas para la impregnación de materiales contienen, típicamente, de 0.001 a 95% en peso, preferentemente, de 0.1 a 45% en peso, y muy preferentemente, de 1 a 25% en peso de por lo menos un repelente y / o insecticida
- 10 En composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo oscila de 0.0001% en peso a 15% en peso, preferentemente, de 0.001% en peso a 5% en peso de compuesto activo. La composición usada puede contener también otros aditivos, tales como disolventes del material activo, un sabor, agente de conservación, colorante o agente amargo. Su atraktividad puede ser incrementada por medio de un color especial, una forma o textura especial
- 15

En composiciones de spray, el contenido en ingrediente activo puede oscilar de 0.001 a 80% en peso, preferentemente, de 0.01 a 50% en peso y, muy preferentemente, de 0.01 a 15% en peso

## Ejemplos de la acción contra pestes

## Metodología de ensayo

- 5    1.    Actividad contra la hormiga argentina, hormiga acróbata, hormiga carpintera, hormiga brava, mosca doméstica, mosca de los establos, moscón gris de la carne, mosquito de fiebre amarilla, mosquito doméstico, mosquito de malaria, cucaracha alemana, piojo del gato y garrapata del perro por medio de contacto con vidrio
- 10    Viales de vidrio (viales de centelleo de 20 ml) se trataron con 0.5 ml de una solución de ingrediente activo. Cada vial se hizo rodar sin tapa durante aprox. 10 minutos para que el ingrediente activo recubriera completamente el vial y para que la acetona se secara completamente. Los insectos o garrapatas se colocaron en cada vial. Los viales se mantuvieron a 22 °C y se observaron para determinar los efectos del tratamiento
- 15    en diferentes intervalos de tiempo. Los resultados están resumidos en la Tabla I.
2.    Actividad contra la hormiga argentina, hormiga acróbata, hormiga carpintera, hormiga brava y la hormiga blanca subterránea por medio de contacto con el suelo
- 20    Para las hormigas se efectuaron los ensayos en placas de Petri. Sobre las placas se repartió una capa delgada de 1% de agar en agua y se recubrió el agar con tierra arenosa de Flonda (5 g para placas pequeñas y 11 g para las placas más grandes). El ingrediente activo se disolvió en acetona y se vertió sobre la arena. Las placas fueron ventiladas para que la acetona se evaporara, luego infestadas con hormigas y cubier-
- 25    tas. Sobre cada placa se colocó, entonces una solución de miel al 20% en agua. Las

ST  
92

placas se mantuvieron a 22°C y se observaron para determinar la mortalidad en diferentes intervalos de tiempo.

Para las hormigas blancas se recubrieron las placas de Petri con una capa delgada de 1% de agar. Para el tratamiento del suelo se diluyó en ingrediente activo en acetona en relación peso por peso y se incorporó en 100 g de suelo. Se colocó el suelo en un frasco y se ventiló durante 48 horas. El nivel de humedad del suelo se reguló a capacidad de campo agregando 7 ml de agua. Las hormigas obreras se introdujeron en cada placa. Después de 1 día se colocó una pieza de papel de filtro como fuente de comida sobre cada placa y se agregó más agua en cantidad suficiente para mantener la humedad del suelo. Las placas de ensayo se guardaron en un incubador oscuro a 25°C y aprox. 80% de humedad relativa del aire. Las hormigas blancas se observaron diariamente para determinar la mortalidad (animales muertos o incapaces de quedarse parados y mostrando únicamente un débil movimiento). Los resultados se indican en la Tabla I.

3. Actividad contra la hormiga argentina, hormiga acróbata, hormiga carpintera, hormiga brava, mosca doméstica, hormiga blanca subterránea del este, hormiga blanca subterráneas de Formosa y cucaracha alemana por medio de cebo

20

Para las hormigas argentinas, hormigas acróbatas y hormigas carpinteras se efectuaron los ensayos en placas de Petri. Se dió una fuente de agua a las hormiga y luego se dejaron sin fuente de alimentación durante 24 horas. Se prepararon cebos con cada vez soluciones de 20% de miel/agua o comida para gatos molida. Se agregó ingrediente activo en acetona al cebo. Se agregaron 0.2 ml de solución de miel y agua trata-

25

da o 150 mg de comida para gatos tratada en una tapa sobre cada placa. Luego se cubrieron las placas y se mantuvieron a una temperatura de 22°C. Se observaron las hormigas para determinar la mortalidad. Los resultados se indican en la Tabla I.

- 5 Para las hormigas bravas se usó maíz triturado como matriz de cebo. Se prepararon los cebos de maíz triturado usando una mezcla de maíz triturado desgrasado (80%), aceite de soja (19.9%), acetona y el ingrediente activo (0.1%). Se dotó las placas de vidrio con una fuente de agua. Entonces se colocaron hormigas bravas adultas sobre cada placa. Al día siguiente se colocaron 250 mg de cebo en contenedores para cebos
- 10 sobre las placas. Se observaron las hormigas diariamente para determinar la mortalidad. Los resultados se encuentran en la Tabla I.

- Para moscas domésticas se efectuaron ensayos con cebo con moscas adultas de 2-5 días post-emergencia. Sobre una matriz de cebo compuesta de una mezcla 1:1 de
- 15 leche en polvo y azúcar se aplicó ingrediente activo en acetona y entonces se dejó secar. Los ensayos se realizaron en frascos con 250 mg de cebo en un tarrito colocado en el fondo de cada frasco. Se colocaron moscas domésticas en los frascos con los cebos y se cubrieron los frascos. Se mantuvieron los frascos a 22°C. Se observaron los frascos de ensayo 4 horas después del tratamiento para ver si los animales esta-
  - 20 ban tumbados (muerte más morbilidad (incapaces de quedarse parados). Los resultados se indican en la Tabla I.

- Para los termites se aplicó el ingrediente activo sobre papeles de filtro. La cantidad en ingrediente activo se calculó como porcentaje en peso del papel de filtro. Para controles
- 25 no tratados se aplicó únicamente acetona. Se ventilaron los papeles tratados para que

se evaporara la acetona, se humedecieron con ml de agua y se colocaron sobre placas de Petri con arena. Se agregó agua durante el ensayo en la medida necesaria. Se realizaron ensayos biológicos con un filtro tratado y aprox, 30 termes obreras por placa de Petri. Las placas de ensayo se mantuvieron a 25°C y aprox 85% de humedad relativa y se observaron en cuanto a la mortalidad diaria (insectos muertos o moribundos) o intoxicación. Se quitaron diariamente los animales muertos o moribundos. Los resultados se indican en la Tabla I.

Para las cucarachas se usaron cajas de plástico para cucarachas con tapas ventiladas como arenas de ensayo. Los 3-4 cm superiores de las arenas se trataron con vaselina y aceite mineral para impedir que las cucarachas escaparan. Se dió agua en cantidad necesaria. Se preparó el cebo usando comida para gatos molida y se incorporó el ingrediente activo en acetona en relación de peso por peso. Se dejó secar la comida. Se colocaron las cucarachas en las cajas y antes de introducir el cebo se hicieron ayunar 24 horas. Se colocaron 0.03 gramos de cebo por caja en una navícula de pesar. Las cajas se mantuvieron a 22°C y se observaron en cuanto a la mortalidad diaria de las cucarachas. Los resultados se indican en la Tabla I.

4. Actividad contra el mosquito de la fiebra amarilla, mosquito doméstico del sur y las larvas del mosquito de malaria por tratamiento del agua

Se usaron placas de pocillos como arena de ensayo. El ingrediente activo se disolvió en acetona y se diluyó con agua para obtener la concentración necesaria. Las soluciones finales, que contenían aprox 1% de acetona, se colocaron en cada pocillo. A cada pocillo se agregaron aprox 10 larvas de mosquito (fase cuarta) en 1 ml de agua. Las

94  
95

larvas se dieron de comer una gota de polvo de hígado cada día. Se cubrieron las placas y se mantuvieron a 22°C Se registró la mortalidad diariamente y se eliminaron cada día las larvas o ninfas muertas. Las larvas todavía vivas restantes al final del ensayo se registraron y se calculó el porcentaje de mortalidad. Los resultados figuran en

5 la Tabla I.

Cada ensayo se replicó por lo menos tres veces.

Resultados

10

Ensayos efectuados con los compuestos de las fórmulas I-1 y I-2 presentan los resultados siguientes:

Tabla I. Actividad contra varias especies.

15

| Denominación común del peste              | Denominación latina del peste    | Canti-<br>dad | Días o horas hasta al-<br>canzar una mortalidad<br>de un 100% |
|-------------------------------------------|----------------------------------|---------------|---------------------------------------------------------------|
| Actividad por medio de contacto de vidrio |                                  |               |                                                               |
| hormiga argentina                         | <i>Linepithema humile</i>        | 10 ppm        | 1-2 días                                                      |
| hormiga cosechera                         | <i>Pogonomyrmex californicus</i> | 10 ppm        | 2-3 días                                                      |
| hormiga acróbata                          | <i>Crematogaster spp.</i>        | 10 ppm        | 1-2 días                                                      |
| hormiga carpintera                        | <i>Camponotus floridanus</i>     | 10 ppm        | 1 día                                                         |
| hormiga brava                             | <i>Solenopsis invicta</i>        | 10 ppm        | 4 horas                                                       |
| mosca doméstica                           | <i>Musca domestica</i>           | 10 ppm        | 4 horas                                                       |
| mosca de los establos                     | <i>Stomoxys calcitrans</i>       | 10 ppm        | 4 horas                                                       |
| moscón gris de la carne                   | <i>Sarcophaga sp</i>             | 10 ppm        | 4 horas                                                       |
| mosquito de la fiebre amarilla            | <i>Aedes aegypti</i>             | 10 ppm        | 4 horas                                                       |
| mosquito doméstico                        | <i>Culex quinquefasciatus</i>    | 0.5 ppm       | 4 horas                                                       |

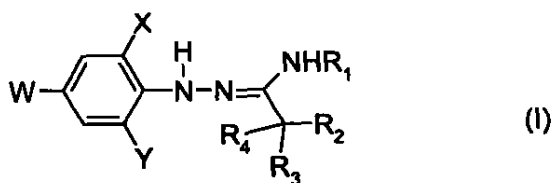
| Denominación común del peste                 | Denominación latina del peste         | Canti-<br>dad     | Días o horas hasta al-<br>canzar una mortalidad<br>de un 100% |
|----------------------------------------------|---------------------------------------|-------------------|---------------------------------------------------------------|
| mosquito de malaria                          | <i>Anopheles albimanus</i>            | 1 ppm             | 1 día                                                         |
| cucaracha alemana                            | <i>Blattella germanica</i>            | 100 ppm           | 5-24 horas                                                    |
| piojo del gato                               | <i>Ctenocephalides felis</i>          | 100 ppm           | 2 días                                                        |
| garrapata del perro                          | <i>Rhipicephalus san-<br/>guineus</i> | 10 ppm            | 3-5 días                                                      |
| Actividad por medio de contacto con el suelo |                                       |                   |                                                               |
| hormiga argentina                            | <i>Linepithema humile</i>             | 0.1% en<br>peso   | 1-2 días                                                      |
| hormiga acróbata                             | <i>Crematogaster spp</i>              | 0.01% en<br>peso  | 2 días                                                        |
| hormiga carpintera                           | <i>Camponotus flondanus</i>           | 0.01% en<br>peso  | 1 día                                                         |
| hormiga brava                                | <i>Solenopsis invicta</i>             | 0.01% en<br>peso  | 1 día                                                         |
| hormiga blanca subte-<br>rránea              | <i>Reticulitermes flavipes</i>        | 0.005%<br>en peso | 1-3 días                                                      |
| Actividad por medio de cebo                  |                                       |                   |                                                               |
| hormiga argentina                            | <i>Linepithema humile</i>             | 1.0% en<br>peso   | 2-3 días                                                      |
| hormiga acróbata                             | <i>Crematogaster spp.</i>             | 1.5% en<br>peso   | 6-7 días                                                      |
| hormiga carpintera                           | <i>Camponotus flondanus</i>           | 2.0% en<br>peso   | 1-3 días                                                      |
| hormiga brava                                | <i>Solenopsis invicta</i>             | 0.7% en<br>peso   | 3 días                                                        |
| mosca doméstica                              | <i>Musca domestica</i>                | 0.1% en<br>peso   | 3 horas                                                       |
| hormiga blanca subte-<br>rránea              | <i>Reticulitermes flavipes</i>        | 0.1% en<br>peso   | 1-2 días                                                      |
| terme de Formosa                             | <i>Coptotermes forma-<br/>nus</i>     | 0.1% en<br>peso   | 5 días                                                        |
| Cucaracha alemana                            | <i>Blattella germanica</i>            | 0.3% en<br>peso   | 1-2 días                                                      |

96  
97

| Denominación común del peste           | Denominación latina del peste | Canti-<br>dad | Días o horas hasta al-<br>canzar una mortalidad<br>de un 100% |
|----------------------------------------|-------------------------------|---------------|---------------------------------------------------------------|
| Actividad por medio de water treatment |                               |               |                                                               |
| yellowfever mosquito                   | <i>Aedes aegypti</i>          | 10 ppm        | 2 días                                                        |
| mosquito doméstico                     | <i>Culex quinquefasciatus</i> | 10 ppm        | 1 día                                                         |
| mosquito de malaria                    | <i>Anopheles albimanus</i>    | 1.0 ppm       | 1 día                                                         |

## Reivindicaciones

- 1      Uso de compuestos de la fórmula I



5

donde

W    es cloro o trifluorometilo;

- 10      X e Y significan, independientemente, cloro o bromo,

R<sup>1</sup>    es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, o  
cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, o  
alquilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> sustituido por alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

15

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> significan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o pueden formar juntos cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, que  
puede ser no sustituido o estar sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno,

R<sup>4</sup>    es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>,

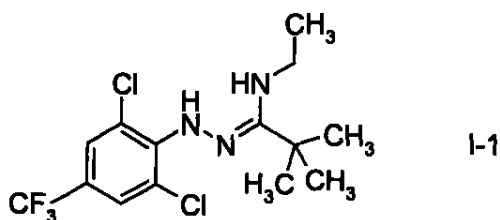
20

o los enantiómero o las sales de los mismos,

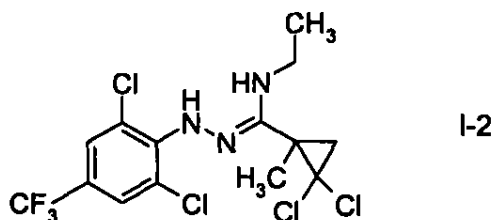
para combatir pestes no agrícolas.

98  
99

2. El uso según la reivindicación 1, en donde los pestes no agrícolas son seleccionados del grupo que abarca la clase de los quilópteros y diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, furápteros, araneida, parasitiformes y acáridos
3. El uso según las reivindicaciones 1 ó 2, en donde los pestes no agrícolas son seleccionados del orden de los isópteros, blattana (blattodea), dípteros, himenópteros, sifonápteros, ortópteros e ixódidos
4. El uso de los compuestos de la fórmula I según la reivindicación 1 para la protección de materiales orgánicos no vivos
5. El uso según la reivindicación 4 para la protección de materiales orgánicos no vivos frente a pestes no agrícolas seleccionados del grupo que comprende la clase de los diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattana (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros y tisanura.
6. El uso según las reivindicaciones 1 a 5, en donde el compuesto de la fórmula I es un compuesto de la fórmula I-1.



7. El uso según las reivindicaciones 1 a 5, en donde el compuesto de la fórmula I es un compuesto de la fórmula I-2.



- 5 8 Un método para controlar plagas no agrícolas, que consiste en contactar las plagas, su suministro de comida, hábitat, terreno de cría o su local con una cantidad efectiva pesticida de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1, 6 ó 7.
- 10 9. Un método según la reivindicación 8, en donde las plagas no agrícolas son seleccionados del grupo que abarca la clase de los quilópodos y diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, fitirápteros, araneida, parasitiformes y acáridos.
- 15 10. Un método según las reivindicaciones 8 ó 9, en donde las plagas no agrícolas son seleccionados del orden de los isópteros, blattaria (blattodea), dípteros, himenópteros, sifonápteros, ortópteros e ixódidos.
- 20 11. Un método para la protección de materiales orgánicos no vivos frente a plagas no agrícolas seleccionados del grupo, que comprende la clase de los quilópodos y diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, fitirápteros, ara-

neida, parasitiformes y acáridos, que consiste en contactar los pestes o su suministro de comida, habitat, terrenos de cría, su loci o los materiales orgánicos no vivos con una cantidad efectiva pesticida de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1, 6 ó 7.

5

12. Un método para la protección de animales contra pestes no agrícolas seleccionadas de la clase de los quilópteros y diplópodos y el orden de los isópteros, dípteros, blattaria (blattodea), dermápteros, hemípteros, himenópteros, ortópteros, sifonápteros, tisanura, ftirápteros, araneida, parasitiformes y acáridos, que consiste en tratar los pestes en cuerpos de agua y/o en y alrededor de edificios con una cantidad efectiva pesticida de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1, 6 ó 7

10

- 13 Un método según la reivindicación 12, en donde los pestes no agrícolas son seleccionados del grupo que abarca el orden de los dípteros, ftirápteros y parasitiformes.

15

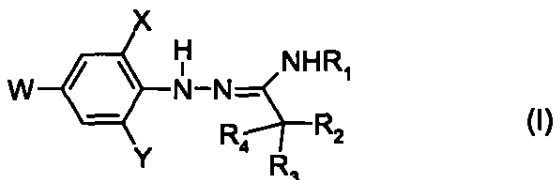
- 14 Un composición de cebo, que comprende una cantidad efectiva pesticida de un compuesto de la fórmula I según las reivindicaciones 1, 6 ó 7 y un atrayente.

20

Uso de derivados de N-arilhidracina para combatir pestes

## Resumen

### 5 Uso de derivados de hidracina de la fórmula I:



donde

10 W es cloro o trifluorometilo,

X e Y significan, independientemente, cloro o bromo,

R<sup>1</sup> es alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, o alquilo sustituido por alcoxi;

15 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> significan alquilo o pueden formar juntos cicloalquilo, que puede ser no sustituido o estar sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno;

R<sup>4</sup> es hidrógeno o alquilo,

o los enantiómero o las sales de los mismos,

para combatir pestes no agrícolas

20 Uso de los compuestos de la fórmula I para la protección de materiales orgánicos no vivos y para la protección de animales frente a pestes no agrícolas.

## PATENT COOPERATION TREATY

## 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<br>0000055118                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | <b>FOR FURTHER ACTION</b><br>See Form PCT/PEA416                                                                                                               |                                              |
| International application No<br>PCT/EP2004/013687                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | International filing date (day/month/year)<br>02.12.2004                                                                                                       | Priority date (day/month/year)<br>04.12.2003 |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC<br>A01N37/52                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                |                                              |
| Applicant<br>BASF AKTIENGESELLSCHAFT                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                |                                              |
| <p>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</p> <p>2 This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising</p> <p>a. <input type="checkbox"/> sent to the applicant and to the International Bureau) a total of sheets, as follows.</p> <p><input type="checkbox"/> 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).</p> <p><input type="checkbox"/> 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.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (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)</p> |                                                                                                                                                                |                                              |
| <p>4 This report contains indications relating to the following items:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the opinion</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability, citations and explanations supporting such statement</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                |                                              |
| Date of submission of the demand<br><br>11.08.2005                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            | Date of completion of this report<br><br>05.12.2005                                                                                                            |                                              |
| Name and mailing address of the international preliminary examining authority<br> European Patent Office - P.B. 5818 Patentlaan 2<br>NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas<br>Tel +31 70 340 - 2040 Tx 31 651 epo nl<br>Fax +31 70 340 - 3016                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | Authorized Officer<br><br>Fort, M<br><br>Telephone No +31 70 340-4123<br> |                                              |

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT  
ON PATENTABILITY**

International application No.  
PCT/EP2004/013687

103  
104

**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**

1-24 as originally filed

**Claims, Numbers**

1-14 as originally filed

- ☐ 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/EP2004/013687

104  
105

**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 | 1-14 |
|                               | No: Claims  |      |
| Inventive step (IS)           | Yes: Claims | 1-14 |
|                               | No: Claims  |      |
| Industrial applicability (IA) | Yes: Claims | 1-14 |
|                               | No: Claims  |      |

**2. Citations and explanations (Rule 70.7):**

**see separate sheet**

105  
106

**INTERNATIONAL PRELIMINARY  
REPORT ON PATENTABILITY  
(SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2004/013687

**Re Item V**

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

Reference is made to the following documents:

- D1: EP-A-0 604 798 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 6 July 1994 (1994-07-06)
- D2: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; KUHN, D. G. ET AL: "Cycloalkyl-substituted amidrazones: a novel class of insect control agents" XP002330111 retrieved from STN Database accession no. 1998:294837
- D3: DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; FURCH, J. A. ET AL: "Amidrazones: a new class of coleopteran insecticides" XP002330112 retrieved from STN Database accession no. 1998:294826

-Each of the documents D1-D3 discloses the insecticidal and acaricidal activity of compounds of formula (I) and their use for plant protection. The use of said compounds for combatting non-crop pests is not mentioned. The subject-matter of claims 1-14 is therefore new (Article 33(2) PCT).

- The subject-matter of claims 1-14 involves an inventive step in the sense of Article 33(3) PCT for the following reasons:

The present application solves the problem of providing new non-crop pest control agents, exhibiting broad spectrum activity against non-crop pests.

The experimental data demonstrate that the amidrazone of formula (I) are active against a broad spectrum of non-crop species, namely ants, flies, mosquitos, cockroaches, fleas, ticks and termites. Since N-arylamidrazones tested against crop pests have only average or poor activity against one or two insect or acaricid orders (D1) and since specific N-arylamidrazones have been reported as being effective against Coleoptera and/or Lepidoptera depending on the presence and the position of substituents (D2-D3), it could not have been predicted from any of the cited documents or any combination thereof that the amidrazones of formula (I) are effective against a broad spectrum of non-crop pests.

106  
107

**INTERNATIONAL PRELIMINARY  
REPORT ON PATENTABILITY  
(SEPARATE SHEET)**

International application No

**PCT/EP2004/013687**

-The subject-matter of claims 1-14 is considered to be industrially applicable and the present application is therefore considered to satisfy the criterion set forth in Article 33 (4) PCT.

| Expediente No             |                            | 06053415       | No de Folio |
|---------------------------|----------------------------|----------------|-------------|
| Item                      |                            | No de unidades |             |
| 1                         | CD                         |                |             |
| 2                         | DVD                        |                |             |
| 3                         | REVISTA                    |                |             |
| 4                         | LIBRO                      |                |             |
| 5                         | PERIODICO                  |                |             |
| 6                         | DISQUETES                  |                |             |
| 7                         | SOBRE DE MANILA            |                |             |
| 8                         | SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA  | ✓              |             |
| 9                         | SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO | ✓              |             |
| 10                        | OTROS                      |                |             |
| Observaciones: Arte final |                            |                |             |

109

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 36,153  
FECHA : MAYO 15 DE 2006

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
Rad: 06-053415-00000-0000  
Fec 2006-05-02 15 49 46 Dep 2020 NUECREACIONES  
Tra 11 PATENTEIYII  
Eve 379 FASENACIONALI  
Act 111 PRESENTACION Folios 109

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

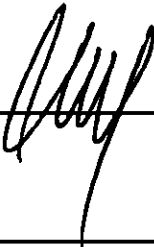
| DEPOSITANTE       | TIPO PAGO    | BANCO         | CUENTA      | No. PAGO | FECHA PGO  | Vr. PAGO      |
|-------------------|--------------|---------------|-------------|----------|------------|---------------|
| CAVELIER ABOGADOS | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 54982575 | 15/05/2006 | 47,972,500.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

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

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : \_\_\_\_\_



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

Colo 00361 - 841 - 109 - 8

Delegatura de Propiedad Industrial  
División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL  
TRAMITE

|                                                                                            | USUARIO | RADICADOR |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|---------|-----------|
| PATENTE DE INVENCION (✓) MODELO DE UTILIDAD ( )                                            | ( )     | ( )       |
| -Indicación de que se solicita la concesión de una patente (✓)                             | ( )     | ( )       |
| -Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud. (✓) | ( )     | ( )       |
| -Descripción de la invención. (✓)                                                          | ( )     | ( )       |
| -Dibujos de ser estos pertinentes. NO                                                      | ( )     | ( )       |
| -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: Junio 02 de 2006.

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI**

Folio 111

2020  
Bogotá D.C.,

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

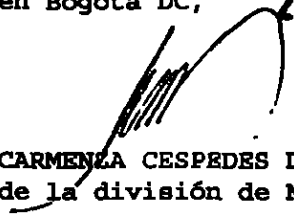
|            |                            |               |
|------------|----------------------------|---------------|
| REFERENCIA | Radicación No.             | 06 53415      |
|            | Solicitud internacional    | EP2004/013687 |
|            | Fecha inicio fase nacional | 05/07/2006    |
|            | Trámite                    | 11            |
|            | Evento                     | 379           |
|            | Actuación                  | 416           |
|            | Oficio No.                 | 742           |
|            | Folios                     | 1             |

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

Cúmplase

Dado en Bogotá DC,

22 JUN. 2006

  
ALIX CARMEN CESPEDES DE VERGEL  
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa11