

06-87361



Industria y Comercio

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

OP

Delegatura de propiedad Industrial

Division de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

- PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL -

06-87361

21 EXPEDIENTE No

54 TÍTULO INSECTICIDAS NUEVOS

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71 SOLICITANTE SYNGENTA PARTICIPATIONS AG y SYNGENTA LIMITED

DOMICILIO Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basilea - SUIZA y
European Regional Centre Priestly Road Surrey Research Park
Guildford Surrey GU2 7YH REINO UNIDO

74 APODERADO DRA MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

22 BOGOTA, D C ,

Publica on
11 13 10 2006

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 **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG y SYNGENTA LIMITED**
Dirección **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, SUIZA y European Regional Centre, Priestly Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH, REINO UNIDO**
Nacionalidad o Domicilio **Basilea, SUIZA y Surrey, REINO UNIDO**
Lugar de Constitución. **Basilea, SUIZA y Surrey, REINO UNIDO**

Teléfono

Fax

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C C

☐

NIT

☐

C E

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO (74)Nombre **MARGARITA CASTELLANOS A.**Dirección **CALLE 94A No. 7A-09**Teléfono **610 7420**Fax: **610 0706**E-mail **info@castellanosyco.com**

IDENTIFICACIÓN

C C

☒

NIT

☐

C E

☐

Otro

☐

Cual

Número **39'779.654** TPA **70.819**

④

INVENTOR (ES) (72)

Nombre: **VER ANEXO No. 1**

Dirección

Nacionalidad o Domicilio **VER ANEXO No. 1**

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No

PCT/EP2005/002204

Fecha

02/03/2005

Publicación Internacional No

WO 2005/085234 A2

Fecha

15/09/2005

⑥

Título (54)

INSECTICIDAS NUEVOS

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07D 403/04, A01N 43/90

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI

☒

NO

☐**GB****GB****GB****03/03/2004****18/05/2004****18/11/2004****0404801.3****0411078.9****0425453.8**

⑨

Comprobante de pago No.

06-65,957

Fecha

Agosto 28 de 2006

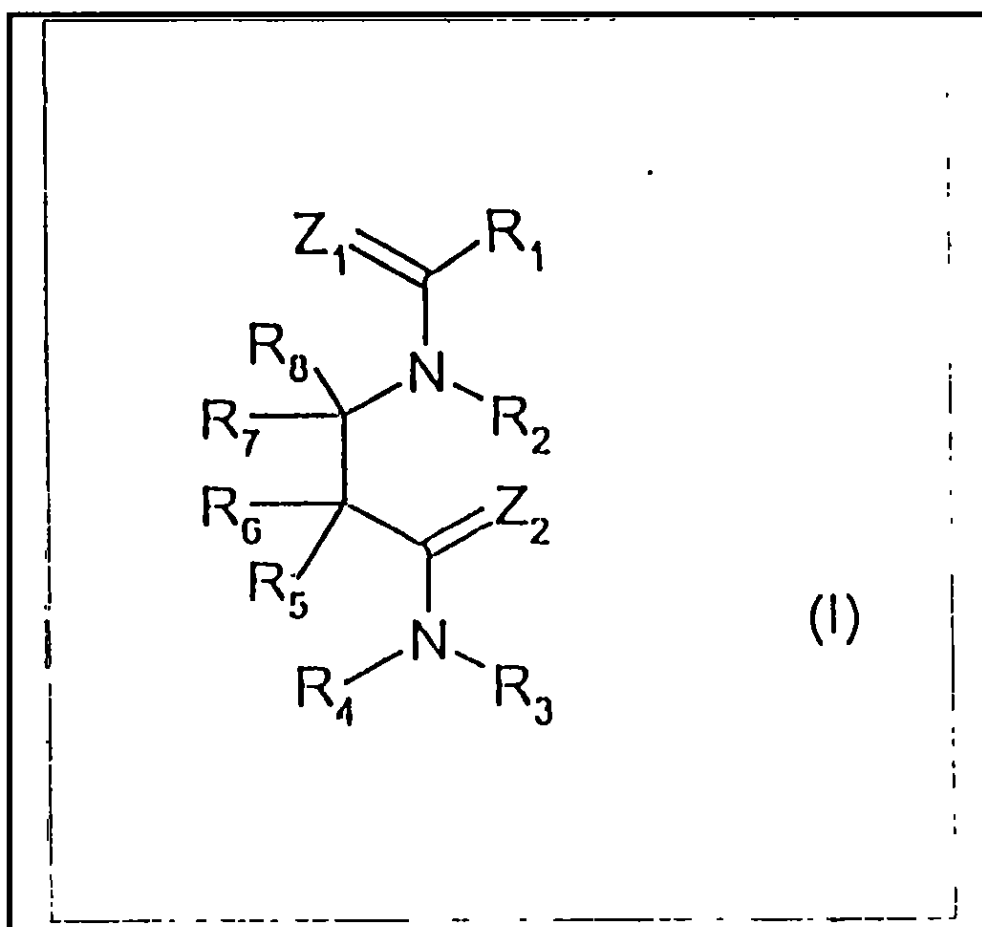
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

10

Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
☒ Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
☐ Declaraciones
☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA)
☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
☒ Arte final 12x12
☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional
☒ Otros Tarjeta de Propietario, Tarjeta Temática, Extracto para la publicación y disquet con el extracto para la publicación

11 FIGURA CARACTERISTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA:

C.C. No 39.779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

01 SET. 2006

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
 Calle 94 A No. 7 A-09
 Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1

INVENTOR(ES) (72)

	NOMBRE	DIRECCION	NACIONALIDAD O DOMICILIO
1	DAVE HUGHES	Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG 42 6E, REINO UNIDO	BRITANICA
2	JAMES EDWARD PEACE	Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG 42 6E, REINO UNIDO	BRITANICA
3	SUZANNA RILEY	Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG 42 6E, REINO UNIDO	BRITANICA
4	SALLY RUSSELL	Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG 42 6E, REINO UNIDO	BRITANICA
5	JOE SWANBOROUGH	Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG 42 6E, REINO UNIDO	BRITANICA
6	ROGER GRAHAM HALL	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	BRITANICA
7	ANDRE JEANGUENAT	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	SUIZA
8	OLIVIER LOISELEUR	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	SUIZA
9	PETER RENOLD	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	SUIZA
10	STEPHAN TRAH	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	SUIZA
11	JEAN WENGER	Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, SUIZA	SUIZA

13

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad 06-087361- -00000-0000
Fec: 2006-08-01 14:41.26 Dep 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTEIYII
Eve 379 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 437

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 65,957
FECHA : AGOSTO 28 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANDS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	48145653	28/08/2006	995,000.00

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

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

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CASTELLANOS & CO
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E S D

Ref **PODER** conferido por la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pié de mi firma, atentamente manifiesto a Uds que sustituyo en la Dra **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, con domicilio en **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, SUIZA**, debidamente legalizado por Apostilla, bajo el No **8117** el día **1° de Abril de 2004**, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, en Colombia, para **"INSECTICIDAS NUEVOS"**.

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C C No **39.773.330** de Usaquén
T P A. No. **58.236** del C.S J
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D C
PBX 6107420


Margarita Castellanos Abondano
C C No **39.779.654** de Usaquén
T.P A. No. **70.819** del C S J
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D C
PBX 6107420

Bogotá, D C.
XCA/MCA/gcb/6066-FNPCT

G/USER/DEPTO PATENTES/PATENTES/60/6066-FNPCT/MEMORIAL SUSTITUCION PODER

**AUTENTICACIÓN DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.P.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Almendra Castellanos Abondano
 identificado con C.C. **39 773 330**
 expedida en **Usaquén** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **58236** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia de Industria**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es suya.

[Firma manuscrita]
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **29 ABO 2006**
 ALGORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

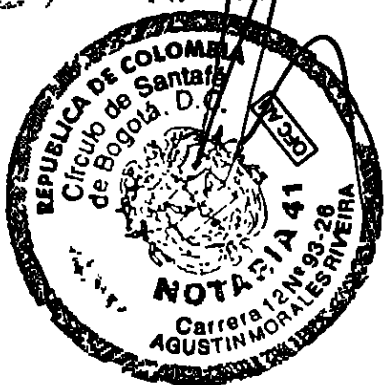


**AUTENTICACIÓN DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.H.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Margarita Castellanos Abondano
 identificado con C.C. **39 774 654**
 expedida en **Usaquén** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **58236** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia de Industria**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es suya.

[Firma manuscrita]
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **29 ABO 2006**
 ALGORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



PODER

POWER OF ATTORNEY

El (los) Gregory W. Warren
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

I (we) the undersigned Gregory W. Warren
Syngenta Participations AG

Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A. abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-Colombia para

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA CASTELLANOS A. and /or MARGARITA CASTELLANOS a. attorneys residing at Carrera 9 No 93-09, Bogota- Colombia, to prosecute

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso -administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:

and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons, specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following.

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos Industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales, su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos, b) Para la obtención de registros sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso - administrativos que promovamos o se nos promuevan; pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir este mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin, the deposit of trade names and emblems; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights, b) For the obtention of Sanitary registrations, c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights, actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

Given and signed this 24th March 2004

en Research Triangle Park, Carolina del Norte 27709
por Gregory W. Warren

In Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren *Gregory W. Warren*

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Notary shall execute on the other side)

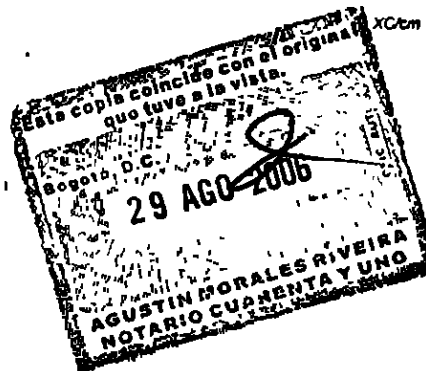
(Se requiere legalización consular)

(Consular legalization required)

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-09- P.O. Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels (571) 610 74 20 / 60 / 60 - Fax (571) 610 07 08 - e-mail acastellanos@impulso.net.co



CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 24 de Marzo del año 2004
compareció(eron) personalmente Gregory W. Warren
a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en
representación de la Sociedad (Compañía denominada
Certifico: Syngenta Participations AG
a) Que es una sociedad/Compañía legalmente
constituida y existente de acuerdo con las leyes de
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el
presente poder están comprendidos dentro del objeto
social de la mencionada Sociedad /Compañía.
d) Que el Sr Gregory W. Warren
esta autorizado para otorgar el presente poder Lo anterior
esta probado por medio de los siguientes documentos, que
certifico he visto*

(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C. HAYES

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL (Corporation)

On this 24th day of March of 2004 personally appeared
Gregory W. Warren whom I know to be the
person(s) who signed this document as representative(s)
of the Corporation /Company named Syngenta
Participations AG

I certify:

- That Syngenta Participations AG is a corporation
(Company legally constituted and in existence in
accordance with the laws of Basel, Switzerland
- That the domicile of said Corporation/Company is
Basel, Switzerland
- That the purpose or purposes for which the present
Power of Attorney is granted are comprised within the
object set forth in the charter of the mentioned
Corporation/Company.
- That Mr. Gregory W Warren
is (are) authorized to grant the present Power of Attorney
The aforementioned was duly proven through the following
documents and I duly certify having seen them* on the
24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North
Carolina 27709.

(City) Research Triangle Park

(State) North Carolina, 27709

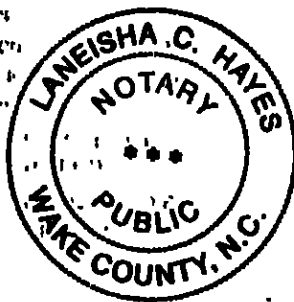
this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public)

Laneisha C. Hayes

*Documents must be identified with date and origin

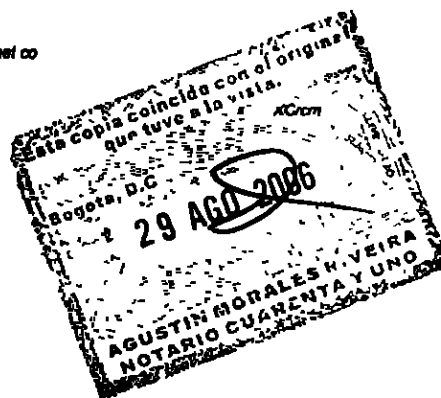
*3/24/04 - Research Triangle
Park, North Carolina
27709 -
Syngenta Biotech, Inc.*



ALVARO CASTELLANOS M. & CIA:

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 63 09- P.O. Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tele (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastellanos@empresal.net.co





Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

STATE OF NORTH CAROLINA

WAKE COUNTY

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

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Laneisha C. Hayes WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS; AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING.

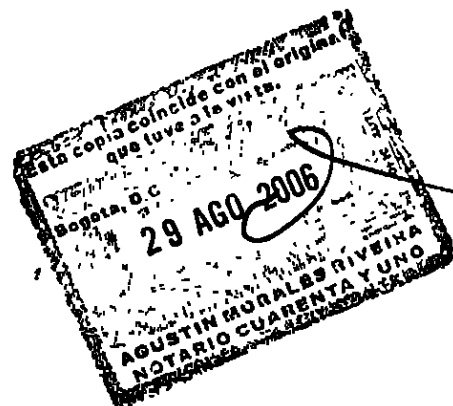
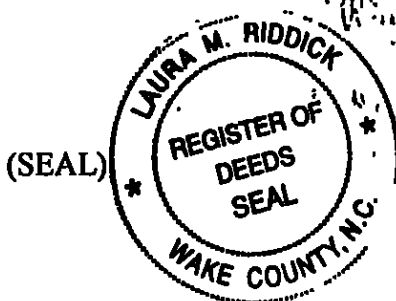
IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.

Laura M. Riddick

REGISTER OF DEEDS

Calvin

DEPUTY / ASSISTANT



APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

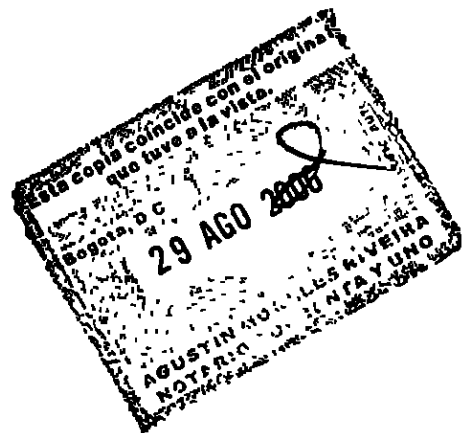
1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by CARLA N. BROWN
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8117
8. No. _____
9. Seal/Stamp:
10. Signature



Robyn S. Medelot



-----TRADUCCION OFICIAL No. -040417-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación
lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res. 2755/68 y
01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta

Participations AG)

(fdo) ilegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

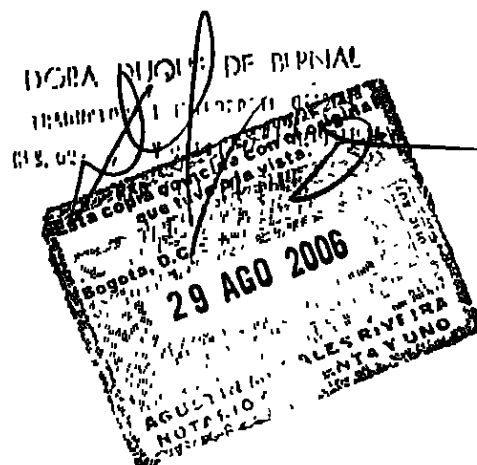
CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado
antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C.
Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Público
debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake,
Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dares plena fe y crédito a
sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia
letra.

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sello de oficio,
hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible



Delegado

APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

1. País: Estados Unidos de América
 2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN
 3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras
 4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras
- Condado de Wake, Carolina del Norte

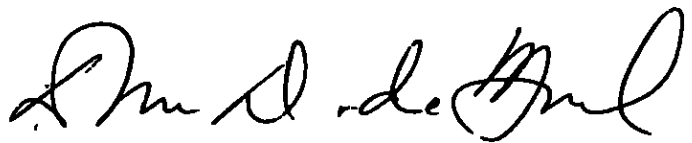
CERTIFICADO

5. En Raleigh. Carolina del Norte
6. el día 1 de Abril de 2004
7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
8. No. 8117
9. Sello: (sello en oblea ocre)
10. Firma

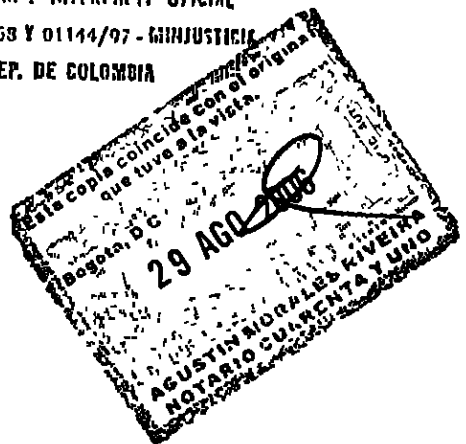
(fdo) Rodney S. Maddox

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004



DOPA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RLS. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA





MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

218902
Dora Duque
SECRETARÍA DE
RELACIONES EXTERIORES
LAS FUENTES DE BOGOTÁ

218902
2:42
JUNES

12

ALVARO CASTELLANOS M & CIA.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A-09
Apartado 6349
PBX: 6107420
Bogotá, D.C. - COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E S D

Ref PODER conferido por SYNGENTA LIMITED

Yo, XIMENA CASTELLANOS ABONDANO, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente manifiesto a Uds que sustituyo en la Dra MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, el poder que me confirió SYNGENTA LIMITED. _____, con domicilio en European Regional Centre, Priestly Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey, GB, debidamente legalizado por Apostilla bajo el No G201564 _____, el día 4 de Julio de 2003 _____, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente — PCT Entrada en Fase Nacional, en Colombia, para: "INSECTICIDAS NUEVOS".—

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C C No 39.773.330 de Usaquén
T P A No 58.236 del C S J
Calle 94 A No 7 A-09 - Bogotá
PBX 610 74 20


Margarita Castellanos Abondano
C C No 39.779.654 de Usaquén
T P A No 70.819 del C S J
Calle 94 A No 7 A-09 - Bogotá
PBX 610 74 20

Bogotá, D C
XCA/MCA/gcb/ 6066-FNPCT

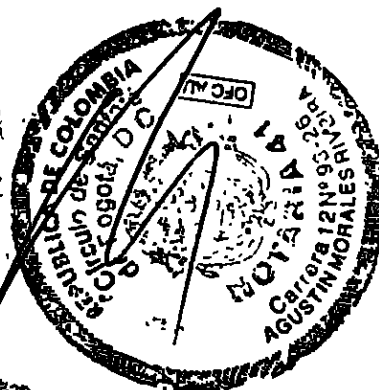
G/USER/DEPTO PAT/PATENTES/60/6066-FNPCT/MEMORIAL SUSTITUCION PODER-2

**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.P.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Antes del Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Almendra Castellano
 identificado con C.C. **3973340**
 expedida en **Medellin** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **58156** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es suya.

Almendra Castellano
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **01 SET. 2006**
 ALGORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

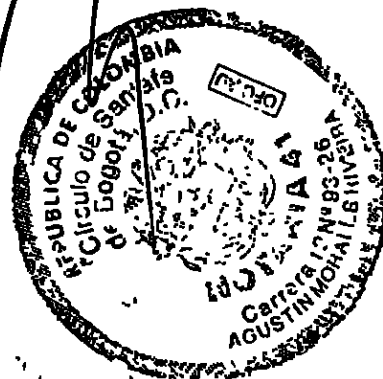


**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.P.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Antes del Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
Margaux Castellano
 identificado con C.C. **3973340**
 expedida en **Medellin** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **70819** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es suya.

Margaux Castellano
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **01 SET. 2006**
 ALGORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



COLOMBIA

PODER

El (los) SYNGENTA LIMITED
Domiciliados en Priestly Road, Surrey
Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH
Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o
MARGARITA CASTELLANOS A. abogadas con oficinas en
la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad
Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para
que nos representen ante cualesquiera autoridades o
personas de los órdenes administrativo, contencioso -
administrativo y judicial en todo lo relacionado con los
siguientes actos y gestiones:

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos
industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio,
colectivas o defensivas y de denominaciones de origen,
depósito de nombres y enseñanzas comerciales; su renovación,
prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o
domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de
uso de esos derechos; b) Para la obtención de registros
sanitarios; c) Acciones de oposición, observación,
cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los
juicios civiles, penales, administrativos o contencioso -
administrativos que promovamos o se nos promuevan,
pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados
sustituir éste mandato, transgír, desistír, recibir, cancelar,
renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados
judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 2 de Julio del 2003

en Bracknell, Reino Unido

por SYNGENTA LIMITED

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular)

Registered Office:
SYNGENTA LIMITED
EUROPEAN REGIONAL CENTRE
PRIESTLY ROAD
SURREY RESEARCH PARK
GUILDFORD
SURREY GU2 7YH
UNITED KINGDOM

I (we) the undersigned SYNGENTA LIMITED
Of

- REINO UNIDO

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA
CASTELLANOS A. and for MARGARITA CASTELLANOS
a. attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-
Colombia, to

and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, for
which purpose we authorize the said attorneys to represent
us before any authorities, or persons, specially those,
administrative, contentious and judicial, in all matters
concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of
trademarks, service, collective and defensive marks, and of
designations of origin; the deposit of trade names and
ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments,
change of name or domicile, voluntary cancellation, and the
registration of licenses of use of the above rights, b) For the
obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition,
cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in
general the civil, criminal and administrative suits related to
those rights, actions and suits instituted by us or against us;
and that in all the above matters they may substitute this
power of attorney, compromise, desist, cancel, receive,
renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact,
in or out of court.

Given and signed this 2nd JULY 2003

in BRACKNELL, UK

by Joanna Chandler

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization required)

JOANNA CHANDLER.

AUTHORISED SIGNATORY.

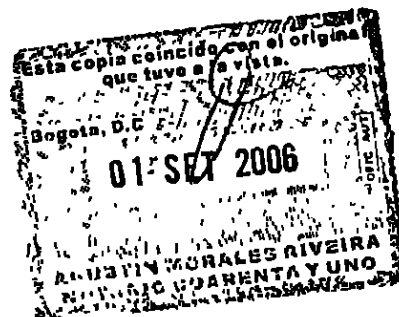
ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-09 - P.O. Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail: acastell@improsat.net.co

XC/cm

37367



COLOMBIA

CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 3 de Jul. del año 2003
compareció (eron) personalmente
a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en
representación de la Sociedad (Compañía denominada
Certifico: SYNGENTA LIMITED
a) Que es una sociedad/Compañía legalmente
constituida y existente de acuerdo con las leyes de
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el
presenta poder están comprendidos dentro del objeto
social de la mencionada Sociedad /Compañía.
d) Que el Sr Joanna Chandler
esta autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior
esta probado por medio de los siguientes documentos, que
certifico he visto* Estatutos de constitución

(Ciudad) Egham

(Estado) Surrey

Hoy 3 del Julio del 2003

(Notario Público)

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL (Corporation)

On this 3rd day of July of 2003
personally appeared JOANNA CHANDLER
whom I know to be the person(s) who signed this
document as representative(s) of the Corporation
/Company named SYNGENTA LTD
I certify:

- That Syngenta is a corporation (Company legally
constituted and in existence in accordance with the
laws of England & Wales
- That the domicile of said Corporation/Company is Guildford UK
- That the purpose or purposes for which the present
Power of Attorney is granted are comprised within
the object set forth in the charter of the mentioned
Corporation/Company.
- That Mr. JOANNA CHANDLER
is (are) authorized to grant the present Power of Attorney.
The aforementioned was duly proven through the
following documents and I duly certify having seen them:
Certificate of Incorporation
(City) Egham

(State) Surrey

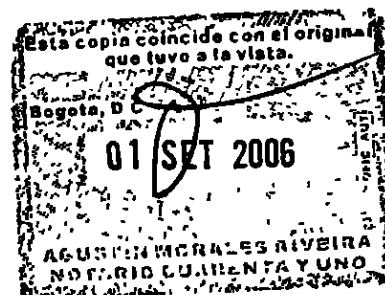
EXECUTION
Certified Verified and Authenticated
this 3 day of 7 of the year 2003
11th 3rd Day of July 2003
K. P. GREENWOOD
NOTARY PUBLIC
K. P. GREENWOOD AND FREEMAN
*Documents must be identified with date and origin

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 60 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail: acastall@pimpma.net.co

XC/cm



APOSTILLE

(Hague Convention of 5 October 1961 / Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

1. Country. United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

This public document / Le présent acte public

2. Has been signed by K Greenwood
a été signé par

3. Acting in the capacity of Notary Public
agissant en qualité de

4. Bears the seal/stamp of The Said Notary Public
est revêtu du sceau/timbre de

Certified/Attesté

5. at London/à Londres

6 the/le 04 July 2003

7. by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal de Sa Majesté aux Affaires Etrangères et du Commonwealth

8. Number/sous No **G201564**

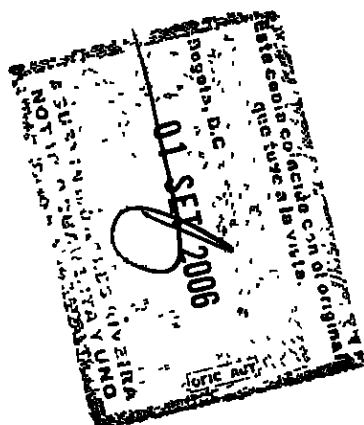
9. Stamp
timbre.

10. Signature J. Ireland



For the Secretary of State / Pour le Secrétaire d'Etat

If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961,
it should be presented to the consular section of the mission representing that country



15
15

-----TRADUCCION OFICIAL No. 03-0718-----

de un documento escrito en INGLÉS, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial , según Resoluciones 2755/68 y 01144/97 del Ministerio de Justicia.

(Anexo a un documento de poder de Syngenta Limited)

AUTENTICACIÓN

Certificado, verificado y autenticado en el pueblo de Egham en Surrey

Hoy día 3 de Julio de 2003.

(fdo) ilegible

Kenneth Greenwood – Notario Público

Horne, Engall and Freeman

(Sello en oblea roja)

APOSTILLA

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

1. País: Reino Unido de Gran Bretaña e Irlanda del Norte

Este documento público

2. ha sido firmado por K. Greenwood

3. actuando en su carácter de Notario Público

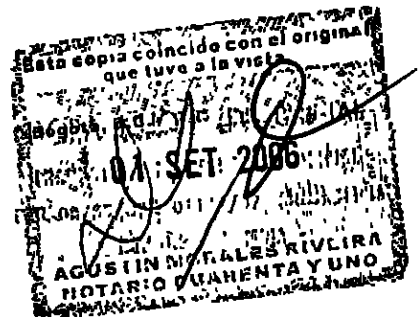
4. lleva el sello de dicho Notario Público

Certificado

5. En Londres

6. el día 4 de Julio de 2003

7. por el Secretario de Estado Principal de Su Majestad para Asuntos Exteriores y de la Comunidad



8 No. G201564

9. Sello

10. Firma: J. Ireland

(fdo) ilegible

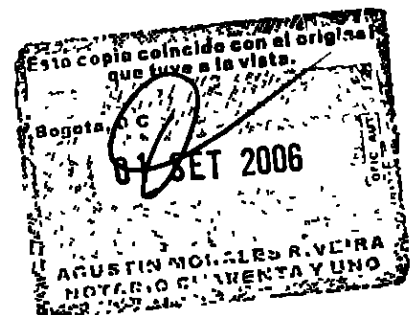
Por el Secretario de Estado

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, D. C., Julio 24, 2003

Dora Duque de Bernal

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01141/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA



ANIZACIONES

Amman

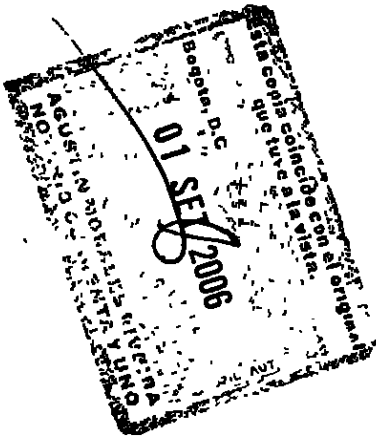
01 JUL 25

CUYA FERIA SE CELEBRA EN EL
DOMINIO DE LA IMPERIAL
LAFERIA DE LOS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL ITCO

2003 JUL 25 P 12:02

LEA
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
15 September 2005 (15.09.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/085234 A2

(51) International Patent Classification⁷: C07D 403/04,
A01N 43/90

(21) International Application Number:
PCT/EP2005/002204

(22) International Filing Date: 2 March 2005 (02 03 2005)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0404801 3 3 March 2004 (03.03.2004) GB
0411078 9 18 May 2004 (18 05 2004) GB
0425453 8 18 November 2004 (18 11 2004) GB

(71) Applicants (for all designated States except US): SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH], Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). SYNGENTA LIMITED [GB/GB], European Regional Centre, Priestley Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH (GB)

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): HUGHES, Dave [GB/GB], Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG42 6E (GB) PEACE, James, Edward [GB/GB], Syngenta Limited, Jealotts Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6E (GB) RILEY, Suzanna [GB/GB], Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG42 6E (GB) RUSSELL, Sally [GB/GB], Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG42 6E (GB) SWANBOROUGH, Joe [GB/GB], Syngenta Limited, Jealotts Hill Int. Research Center, Bracknell, Berkshire RG42 6E (GB) HALL, Roger, Graham [GB/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058

Basel (CH). JEANGUENAT, André [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH) LOISELEUR, Olivier [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH) RENOLD, Peter [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH) TRAH, Stephan [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). WENGER, Jean [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH)

(74) Common Representative: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, Intellectual Property, P.O. Box, CH-4002 Basel (CH)

(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, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

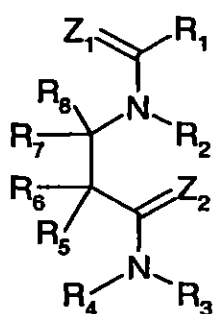
(84) Designated States (unless otherwise indicated for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, 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:

— without international search report and to be republished upon receipt of that report

[Continued on next page]

(54) Title: NOVEL INSECTICIDES



(I)

(57) Abstract: Compounds of the formula (I) in which Z₁ is an oxygen atom, or a sulfur atom; Z₂ is an oxygen atom, or a sulfur atom, R₁ is an aryl or heteroaryl group, which is unsubstituted or substituted, R₂ is hydrogen, or an organic substituent, R₃ is hydrogen, or an organic substituent, R₄ is hydrogen, or an organic substituent, or R₃ and R₄, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring, which is unsubstituted or substituted, R₅ is hydrogen, or an unsubstituted or substituted alkyl group, or forms, taken together with R₆ or with a monovalent substituent attached to that atom of R₆, via which atom R₆ is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R₅, one additional bond, R₆ and R₇, taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, a bicyclic ring system, which ring system is carbocyclic or heterocyclic, which ring system is substituted, in the manner shown in the formula I, by the four substituents -N(R₂)-C(=Z₁)-R₁, -C(=Z₂)-N(R₃)-R₄, R₅ and R₈, and which ring system is

optionally further substituted, and R₈ is hydrogen, or an unsubstituted or substituted alkyl group, or forms, taken together with R₅ or with a monovalent substituent attached to that atom of R₇ via which atom R₇ is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R₈, one additional bond, and, where appropriate, tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, can be used as agrochemical active ingredients and can be prepared in a manner known per se

WO 2005/085234 A2

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

7.9.1
19

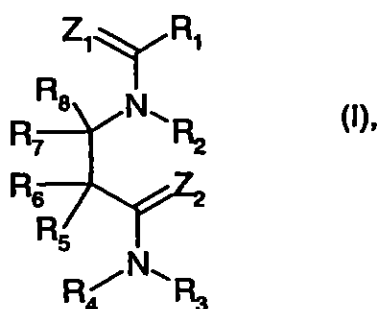
- 1 -

Novel Insecticides

The present invention relates to bicyclic bisamide derivatives, to processes for their preparation, to compositions comprising those compounds, and to their use for controlling insects or representatives of the order Acarina.

Bisamide derivatives with insecticidal action are known and described, for example, in US 2003/0229050.

There have now been found novel bicyclic bisamide derivatives with pesticidal properties. The present invention accordingly relates to compounds of formula I



in which

Z_1 is an oxygen atom; or a sulfur atom;

Z_2 is an oxygen atom; or a sulfur atom;

R_1 is an aryl or heteroaryl group, which is unsubstituted or substituted;

R_2 is hydrogen; or an organic substituent;

R_3 is hydrogen; or an organic substituent;

R_4 is hydrogen; or an organic substituent;

or R_3 and R_4 , taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring, which is unsubstituted or substituted;

R_5 is hydrogen; or an unsubstituted or substituted alkyl group; or forms, taken together with R_8 or with a monovalent substituent attached to that atom of R_6 , via which atom R_8 is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R_5 , one additional bond;

R_6 and R_7 , taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, a bicyclic ring system, which ring system is carbocyclic or heterocyclic, which ring system is substituted, in the manner shown in the

20
20

- 2 -

formula I, by the four substituents $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$, $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$, R_5 and R_6 , and which ring system is optionally further substituted;

and R_6 is hydrogen; or an unsubstituted or substituted alkyl group; or forms, taken together with R_5 or with a monovalent substituent attached to that atom of R_7 , via which atom R_7 is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R_6 , one additional bond,

in free form or in salt form, where appropriate to tautomers, in free form or in salt form, of these compounds, to a process for the preparation and to the use of these compounds and tautomers, to pesticidal compositions whose active ingredient is selected from amongst these compounds and tautomers, in each case in free form or in agrochemically utilizable salt form, to a process for the preparation and to the use of these compositions, to plant propagation material treated with these compositions, to a method of controlling pests with these active ingredients and compositions, to intermediates, in free form or in salt form, for the preparation of these compounds, where appropriate to tautomers, in free form or in salt form, of these intermediates, and to a process for the preparation and to the use of these intermediates.

In some cases, the compounds of formula I can exist as tautomers. For example, if in the compounds of formula I the substituent $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ is $-N(R_2)-C(=O)-R_1$ and R_2 is hydrogen, corresponding compounds of formula I, i. e. those in which $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ is $-N(H)-C(=O)-R_1$, can be in equilibrium with the respective tautomers, in which the respective substituent has the tautomeric structure $-N=C(OH)-R_1$. Accordingly, the compounds of formula I hereinabove and hereinbelow are to be understood as including such tautomers, where appropriate, even though the latter are not mentioned specifically in each individual case.

Compounds of formula I which have at least one basic centre can form, for example, acid addition salts, for example with strong inorganic acids such as mineral acids, for example perchloric acid, sulfuric acid, nitric acid, nitroic acid, a phosphorus acid or a hydrohalic acid, with strong organic carboxylic acids, such as C_1 - C_4 alkanecarboxylic acids which are unsubstituted or substituted, for example by halogen, for example acetic acid, such as saturated or unsaturated dicarboxylic acids, for example oxalic acid, malonic acid, succinic acid, maleic acid, fumaric acid or phthalic acid, such as hydroxycarboxylic acids, for example ascorbic acid, lactic acid, malic acid, tartaric acid or citric acid, or such as benzoic acid, or

28
21

- 3 -

with organic sulfonic acids, such as C₁-C₄alkane- or arylsulfonic acids which are unsubstituted or substituted, for example by halogen, for example methane- or p-toluenesulfonic acid. Compounds of formula I which have at least one acidic group can form, for example, salts with bases, for example mineral salts such as alkali metal or alkaline earth metal salts, for example sodium, potassium or magnesium salts, or salts with ammonia or an organic amine, such as morpholine, piperidine, pyrrolidine, a mono-, di- or tri-lower-alkylamine, for example ethyl-, diethyl-, triethyl- or dimethylpropylamine, or a mono-, di- or trihydroxy-lower-alkylamine, for example mono-, di- or triethanolamine. Where appropriate, the corresponding internal salts can furthermore be formed. Preferred within the scope of the invention are agrochemically advantageous salts; however, the invention also encompasses salts which have disadvantage for agrochemical use, for example salts which are toxic to bees or fish, and which are employed, for example, for the isolation or purification of free compounds of formula I or agrochemically utilizable salts thereof. Owing to the close relationship between the compounds of formula I in free form and in the form of their salts, for the purposes of the invention the free compounds of formula I or their salts hereinabove and hereinbelow are respectively to be understood as including, where appropriate, the corresponding salts or the free compounds of formula I. The same applies analogously to tautomers of compounds of formula I and salts thereof. In general, the free form is preferred in each case.

Preferably the invention relates (2) to a compound according to (1) of formula I, in which

Z₁ is an oxygen atom; or a sulfur atom;

Z₂ is an oxygen atom; or a sulfur atom;

R₁ is a phenyl or naphthyl group, which is substituted independently by 1 or 2 substituents R_a and optionally further substituted independently by 1 to 3 substituents R_b;

R_a is cyano; nitro; halogen; C₁-C₆alkyl; halo-C₁-C₆alkyl; C₁-C₆alkoxy-C₁-C₆alkyl; C₂-C₆alkenyl; halo-C₂-C₆alkenyl; C₂-C₆alkynyl; halo-C₂-C₆alkynyl; C₃-C₆cycloalkyl; halo-C₃-C₆cycloalkyl; hydroxy; C₁-C₆alkoxy; halo-C₁-C₆alkoxy; C₃-C₆cycloalkoxy; mercapto; C₁-C₆alkylthio; halo-C₁-C₆alkylthio; C₁-C₆alkylsulfinyl; halo-C₁-C₆alkylsulfinyl; C₁-C₆alkylsulfonyl; halo-C₁-C₆alkylsulfonyl; amino; C₁-C₆alkylamino; halo-C₁-C₆alkylamino; di-C₁-C₆alkylamino, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen

atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-amino, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₃-C₆cycloalkylamino; N-(C₁-C₆alkyl)-N-(C₃-C₆cycloalkyl)-amino; carboxy; C₁-C₆alkoxycarbonyl; halo-C₁-C₆alkoxycarbonyl; aminocarbonyl; C₁-C₆alkylaminocarbonyl; halo-C₁-C₆alkylaminocarbonyl; di-C₁-C₆alkylaminocarbonyl, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-aminocarbonyl, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₁-C₆alkylcarbonyl; halo-C₁-C₆alkylcarbonyl; or tri-C₁-C₆alkylsilyl, in which the three alkyl groups are the same or different;

or 2 substituents R_a, which are attached to adjacent carbon atoms, taken together, are -(CH₂)₃; -(CH₂)₄; -(CH₂)₅; -(CH=CH)-₂; -OCH₂O-; -O-(CH₂)₂O-; -OCF₂O-; -(CF₂)₂O-; -O-(CF₂)₂; or -O-(CF₂)₂O-;

R_b is halogen; C₁-C₆alkyl; C₂-C₆alkenyl; C₂-C₆alkynyl; C₃-C₆cycloalkyl; C₁-C₆alkoxy; C₁-C₆alkoxycarbonyl; or a phenyl, benzyl, phenoxy or monocyclic or bicyclic heteroaryl group, which group is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a;

or R₁ is a monocyclic or bicyclic heteroaryl group, which is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents R_c;

R_c is a substituent R_a; or a phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy or monocyclic or bicyclic heteroaryl group, which group is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a;

R₂ is hydrogen; a C₁-C₆alkyl, C₂-C₆alkenyl, C₂-C₆alkynyl or C₃-C₆cycloalkyl group, which group is unsubstituted or substituted independently by one or more substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a; a group C(=O)R_d; or a group C(=S)R_d;

R_d is a substituent R₁; C₁-C₆alkyl; halo-C₁-C₆alkyl; C₁-C₆alkoxy-C₁-C₆alkyl; a group CH₂R₁; a group CH₂OR₁; a group CH₂SR₁; a group CH₂NHR₁, which group is optionally further substituted at the nitrogen atom by C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkyl; C₂-C₆alkenyl; halo-

23
23

C₂-C₆alkenyl; C₂-C₆alkynyl; halo-C₂-C₆alkynyl; C₃-C₆cycloalkyl; halo-C₃-C₆cycloalkyl; C₁-C₆alkoxy; halo-C₁-C₆alkoxy; C₃-C₆cycloalkoxy; a group OR₁; C₁-C₆alkylthio; halo-C₁-C₆alkylthio; a group SR₁; C₁-C₆alkylamino; halo-C₁-C₆alkylamino; di-C₁-C₆alkylamino, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-amino, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₃-C₆cycloalkylamino; N-(C₁-C₆alkyl)-N-(C₃-C₆cycloalkyl)-amino; or a group NHR₁, which group is optionally further substituted at the nitrogen atom by C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkyl;

R₃ is hydrogen; a C₁-C₆alkyl, C₂-C₆alkenyl, C₂-C₆alkynyl or C₃-C₆cycloalkyl group, which group is unsubstituted or substituted independently by one or more substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a; C₁-C₆alkoxy; halo-C₁-C₆alkoxy; C₃-C₆cycloalkoxy; C₁-C₆alkylthio; halo-C₁-C₆alkylthio; C₁-C₆alkylamino; halo-C₁-C₆alkylamino; di-C₁-C₆alkylamino, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-amino, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₃-C₆cycloalkylamino; N-(C₁-C₆alkyl)-N-(C₃-C₆cycloalkyl)-amino; C₁-C₆alkoxycarbonyl; halo-C₁-C₆alkoxycarbonyl; C₁-C₆alkylcarbonyl or halo-C₁-C₆alkylcarbonyl;

R₄ is hydrogen; a substituent R₁; a substituent R_e; a C₁-C₆alkyl, C₂-C₆alkenyl, C₂-C₆alkynyl or C₃-C₆cycloalkyl group, which group is unsubstituted or substituted independently by one or more substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a, the substituents R_e and a phenyl, benzoyl, phenoxy or monocyclic or bicyclic heteroaryl group, which group is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_c; a group CH₂OR₁; a group CH₂SR₁; a group CH₂NHR₁, which group is optionally further substituted at the nitrogen atom by C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkyl; C₁-C₆alkoxy; halo-C₁-C₆alkoxy; C₃-C₆cycloalkoxy; a group OR₁; C₁-

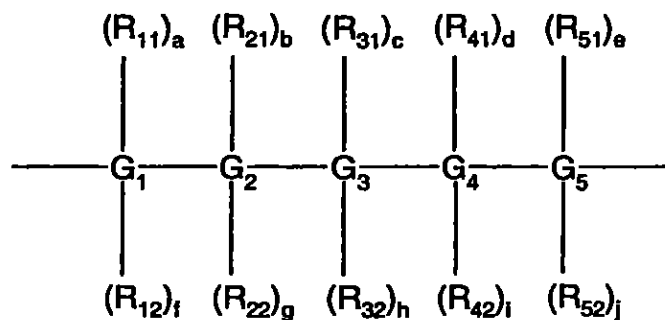
C₆alkylthio; halo-C₁-C₆alkylthio; a group SR₁; C₁-C₆alkylsulfinyl; halo-C₁-C₆alkylsulfinyl; C₁-C₆alkylsulfonyl; halo-C₁-C₆alkylsulfonyl; C₁-C₆alkylamino; halo-C₁-C₆alkylamino; di-C₁-C₆alkylamino, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-amino, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₃-C₆cycloalkylamino; N-(C₁-C₆alkyl)-N-(C₃-C₆cycloalkyl)-amino; a group NHR₁, which group is optionally further substituted at the nitrogen atom by C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkyl; a group C(=O)R_d; a group C(=O)R_e; a group C(=S)R_d; or a group C(=S)R_e;

R_e is a carbocyclyl or heterocyclyl group, which group is monocyclic or bicyclic and is non-aromatic, in which group 1 or 2 of the ring members are optionally selected from the group, consisting of the groups C(=O), S(=O) and S(=O)₂, and which group is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy;

or R₃ and R₄, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 6 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy;

R₅ is hydrogen; C₁-C₆alkyl; or halo-C₁-C₆alkyl; or has one of the meanings defined hereinafter;

R₆ and R₇, taken together, are either a group of the formula

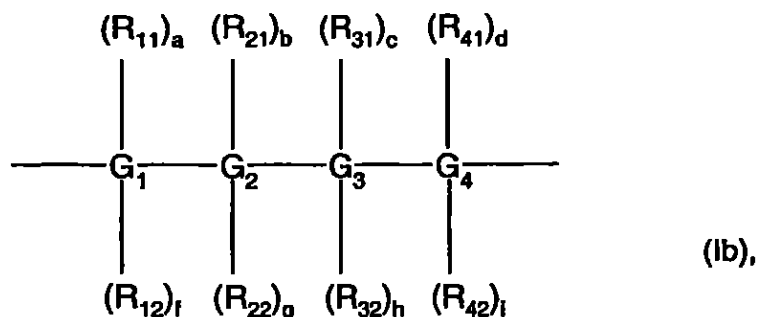


(Ia),

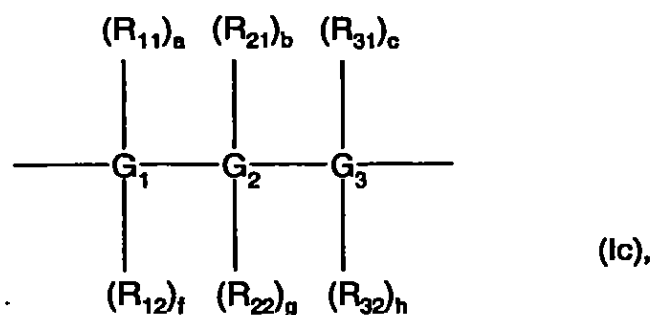
25
25

- 7 -

in which G_1 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_5 ; and in which G_5 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_8 ; or are a group of the formula



in which G_1 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_5 ; and in which G_4 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_8 ; or are a group of the formula



in which G_1 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_5 ; and in which G_3 is attached to the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_8 ;

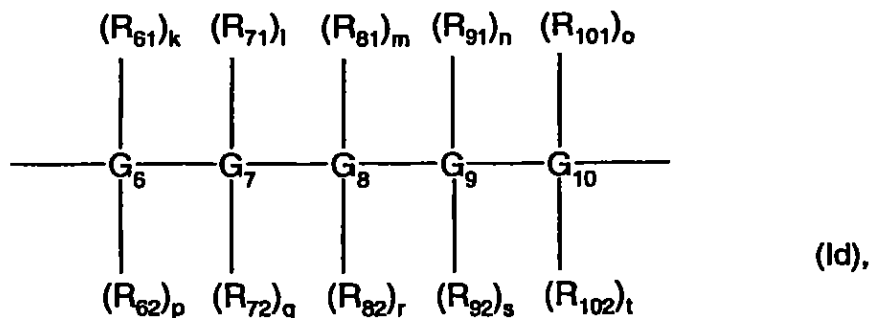
in which formulae 1a, 1b and 1c either a is 0; f is 0; and G_1 is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or a is 0; f is 1; and G_1 is a nitrogen atom; or a is 1; f is 1; and G_1 is a carbon atom; either b is 0; g is 0; and G_2 is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or b is 0; g is 1; and G_2 is a nitrogen atom; or b is 1; g is 1; and G_2 is a carbon atom; and either c is 0; h is 0; and G_3 is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or c is 0; h is 1; and G_3 is a nitrogen atom; or c is 1; h is 1; and G_3 is a carbon atom;

in which formulae 1a and 1b either d is 0; i is 0; and G_4 is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or d is 0; i is 1; and G_4 is a nitrogen atom; or d is 1; i is 1; and G_4 is a carbon atom;

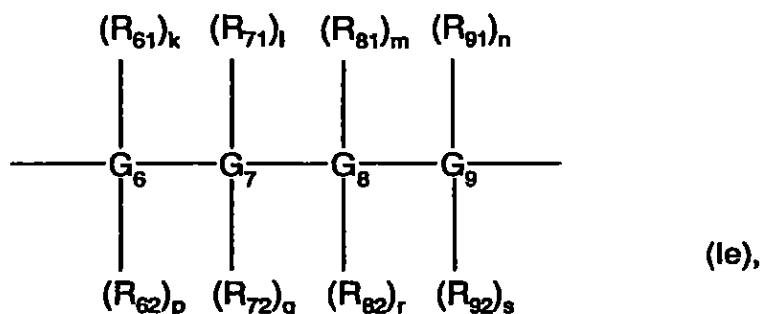
26
26

in which formula Ia either e is 0; j is 0; and G₅ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or e is 0; j is 1; and G₅ is a nitrogen atom; or e is 1; j is 1; and G₅ is a carbon atom;

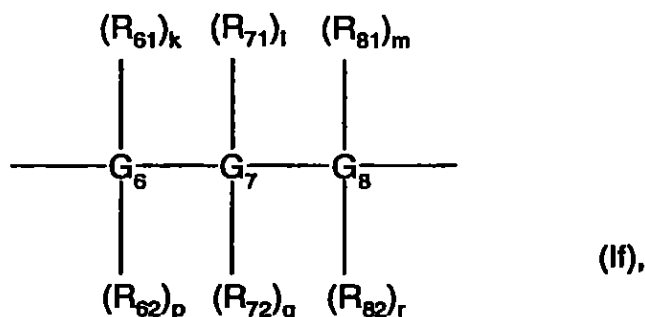
in which formula Ia either f is 1; g is 1; and R₁₂ and R₂₂, taken together, are either a group of the formula



in which G₆ is attached to G₁; and in which G₁₀ is attached to G₂; or are a group of the formula



in which G₆ is attached to G₁; and in which G₉ is attached to G₂; or are a group of the formula



in which G₆ is attached to G₁; and in which G₈ is attached to G₂;

or g is 1; h is 1; and R₂₂ and R₃₂, taken together, are either a group of the formula Id, in

which G₆ is attached to G₂; and in which G₁₀ is attached to G₃; or are a group of the formula

Ie, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₉ is attached to G₃; or are a group of the

formula If, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₈ is attached to G₃;

24.
2X

- 9 -

or h is 1; i is 1; and R₃₂ and R₄₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₁₀ is attached to G₄; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₉ is attached to G₄; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₈ is attached to G₄;

or i is 1; j is 1; and R₄₂ and R₅₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₄; and in which G₁₀ is attached to G₅; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₄; and in which G₉ is attached to G₅; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₄; and in which G₈ is attached to G₅;

in which formula Ib either f is 1; g is 1; and R₁₂ and R₂₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₁₀ is attached to G₂; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₉ is attached to G₂; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₈ is attached to G₂;

or g is 1; h is 1; and R₂₂ and R₃₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₁₀ is attached to G₃; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₉ is attached to G₃; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₈ is attached to G₃;

or h is 1; i is 1; and R₃₂ and R₄₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₁₀ is attached to G₄; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₉ is attached to G₄; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₃; and in which G₈ is attached to G₄;

in which formula Ic either f is 1; g is 1; and R₁₂ and R₂₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₁₀ is attached to G₂; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₉ is attached to G₂; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₁; and in which G₈ is attached to G₂;

or g is 1; h is 1; and R₂₂ and R₃₂, taken together, are either a group of the formula Id, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₁₀ is attached to G₃; or are a group of the formula Ie, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₉ is attached to G₃; or are a group of the formula If, in which G₆ is attached to G₂; and in which G₈ is attached to G₃;

in which formulae Ia, Ib and Ic the atoms G₁ and G₂ can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₁₂, if G₁ is a nitrogen atom, and which is R₁₁ or R₁₂, if G₁ is a carbon atom, and a second

substituent, which is R_{22} , if G_2 is a nitrogen atom, and which is R_{21} or R_{22} , if G_2 is a carbon atom, taken together;

in which formulae Ia, Ib and Ic the atoms G_2 and G_3 can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{22} , if G_2 is a nitrogen atom, and which is R_{21} or R_{22} , if G_2 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{32} , if G_3 is a nitrogen atom, and which is R_{31} or R_{32} , if G_3 is a carbon atom, taken together;

in which formulae Ia and Ib the atoms G_3 and G_4 can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{32} , if G_3 is a nitrogen atom, and which is R_{31} or R_{32} , if G_3 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, taken together;

in which formula Ia the atoms G_4 and G_5 can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{52} , if G_5 is a nitrogen atom, and which is R_{51} or R_{52} , if G_5 is a carbon atom, taken together;

in which formulae Ia, Ib and Ic the atom G_1 can be connected with the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_5 , by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{12} , if G_1 is a nitrogen atom, and which is R_{11} or R_{12} , if G_1 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_5 , taken together;

in which formula Ia the atom G_5 can be connected with the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_6 , by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{52} , if G_5 is a nitrogen atom, and which is R_{51} or R_{52} , if G_5 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_6 , taken together;

in which formula Ib the atom G_4 can be connected with the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_6 , by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_6 , taken together;

in which formula Ic the atom G_3 can be connected with the carbon atom, shown in the formula I, that carries R_6 , by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{32} , if G_3 is a nitrogen atom, and which is R_{31} or R_{32} , if G_3 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_6 , taken together;

in which formula Ia each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} , R_{32} , R_{41} , R_{42} , R_{51} and R_{52} , which are different from the

29
29

- 11 -

two substituents, which, taken together, form the group of the formula Id, le or lf, and different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ia, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ia, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_i ;

in which formula Ib each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} , R_{32} , R_{41} and R_{42} , which are different from the two substituents, which, taken together, form the group of the formula Id, le or lf, and different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ib, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ib, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_i ;

in which formula Ic each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} and R_{32} , which are different from the two substituents, which, taken together, form the group of the formula Id, le or lf, and different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ic, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ic, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_i ;

R_i is hydrogen; or a substituent R_g ; the total number of the substituents R_g , if present, having an upper limit of 5 for a group of the formula Ia; of 4 for a group of the formula Ib; and of 3 for a group of the formula Ic; which total number can, however, be limited for a specific group of the formula Ia, Ib or Ic to a value lower than the upper limit mentioned hereinbefore, which value is then equal to the number of the positions available for the substitution by a substituent R_g in this specific group;

R_g is either attached to a carbon atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{g-c} ; or attached to a nitrogen atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{g-n} ;

R_{g-c} is a substituent R_c ;

R_{g-n} is cyano; nitro; C_1 - C_6 alkyl; halo- C_1 - C_6 alkyl; C_1 - C_6 alkoxy- C_1 - C_6 alkyl; C_2 - C_6 alkenyl; halo- C_2 - C_6 alkenyl; C_2 - C_6 alkynyl; halo- C_2 - C_6 alkynyl; C_3 - C_6 cycloalkyl; halo- C_3 - C_6 cycloalkyl; C_1 - C_6 alkoxy; halo- C_1 - C_6 alkoxy; C_3 - C_6 cycloalkoxy; C_1 - C_6 alkylthio; halo- C_1 - C_6 alkylthio; C_1 - C_6 alkylsulfinyl; halo- C_1 - C_6 alkylsulfinyl; C_1 - C_6 alkylsulfonyl; halo- C_1 - C_6 alkylsulfonyl; amino; C_1 - C_6 alkylamino; halo- C_1 - C_6 alkylamino; di- C_1 - C_6 alkylamino, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected

30
30

- 12 -

from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-amino, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₃-C₆cycloalkylamino; N-(C₁-C₆alkyl)-N-(C₃-C₆cycloalkyl)-amino; C₁-C₆alkoxycarbonyl; halo-C₁-C₆alkoxycarbonyl; aminocarbonyl; C₁-C₆alkylaminocarbonyl; halo-C₁-C₆alkylaminocarbonyl; di-C₁-C₆alkylaminocarbonyl, in which the two alkyl groups are the same or different or, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring containing 1 ring nitrogen atom and 2 to 12 ring carbon atoms and optionally 1 further ring hetero atom, which then replaces 1 ring carbon atom and is selected from the group, consisting of an oxygen, a sulfur and a nitrogen atom, which ring is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of cyano, nitro, halogen, C₁-C₄alkyl and C₁-C₄alkoxy; di-(halo-C₁-C₆alkyl)-aminocarbonyl, in which the two haloalkyl groups are the same or different; C₁-C₆alkylcarbonyl; halo-C₁-C₆alkylcarbonyl; tri-C₁-C₆alkylsilyl, in which the three alkyl groups are the same or different; or a phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy or monocyclic or bicyclic heteroaryl group, which group is unsubstituted or substituted independently by 1 to 4 substituents, selected from the group, consisting of the substituents R_a;

in which formulae Id, Ie and If either k is 0; p is 0; and G₆ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or k is 0; p is 1; and G₆ is a nitrogen atom; or k is 1; p is 1; and G₆ is a carbon atom; either l is 0; q is 0; and G₇ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or l is 0; q is 1; and G₇ is a nitrogen atom; or l is 1; q is 1; and G₇ is a carbon atom; and either m is 0; r is 0; and G₈ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or m is 0; r is 1; and G₈ is a nitrogen atom; or m is 1; r is 1; and G₈ is a carbon atom;

in which formulae Id and Ie either n is 0; s is 0; and G₉ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or n is 0; s is 1; and G₉ is a nitrogen atom; or n is 1; s is 1; and G₉ is a carbon atom;

in which formula Id either o is 0; t is 0; and G₁₀ is a group C(=O); a group C(=S); an oxygen atom; a sulfur atom; a group S(=O); or a group S(=O)₂; or o is 0; t is 1; and G₁₀ is a nitrogen atom; or o is 1; t is 1; and G₁₀ is a carbon atom;

in which formulae Id, Ie and If the atoms G₆ and G₇ can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₆₂, if

G₆ is a nitrogen atom, and which is R₆₁ or R₆₂, if G₆ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₇₂, if G₇ is a nitrogen atom, and which is R₇₁ or R₇₂, if G₇ is a carbon atom, taken together;

in which formulae Id, Ie and If the atoms G₇ and G₈ can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₇₂, if G₇ is a nitrogen atom, and which is R₇₁ or R₇₂, if G₇ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, taken together;

in which formulae Id and Ie the atoms G₈ and G₉ can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₉₂, if G₉ is a nitrogen atom, and which is R₉₁ or R₉₂, if G₉ is a carbon atom, taken together;

in which formula Id the atoms G₉ and G₁₀ can be connected by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₉₂, if G₉ is a nitrogen atom, and which is R₉₁ or R₉₂, if G₉ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₁₀₂, if G₁₀ is a nitrogen atom, and which is R₁₀₁ or R₁₀₂, if G₁₀ is a carbon atom, taken together;

in which formulae Id, Ie and If the atom G₆ can be connected either with the atom G₁, shown in the formulae Ia, Ib and Ic, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₆₂, if G₆ is a nitrogen atom, and which is R₆₁ or R₆₂, if G₆ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₁₂, if G₁ is a nitrogen atom, and which is R₁₁ or R₁₂, if G₁ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₂, shown in the formulae Ia, Ib and Ic, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₆₂, if G₆ is a nitrogen atom, and which is R₆₁ or R₆₂, if G₆ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₂₂, if G₂ is a nitrogen atom, and which is R₂₁ or R₂₂, if G₂ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₃, shown in the formulae Ia and Ib, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₆₂, if G₆ is a nitrogen atom, and which is R₆₁ or R₆₂, if G₆ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₃₂, if G₃ is a nitrogen atom, and which is R₃₁ or R₃₂, if G₃ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₄, shown in the formula Ia, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₆₂, if G₆ is a nitrogen atom, and which is R₆₁ or

R_{62} , if G_6 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, taken together;

in which formula 1d the atom G_{10} can be connected either with the atom G_2 , shown in the formulae 1a, 1b and 1c, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{102} , if G_{10} is a nitrogen atom, and which is R_{101} or R_{102} , if G_{10} is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{22} , if G_2 is a nitrogen atom, and which is R_{21} or R_{22} , if G_2 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_3 , shown in the formulae 1a, 1b and 1c, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{102} , if G_{10} is a nitrogen atom, and which is R_{101} or R_{102} , if G_{10} is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{32} , if G_3 is a nitrogen atom, and which is R_{31} or R_{32} , if G_3 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_4 , shown in the formulae 1a and 1b, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{102} , if G_{10} is a nitrogen atom, and which is R_{101} or R_{102} , if G_{10} is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_5 , shown in the formula 1a, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{102} , if G_{10} is a nitrogen atom, and which is R_{101} or R_{102} , if G_{10} is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{52} , if G_5 is a nitrogen atom, and which is R_{51} or R_{52} , if G_5 is a carbon atom, taken together;

in which formula 1e the atom G_9 can be connected either with the atom G_2 , shown in the formulae 1a, 1b and 1c, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{92} , if G_9 is a nitrogen atom, and which is R_{91} or R_{92} , if G_9 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{22} , if G_2 is a nitrogen atom, and which is R_{21} or R_{22} , if G_2 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_3 , shown in the formulae 1a, 1b and 1c, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{92} , if G_9 is a nitrogen atom, and which is R_{91} or R_{92} , if G_9 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{32} , if G_3 is a nitrogen atom, and which is R_{31} or R_{32} , if G_3 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_4 , shown in the formulae 1a and 1b, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{92} , if G_9 is a nitrogen atom, and which is R_{91} or R_{92} , if G_9 is a carbon atom, and a second substituent, which is R_{42} , if G_4 is a nitrogen atom, and which is R_{41} or R_{42} , if G_4 is a carbon atom, taken together;

or with the atom G_5 , shown in the formula 1a, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R_{92} , if G_9 is a nitrogen atom, and which is R_{91} or

3.3
39

R₉₂, if G₉ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₅₂, if G₅ is a nitrogen atom, and which is R₅₁ or R₅₂, if G₅ is a carbon atom, taken together;

in which formula If the atom G₈ can be connected either with the atom G₂, shown in the formulae Ia, Ib and Ic, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₂₂, if G₂ is a nitrogen atom, and which is R₂₁ or R₂₂, if G₂ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₃, shown in the formulae Ia, Ib and Ic, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₃₂, if G₃ is a nitrogen atom, and which is R₃₁ or R₃₂, if G₃ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₄, shown in the formulae Ia and Ib, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₄₂, if G₄ is a nitrogen atom, and which is R₄₁ or R₄₂, if G₄ is a carbon atom, taken together;

or with the atom G₅, shown in the formula Ia, by one additional bond, which bond, if present, is represented by a first substituent, which is R₈₂, if G₈ is a nitrogen atom, and which is R₈₁ or R₈₂, if G₈ is a carbon atom, and a second substituent, which is R₅₂, if G₅ is a nitrogen atom, and which is R₅₁ or R₅₂, if G₅ is a carbon atom, taken together;

in which formula Id each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R₆₁, R₆₂, R₇₁, R₇₂, R₈₁, R₈₂, R₉₁, R₉₂, R₁₀₁ and R₁₀₂, which are different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Id, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Id, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_h;

in which formula Ie each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R₆₁, R₆₂, R₇₁, R₇₂, R₈₁, R₈₂, R₉₁ and R₉₂, which are different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ie, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula Ie, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_i;

in which formula If each of those substituents, selected from the group, consisting of the substituents R₆₁, R₆₂, R₇₁, R₇₂, R₈₁ and R₈₂, which are different from any first substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula If, and from any second substituent, if present, as defined hereinbefore for the formula If, is independently selected from the group, consisting of the substituents R_h;

34
31

R_i is hydrogen; or a substituent R_i ; the total number of the substituents R_i , if present, having an upper limit of 6 for a group of the formula Id; and of 4 for a group of the formula If; which total number can, however, be limited for a specific group of the formula Id or If to a value lower than the upper limit mentioned hereinbefore, which value is then equal to the number of the positions available for the substitution by a substituent R_i in this specific group;

R_k is hydrogen; or a substituent R_k ; the total number of the substituents R_k , if present, having an upper limit of 5; which total number can, however, be limited for a specific group of the formula Ie to a value lower than the upper limit mentioned hereinbefore, which value is then equal to the number of the positions available for the substitution by a substituent R_k in this specific group;

R_j is either attached to a carbon atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{j-c} ; or attached to a nitrogen atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{j-n} ;

R_{j-c} is a substituent R_c ;

R_{j-n} is a substituent R_{g-n} ;

R_k is either attached to a carbon atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{k-c} ; or attached to a nitrogen atom and then selected from the group, consisting of the substituents R_{k-n} ;

or 2 substituents R_k , the first of which is attached to the atom G_6 and is represented by R_{62} , if G_6 is a nitrogen atom, and by R_{61} or R_{62} , if G_6 is a carbon atom, and the second of which is attached to the atom G_9 and is represented by R_{92} , if G_9 is a nitrogen atom, and by R_{91} or R_{92} , if G_9 is a carbon atom, taken together, are $-CH_2-$; or $-O-$;

R_{k-c} is a substituent R_c ;

R_{k-n} is a substituent R_{g-n} ;

R_8 is hydrogen; C_1 - C_6 alkyl; or halo- C_1 - C_6 alkyl; or has one of the meanings defined hereinbefore or hereinafter;

or R_5 and R_8 , taken together, are a bond;

with the proviso, that

(i) a ring oxygen atom, if present, is not directly connected with a further ring oxygen atom, if any;

(ii) a ring carbon atom, selected from the group, consisting of G_1 , G_2 , G_3 , G_4 , G_5 , G_6 , G_7 , G_8 , G_9 and G_{10} , is, if present, not directly connected with any other atom by a triple bond or with any other 2 different atoms by 2 double bonds;

35
35

- 17 -

(iii) not more than 6 of the variables G_1 , G_2 , G_3 , G_4 , G_5 , G_6 , G_7 , G_8 , G_9 and G_{10} can, if present, be selected from the group, consisting of an oxygen atom, a sulfur atom, a group $S(=O)$, a group $S(=O)_2$ and a nitrogen atom, each of the remaining of these variables, if any, being selected from the group, consisting of a carbon atom, a group $C(=O)$ and a group $C(=S)$, and not more than 3 of the said 6 variables can be selected from the group, consisting of an oxygen atom, a sulfur atom, a group $S(=O)$ and a group $S(=O)_2$; and

(iv) unless otherwise defined hereinbefore, the meaning of a variable at a certain occurrence can be selected independently from the meaning of the same variable at any other occurrence, if any.

Unless otherwise defined, the general terms used hereinabove and hereinbelow have the meanings which follow.

Halogen - as a group per se and as a structural element of other groups and compounds, such as haloalkyl - is, for example, fluorine, chlorine, bromine or iodine, in particular fluorine, chlorine or bromine, but especially chlorine or bromine.

Unless otherwise defined, carbon-containing groups and compounds comprise for example in each case 1 up to and including 15, preferably 1 up to and including 10, especially 1 up to and including 8, in particular 1 up to and including 5, especially 1 or 2, carbon atom(s).

Cycloalkyl - as a group per se and as a structural element of other groups and compounds, such as halocycloalkyl - is, in each case with due consideration of the number of carbon atoms contained in each case in the relevant group or compound, for example cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl or cyclohexyl.

Alkyl - as a group per se and as a structural element of other groups and compounds, such as haloalkyl - is, in each case with due consideration of the number of carbon atoms contained in each case in the relevant group or compound, either straight-chain, for example methyl, ethyl, propyl, butyl, pentyl or hexyl, or branched, for example isopropyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, isopentyl, neopentyl or isohexyl.

Alkenyl - as a group per se and as a structural element of other groups and compounds, such as haloalkenyl - is, in each case with due consideration of the number of carbon atoms

36
36

contained in each case in the relevant group or compound, either straight-chain or branched and comprises in each case 2 or more than 2 or preferably 1 carbon-carbon double bond(s), the double bonds of these substituents being separated from the remaining moiety of the compound I by preferably at least one saturated carbon atom, and is, for example, allyl, propen-2-yl, methallyl, but-2-en-1-yl, but-3-en-1-yl or pent-4-en-1-yl.

Alkynyl - as a group per se and as a structural element of other groups and compounds, such as haloalkynyl - is, in each case with due consideration of the number of carbon atoms contained in each case in the relevant group or compound, either straight-chain or branched and comprises in each case 2 or more than 2 or preferably 1 carbon-carbon triple bond(s), the triple bonds of these substituents being separated from the remaining moiety of the compound I by preferably at least one saturated carbon atom, and is, for example, propargyl, but-2-ynyl or but-3-yn-2-yl.

Aryl is, for example, naphthyl or, preferably, phenyl.

Heteroaryl has, for example, an aromatic ring skeleton composed of a ring having 5 or 6 ring members or of a combination of at least two rings having in each case independently of one another 5 or 6 ring members, where for example 1 up to and including 4 of the ring members is (are) (a) heteroatom(s) selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, and is, for example, pyridyl, thienyl, pyrazolyl, thiazolyl, thiadiazolyl, furyl, oxadiazolyl, indoliziny, pyrimidyl, quinolyl or pteridinyl.

Non-aromatic heterocyclyl has, for example, a non-aromatic ring skeleton composed of a ring having 5 or 6 ring members or of a combination of at least two rings having in each case independently of one another 5 or 6 ring members, where for example 1 up to and including 4 of the ring members is (are) (a) heteroatom(s) selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur and is, for example, piperidyl, pyrrolinyl, tetrahydrofuryl or chromanyl.

Halogen-substituted carbon-containing groups and compounds, such as haloalkyl, can be partially halogenated or perhalogenated, where, in the case of polyhalogenation, the halogen substituents can be identical or different.

2.7.
3X

The following are further preferred embodiments within the scope of the invention:

(3) A compound according to (1) or (2) of the formula I, in which Z₁ is an oxygen atom;

(4) A compound according to any one of (1) to (3) of the formula I, in which Z₂ is an oxygen atom;

(5) A compound according to any one of (1) to (4) of the formula I, in which R₁ is a phenyl, pyridyl or pyrazolyl group, which is unsubstituted or preferably substituted; especially a phenyl, pyridyl or pyrazolyl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkyl, C₁-C₆alkoxy, halo-C₁-C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is unsubstituted or preferably substituted; more especially a phenyl, pyridyl or pyrazolyl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen and C₁-C₆alkyl; preferably a phenyl or pyridyl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of C₁-C₆alkyl and halo-C₁-C₆alkyl; or a pyrazolyl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen and C₁-C₆alkyl; more preferably a pyrazolyl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen and C₁-C₆alkyl; especially a pyrazol-3-yl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen and C₁-C₆alkyl; more especially a pyrazol-3-yl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-

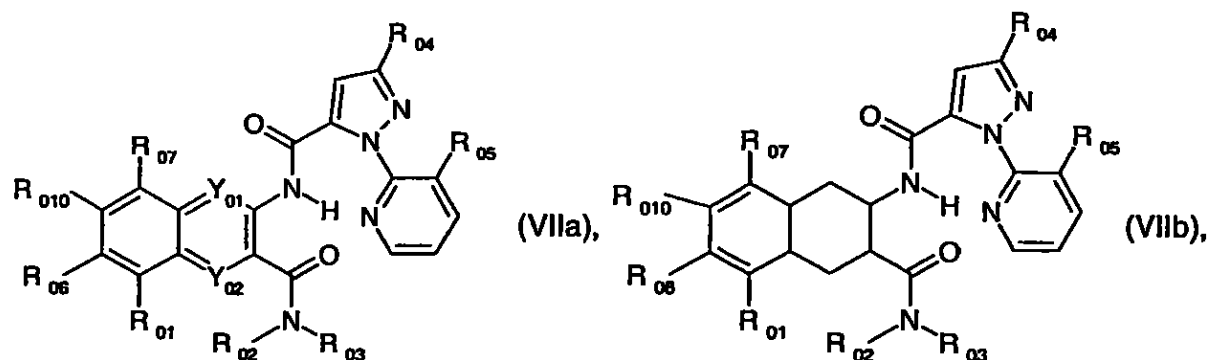
C₆alkoxy and a phenyl or pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen and C₁-C₆alkyl;
preferably a pyrazol-3-yl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a pyridyl group, which group is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen;
more preferably a pyrazol-3-yl group, which is substituted independently by 1 to 3 substituents, selected from the group, consisting of halogen, halo-C₁-C₆alkyl, halo-C₁-C₆alkoxy and a pyrid-2-yl group, which group is substituted independently by 1 or 2 substituents, selected from the group, consisting of halogen;
especially a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by halogen, halo-C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkoxy and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted independently by 1 or 2 substituents, selected from the group, consisting of halogen;
more especially a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by halogen, halo-C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkoxy and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted in the 3-position by halogen;
preferably a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by halogen, halo-C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkoxy and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted in the 3-position by chlorine or bromine;
more preferably a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by halo-C₁-C₆alkyl and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted in the 3-position by chlorine or bromine;
most preferably a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by trifluoromethyl and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted in the 3-position by chlorine or bromine;

(6) A compound according to any one of (1) to (5) of the formula I, in which R₂ is hydrogen or C₁-C₆alkyl;
preferably hydrogen;

(7) A compound according to any one of (1) to (6) of the formula I, in which R₃ is hydrogen or C₁-C₆alkyl;
preferably hydrogen;

39.1
39

- (8) A compound according to any one of (1) to (7) of the formula I, in which R_4 is C_1 - C_6 alkyl; preferably methyl or isopropyl;
- (9) A compound according to any one of (1) to (8) of the formula I, in which R_5 and R_6 , taken together, are a bond;
- (10) A compound according to any one of (1) to (9) of the formula I, in which R_6 and R_7 , taken together, are a group of the formula Ib or a group of the formula Ic;
- (11) A compound according to any one of (1) to (10) of the formula I, in which the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms R_6 and R_7 are attached, are two ring members of an aromatic ring;
- (12) A compound according to any one of (1) to (11) of the formula I, in which R_6 and R_7 , taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, and together with R_5 and with R_8 , one of the bicyclic ring systems shown in the formulae T1 to T85, or shown in the formulae T1 to T71, each of which ring systems is substituted by the two substituents $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ and $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$; preferably taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, and together with R_5 and with R_8 , one of the bicyclic ring systems shown in the formulae T1, T6, T7, T21, T37 and T38, each of which ring systems is substituted by the two substituents $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ and $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$; more preferably taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, and together with R_5 and with R_8 , one of the bicyclic ring systems shown in the formulae T1 and T7, or shown in the formulae T2, T22, T75, T76, T78, T79 and T81, each of which ring systems is substituted by the two substituents $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ and $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$.
- A further preferred subgroup of the compounds of formula I is represented by the compounds of formulae VIIa and VIIb



wherein

R₀₁ is hydrogen; amino or nitro;

R₀₂ is hydrogen or C₁-C₄alkyl;

R₀₃ is C₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkyl mono- or disubstituted by cyano, COOH, nitro, C₁-C₄alkoxy or cyclopropyl;

C₂-C₆alkenyl, C₂-C₆alkenyl substituted by halogen;

C₁-C₄alkoxy, C₃-C₆alkynyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclopropyl substituted by C₁-C₄alkyl, pyridyl, phenyl-C₂-C₆alkenyl or cyclopropyl;

cyclobutyl substituted by C₁-C₄alkyl;

cyclopentylthio-C₁-C₄alkyl, benzyloxy, benzyloxy substituted by halogen;

benzylthio-C₁-C₄alkyl, wherein the benzyl group may itself be substituted by C₁-C₄alkyl;

thiophenyl substituted by halophenyl;

phenoxy-C₁-C₄alkyl, wherein the phenyl group may be mono- or disubstituted by halogen;

phenyl-C₁-C₄alkyl, wherein the phenyl group may itself be mono- or disubstituted by substituents selected from halogen, nitro, benzothiazol-2-yloxy, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkoxy and C₁-C₄alkyl;

3,4-dihydro-2H-benzo[b][1,4]dioxepinyl, 1,2,3,4-tetrahydro-naphthalenyl substituted by C₁-C₄alkoxy;

C₂-C₆alkenyloxy, isoxazolyl substituted by C₁-C₄alkyl;

thiazolyl, C₁-C₄alkoxycarbonyl-C₁-C₄alkyl, phenyl substituted by hydroxy, halophenyloxy, C₁-C₄alkyl-silyl(C₁-C₄alkyl)₃ or C₂-C₆alkynyl;

pyridyl substituted by C₁-C₄alkoxy;

C₁-C₆alkylthio-C₁-C₄alkyl, C₂-C₆alkenylthio-C₁-C₄alkyl, C₃-C₆alkynylthio-C₁-C₄alkyl, dioxolan-2-yl-C₁-C₄alkyl, (C₁-C₄alkyl-dioxolan-2-yl)-C₁-C₄alkyl, triazolyl-C₁-C₄alkyl, thienyl-C₁-C₄alkyl, morpholinyl-C₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylthio-C₁-C₄alkyl, 2,3-dihydro-1H-isindolyl, halo-substituted-

41
Al

- 23 -

thiazolyl-C₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkylsulfonyl-C₁-C₄alkyl or quinolythio-C₁-C₄alkyl, wherein the quinoline group may be substituted by C₁-C₄haloalkyl;

R₀₄ is C₁-C₄haloalkyl;

R₀₅ is halogen;

each of R₀₈ and R₀₁₀, which may be the same or different, represents hydrogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆alkoxycarbonyloxy, C₁-C₆alkylcarbonylamino, hydroxy, cyano, halogen or C₁-C₆alkoxy;

R₀₇ is hydrogen, nitro or halogen;

Y₀₁ is C(R₀₈), sulfur, nitrogen or a chemical bond;

R₀₈ is hydrogen, halogen, C₁-C₄alkyl or nitro;

Y₀₂ is C(R₀₉), a chemical bond, or is nitrogen or sulfur; and R₀₉ is hydrogen, phenyl, phenyl substituted by halogen, or halogen.

Preferred compounds of the formula VIIa are those, wherein

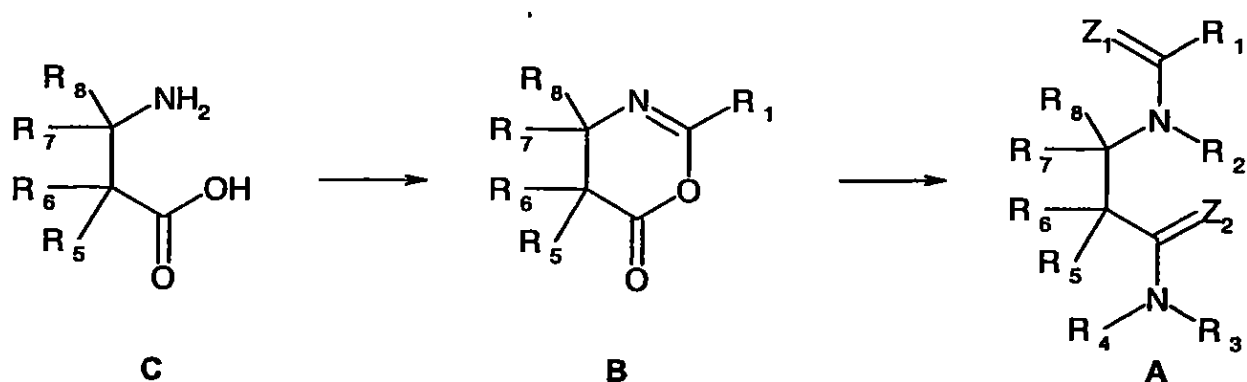
R₀₁ is hydrogen; R₀₂ is hydrogen; R₀₃ is C₁-C₄alkyl, preferably methyl; R₀₄ is C₁-C₄fluoroalkyl, preferably trifluoromethyl; R₀₅ is chloro; R₀₆ is halogen, preferably chloro; R₀₇ is hydrogen; R₀₁₀ is hydrogen; Y₀₁ is C(R₀₈); R₀₈ is halogen, preferably chloro; Y₀₂ is C(R₀₉), and R₀₉ is hydrogen.

Especially preferred within the scope of the invention are the compounds of the formula I mentioned in the Examples P3, P6 and P9 to P11.

Individually preferred within the scope of the invention is each of the compounds T1.1, T1.3, T6.1, T6.3, T7.1, T7.3, T21.3, T37.3 and T38.3.

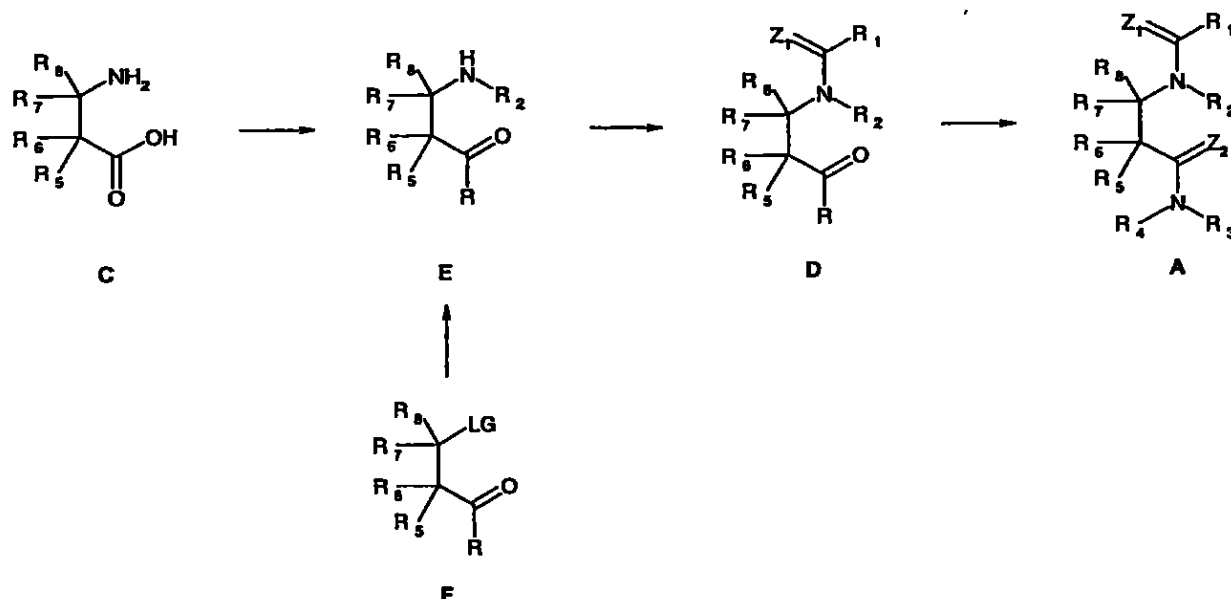
Also individually preferred within the scope of the invention is each of the compounds T2.1, T22.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T78.1, T79.1 and T81.1.

The process according to the invention for preparing compounds of the formula I is carried out analogously to known processes. In the section that follows, the substituents R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, Z₁ and Z₂ are as defined under formula I in claim 1 unless otherwise stated.



Compounds of formula A, wherein Z₁ and Z₂ are oxygen and R₁ is hydrogen, may be made from the ring opening of a benzoxazinone of formula B with an amine of formula NHR₃R₄. Such amines are either known or they may be made analogously to known processes. Benzoxazinones of formula B may be made from amino acids of formula C by treatment with a carboxylic acid of formula R₁-COOH and a dehydrating reagent such as methanesulfonyl chloride (optionally in the presence of a base such as pyridine or triethylamine). Alternatively benzoxazinones of formula B may be obtained by the treatment of amino acids of formula C with an acid chloride of formula R₁-COCl under basic conditions (for example in pyridine), followed if necessary by a second cyclisation step (which may be achieved using a dehydrating agent for example acetic anhydride). Acid chlorides of formula R₁-COCl may be made from carboxylic acids of formula R₁-COOH under standard conditions (for example by treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride). Carboxylic acids of formula R₁-COOH are either known compounds or they may be made analogously to known processes.

Compounds of formula A, wherein Z₁ and Z₂ are sulfur, may be made from compounds of formula A, wherein Z₁ and Z₂ are oxygen, by treatment with a thio-transfer reagent such as Lawesson's reagent or phosphorus pentasulfide.



Alternatively, compounds of formula A, wherein Z_1 and Z_2 are oxygen, may be made by treatment of compounds of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is OH, C_1 - C_4 alkoxy or Cl, with an amine of formula NHR_3R_4 . The standard conditions for such acylation reactions are as follows: when R is OH such reactions are usually carried out in the presence of a coupling reagent such as DCC (N,N'-dicyclohexylcarbodiimide) or EDC (1-Ethyl-3-[3-dimethylamino-propyl]carbodiimide hydrochloride) optionally in the presence of a nucleophilic catalyst such as hydroxybenzotriazole or 4-(dimethylamino)-pyridine. When R is Cl, such reactions are usually carried out under basic conditions (for example in the presence of pyridine or triethylamine), again optionally in the presence of a nucleophilic catalyst. It may be possible to convert esters (wherein R is C_1 - C_4 alkoxy) directly to amides by heating the ester and amine together in a thermal process.

Acid chlorides of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is Cl, may be made from carboxylic acids of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is OH, under standard conditions (such as treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride). Carboxylic acids of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is OH, may be formed from esters of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is C_1 - C_4 alkoxy. It is well known for a person skilled in the art that there are many methods for the hydrolysis of such esters depending on the nature of the alkoxy group. One widely used method to achieve such a transformation is the treatment of the ester with an alkali such as sodium hydroxide in a solvent such as ethanol.

44
44

- 26 -

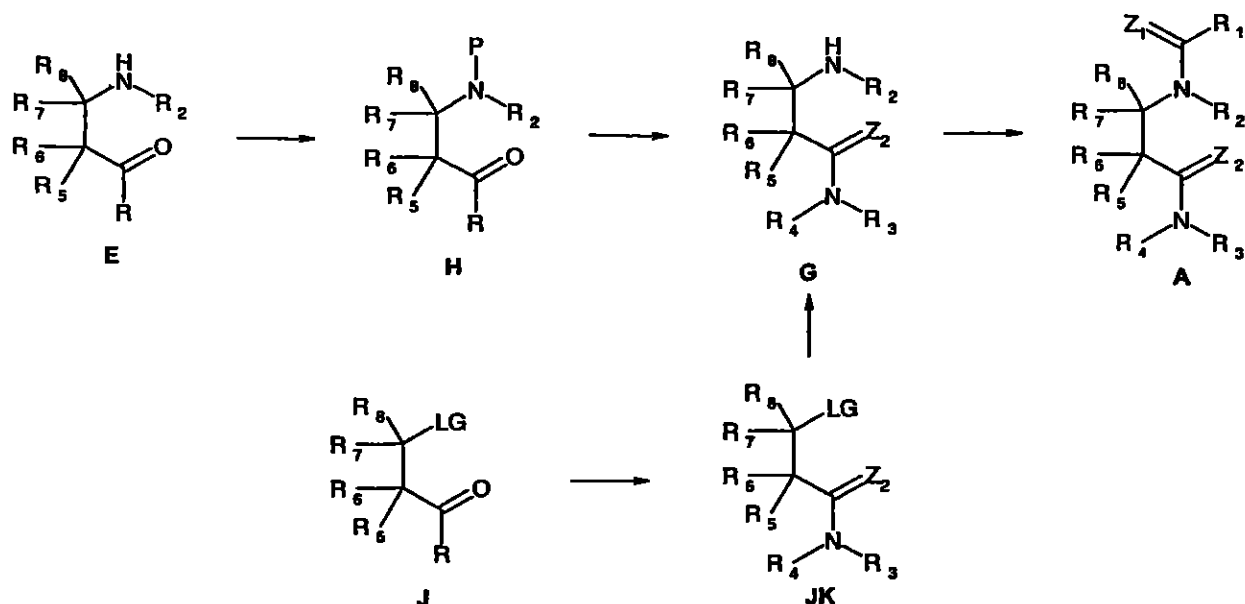
Esters of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is C_1 - C_4 alkoxy, may be made by treatment of compounds of formula E, wherein R is C_1 - C_4 alkoxy, by acylation with compounds of formula

R_1 -COOH or R_1 -COCl under standard conditions as previously described. Compounds of formula E, wherein R is C_1 - C_4 alkoxy, may be made from compounds of formula C by sequential treatment with an alcohol under acidic conditions and then formation of the N - R_2 bond. It is known to a person skilled in the art that there are many reported methods for the formation of this bond depending on the nature of the substituent R_2 . For example, reductive amination may be achieved by treatment of the amine with an aldehyde or ketone and a reducing agent such as sodium cyanoborohydride. Alternatively alkylation may be achieved by treating the amine with an alkylating agent such as an alkyl halide, optionally in the presence of a base. Alternatively arylation may be achieved by treatment of the amine with an aryl halide or sulfonate in the presence of a suitable catalyst/ligand system, often a palladium (0) complex.

Alternatively, compounds of formula E, wherein R is C_1 - C_4 alkoxy, may be made from a compound of formula F, wherein R is C_1 - C_4 alkoxy and LG is a leaving group such as fluoro, chloro or sulfonate, via nucleophilic displacement of the leaving group by an amine of formula R_2 - NH_2 . Such compounds of formula F and amines of formula R_2 - NH_2 are either known compounds or can be made by known methods obvious to someone skilled in the art.

Compounds of formula A, wherein Z_1 is sulfur and Z_2 is oxygen, can be made from compounds of formula D, wherein Z_1 is oxygen and R is OH or C_1 - C_4 alkoxy, by treatment with a thio-transfer reagent such as Lawesson's reagent or phosphorus pentasulfide prior to coupling with the amine of formula NHR_3R_4 .

Alternatively, compounds of formula D, wherein R is OH and Z_1 is oxygen, may be dehydrated to benzoxazinones of formula B by treatment with a dehydrating agent such as acetic anhydride.



Alternatively, compounds of formula A, wherein Z₁ and Z₂ are oxygen, may be made by the treatment of compounds of formula G, wherein Z₂ is oxygen, with a carboxylic acid of formula R₁-COOH or an acid chloride of formula R₁-COCl as previously described.

Compounds of formula G, wherein Z₂ is oxygen, may be formed from compounds of formula H, wherein P is a suitable protecting group and R is OH, Cl or C₁-C₄alkoxy, by amide bond formation with an amine of formula NHR₂R₃ as previously described for compounds of formula D, followed by removal of the protecting group P under standard conditions.

Compounds of formula H, wherein R is OH or C₁-C₄alkoxy, may be made by the protection of the amine functionality in compounds of formula E, wherein R is OH or C₁-C₄alkoxy.

Suitable protecting groups include carbamates (such as t-butyloxycarbonyl, allyloxycarbonyl and benzyloxycarbonyl), trialkylsilyl groups (such as t-butyldimethylsilyl) and acyl groups (such as acetyl). The formation and removal of such groups is widely reported in the literature and is well known to a person skilled in the art.

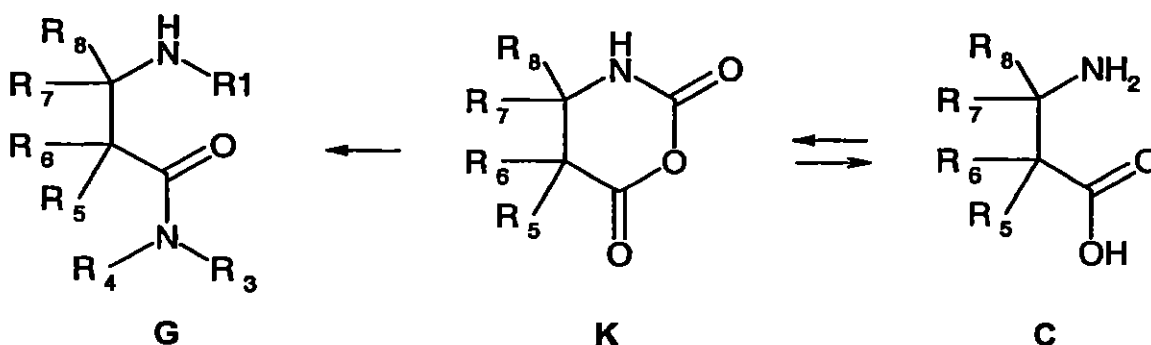
For compounds of formula H and compounds of formula E, the esters (wherein R is C₁-C₄alkoxy) may be hydrolysed to the acids (wherein R is OH) by treatment with an alkali such as sodium hydroxide in a solvent such as ethanol. The acids (wherein R is OH) may be converted to the acid chlorides (wherein R is Cl) by treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride as previously described for compounds of formula D.

Alternatively, it may be possible to convert compounds of formula E, wherein R is OH, Cl or C₁-C₄alkoxy, directly to compounds of formula G by amide bond formation with an amine of

formula NHR_3R_4 under standard conditions (as previously described for compounds of formula D).

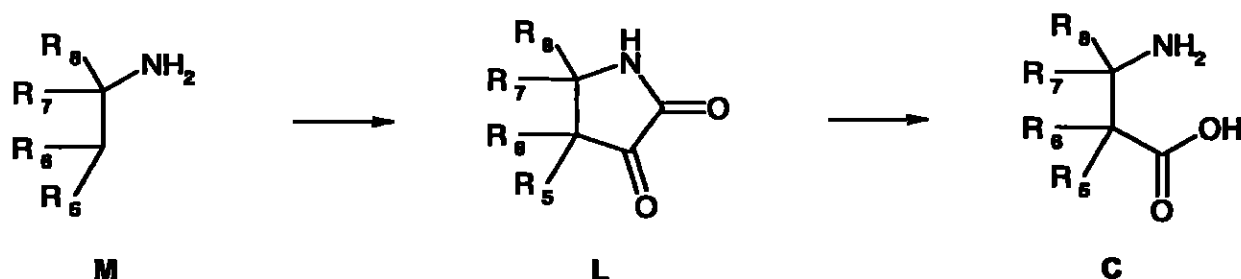
Alternatively, compounds of formula G, wherein Z_2 is oxygen, may be made from compounds of formula JK, wherein Z_2 is oxygen and LG is a leaving group such as fluoro, chloro or sulfonate, by displacement of the leaving group with a compound of formula R_2NH_2 . Such reactions are usually performed under basic conditions. Such compounds of formula JK may be made from compounds of formula J, wherein R is Cl or OH and LG is a leaving group as previously described, via amide bond formation under standard conditions as previously described. Such compounds of formula J and formula E are either known compounds or may be made by known methods by someone skilled in the art.

Compounds of formula A, wherein Z_1 is oxygen and Z_2 is sulfur, may be made by treatment of compounds of formula JK, wherein Z_2 is oxygen and LG is a leaving group, or compounds of formula G, wherein Z_2 is oxygen, with a thio-transfer reagent such as Lawesson's reagent or phosphorus pentasulfide prior to elaborating to compounds of formula A, wherein Z_1 is oxygen and Z_2 is sulfur, as previously described for compounds of formula A, wherein Z_1 is oxygen and Z_2 is oxygen).

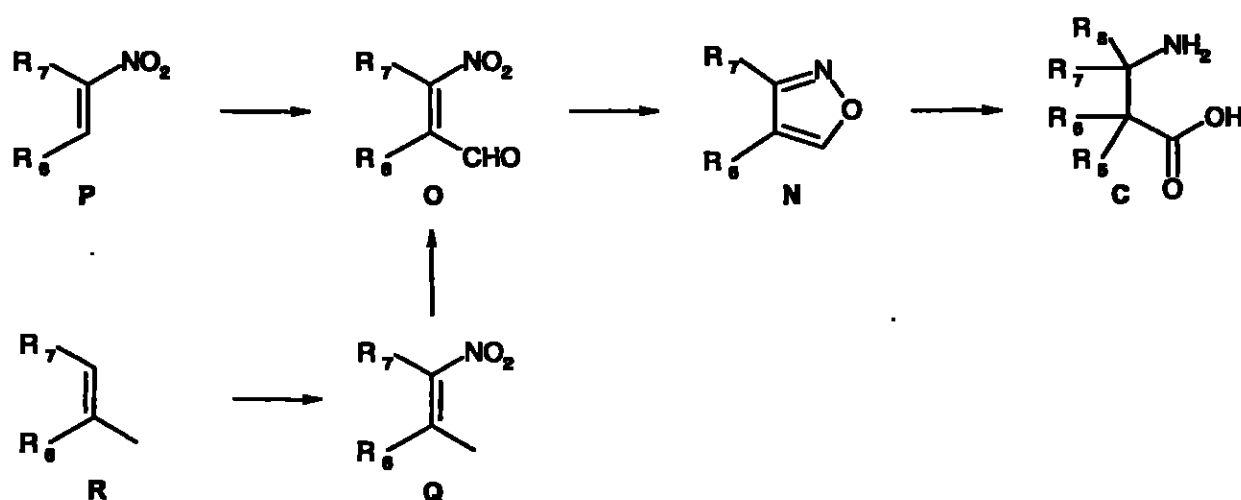


Compounds of formula C are either known or may be made by methods known to a person skilled in the art. For instance, amino acids of formula C may be formed by hydrolysis of isatoic anhydrides of formula K. Alternatively, isatoic anhydrides of formula K may be reacted with amines of formula NHR_3R_4 to give compounds of formula G, wherein R_1 is H, directly. Isatoic anhydrides of formula K are either known compounds or may be made by known methods obvious to those skilled in the art, for instance they may be derived from treatment

of amino acids of formula C with phosgene or a synthetic equivalent of phosgene (for example carbonyl diimidazole).

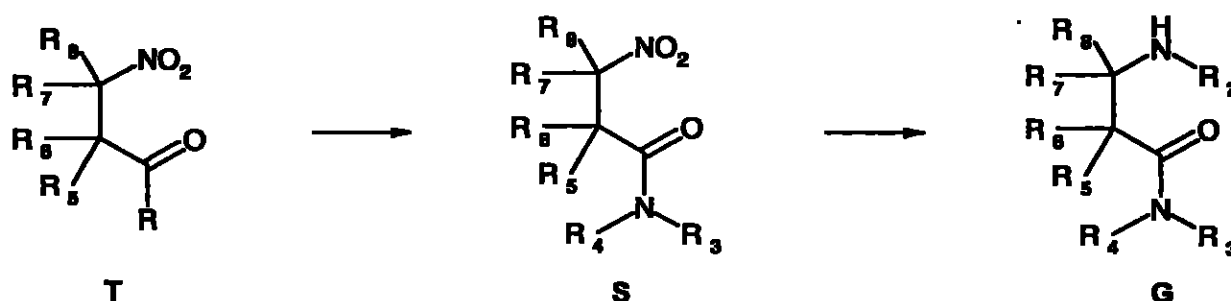


Alternatively, compounds of formula C may be derived from the treatment of an isatin of formula L with hydrogen peroxide under basic conditions. Isatins of formula L are either known or may be made by methods known to persons skilled in the art, for example they may be derived from amino compounds of formula M, wherein R₅ and R₈ taken together form an additional bond between the carbon atoms bearing substituents R₆ and R₇, by treatment for example with oxalyl chloride (optionally in the presence of a Lewis acid catalyst) or chloral hydrate under various conditions. Amino compounds of formula M are either known compounds or may be made by known methods obvious to those skilled in the art.



Alternatively, compounds of formula C, wherein R₅ and R₈ taken together form an additional bond between the carbon atoms bearing substituents R₆ and R₇, may be derived from the treatment of an isoxazole of formula N with aqueous base. Isoxazoles of formula N may be

derived from nitroaldehydes of formula O by treatment with a reducing agent such as zinc in acetic acid. Nitroaldehydes of formula O are either known or may be made by methods known to persons skilled in the art, for instance they may be derived from nitro compounds of formula P by treatment with chloroform under basic conditions followed by treatment with strong aqueous acid. Alternatively, nitroaldehydes of formula O may be derived from oxidation of 1-nitro-2-methyl aromatic compounds of formula Q. A particularly convenient method of achieving such an oxidation involves treating the compound Q with dimethylformamide dimethylacetal under basic conditions followed by treatment with sodium periodate. Compounds of formula P and Q are either known or may be made by methods known to those skilled in the art, for instance compounds of formula Q may be synthesised from compounds of formula R by nitration (e.g. with a mixture of nitric acid and sulphuric acid).



An alternative synthesis of compounds of formula G, wherein R_2 is hydrogen, may be achieved by the reduction of nitro compounds of formula S. There are numerous methods for achieving such a transformation reported in the literature such as treatment with tin or iron under acidic conditions, or hydrogenation catalysed by a noble metal such as palladium on carbon. Compounds of formula S may be derived from compounds of formula T, wherein R is OH, Cl, or $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkoxy, via acylation with an amine of formula NHR_3R_4 under the standard conditions already described for a compound of formula D. Similarly conversion of esters of formula T, wherein R is $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkoxy, to acids of formula T, wherein R is OH, to acid chlorides of formula T, wherein R is Cl, is also described for compounds of formula D. Compounds of formula T are either known or may be made by methods known to persons skilled in the art.

It must be recognised that some reagents and reaction conditions may not be compatible with certain functionalities that may be present in the molecules described. In such cases it

49

may be necessary to employ standard protection/deprotection protocols comprehensively reported in the literature and well known to a person skilled in the art.

Also in some cases it may be necessary to perform further routine synthetic steps not described herein to complete the synthesis of the desired compounds. An artisan will also recognise that it may be possible to achieve the synthesis of the desired compounds by performing some of the steps in these synthetic routes in a different order to that described.

A person skilled in the art will also recognise that it may be possible to perform standard functional group interconversions or substitution reactions on the compounds described herein to introduce or modify existing substituents.

The reactants can preferably be reacted in the presence of a base. Examples of suitable bases are alkali metal or alkaline earth metal hydroxides, alkali metal or alkaline earth metal hydrides, alkali metal or alkaline earth metal amides, alkali metal or alkaline earth metal alkoxides, alkali metal or alkaline earth metal acetates, alkali metal or alkaline earth metal carbonates, alkali metal or alkaline earth metal dialkylamides or alkali metal or alkaline earth metal alkylsilylamides, alkylamines, alkylenediamines, free or N-alkylated saturated or unsaturated cycloalkylamines, basic heterocycles, ammonium hydroxides and carbocyclic amines. Examples which may be mentioned are sodium hydroxide, sodium hydride, sodium amide, sodium methoxide, sodium acetate, sodium carbonate, potassium tert-butoxide, potassium hydroxide, potassium carbonate, potassium hydride, lithium diisopropylamide, potassium bis(trimethylsilyl)amide, calcium hydride, triethylamine, diisopropylethylamine, triethylenediamine, cyclohexylamine, N-cyclohexyl-N,N-dimethylamine, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-(N,N-dimethylamino)pyridine, quinuclidine, N-methylmorpholine, benzytrimethylammonium hydroxide and 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene (DBU).

The reactions are advantageously carried out in a temperature range from approximately -80°C to approximately +140°C, preferably from approximately -30°C to approximately +100°C, in many cases in the range between room temperature and approximately +80°C.

The compounds of formula B, D and of formula A, wherein Z₂ is sulfur (compounds of formula AA) and, where appropriate, the tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, are novel and are also subjects of the invention.

Salts of compounds of formula I can be prepared in a manner known per se. Thus, for example, acid addition salts of compounds of formula I are obtained by treatment with a suitable acid or a suitable ion exchanger reagent and salts with bases are obtained by treatment with a suitable base or with a suitable ion exchanger reagent.

Salts of compounds of formula I can be converted in the customary manner into the free compounds of formula I, acid addition salts, for example, by treatment with a suitable basic compound or with a suitable ion exchanger reagent and salts with bases, for example, by treatment with a suitable acid or with a suitable ion exchanger reagent.

Salts of compounds of formula I can be converted in a manner known per se into other salts of compounds of formula I, acid addition salts, for example, into other acid addition salts, for example by treatment of a salt of inorganic acid such as hydrochloride with a suitable metal salt such as a sodium, barium or silver salt, of an acid, for example with silver acetate, in a suitable solvent in which an inorganic salt which forms, for example silver chloride, is insoluble and thus precipitates from the reaction mixture.

Depending on the procedure or the reaction conditions, the compounds of formula I, which have salt-forming properties can be obtained in free form or in the form of salts.

The compounds of formula I and, where appropriate, the tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, can be present in the form of one of the isomers which are possible or as a mixture of these, for example in the form of pure isomers, such as antipodes and/or diastereomers, or as isomer mixtures, such as enantiomer mixtures, for example racemates, diastereomer mixtures or racemate mixtures, depending on the number, absolute and relative configuration of asymmetric carbon atoms which occur in the molecule and/or depending on the configuration of non-aromatic double bonds which occur in the molecule; the invention relates to the pure isomers and also to all isomer mixtures which are possible and is to be understood in each case in this sense hereinabove and hereinbelow, even when stereochemical details are not mentioned specifically in each case.

Diastereomer mixtures or racemate mixtures of compounds of formula I, in free form or in salt form, which can be obtained depending on which starting materials and procedures have

been chosen can be separated in a known manner into the pure diastereomers or racemates on the basis of the physicochemical differences of the components, for example by fractional crystallization, distillation and/or chromatography.

Enantiomer mixtures, such as racemates, which can be obtained in a similar manner can be resolved into the optical antipodes by known methods, for example by recrystallization from an optically active solvent, by chromatography on chiral adsorbents, for example high-performance liquid chromatography (HPLC) on acetyl cellulose, with the aid of suitable microorganisms, by cleavage with specific, immobilized enzymes, via the formation of inclusion compounds, for example using chiral crown ethers, where only one enantiomer is complexed, or by conversion into diastereomeric salts, for example by reacting a basic end-product racemate with an optically active acid, such as a carboxylic acid, for example camphor, tartaric or malic acid, or sulfonic acid, for example camphorsulfonic acid, and separating the diastereomer mixture which can be obtained in this manner, for example by fractional crystallization based on their differing solubilities, to give the diastereomers, from which the desired enantiomer can be set free by the action of suitable agents, for example basic agents.

Pure diastereomers or enantiomers can be obtained according to the invention not only by separating suitable isomer mixtures, but also by generally known methods of diastereoselective or enantioselective synthesis, for example by carrying out the process according to the invention with starting materials of a suitable stereochemistry.

It is advantageous to isolate or synthesize in each case the biologically more effective isomer, for example enantiomer or diastereomer, or isomer mixture, for example enantiomer mixture or diastereomer mixture, if the individual components have a different biological activity.

The compounds of formula I and, where appropriate, the tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, can, if appropriate, also be obtained in the form of hydrates and/or include other solvents, for example those which may have been used for the crystallization of compounds which are present in solid form.

The invention relates to all those embodiments of the process by which, starting from a compound obtainable at any level of the process as starting material or intermediate, all or

some of the missing steps are carried out or a starting material is used in the form of a derivative and/or salt and/or racemates or antipodes thereof or, in particular, is formed under the reaction conditions.

Those starting materials and intermediates, in each case in free form or in salt form, which lead to the compounds of formula I or salts thereof which have been described at the outset as being particularly valuable are preferably used in the process of the present invention.

In particular, the invention relates to the preparation processes described in the Examples P1 to P11.

Starting materials and intermediates, in each case in free form or salt form, which are used in accordance with the invention for the preparation of the compounds of formula I or salts thereof and which are novel, a process for their preparation, and their use as starting materials and intermediates for the preparation of the compounds of formula I are also a subject of the invention; in particular, this applies to the compounds of formula II, IV and V.

The compounds of formula I according to the invention are preventively and/or curatively valuable active ingredients in the field of pest control, even at low rates of application, which have a very favorable biocidal spectrum and are well tolerated by warm-blooded species, fish and plants. The active ingredients according to the invention act against all or individual developmental stages of normally sensitive, but also resistant, animal pests, such as insects or representatives of the order Acarina. The insecticidal or acaricidal activity of the active ingredients according to the invention can manifest itself directly, i. e. in destruction of the pests, which takes place either immediately or only after some time has elapsed, for example during ecdysis, or indirectly, for example in a reduced oviposition and/or hatching rate, a good activity corresponding to a destruction rate (mortality) of at least 50 to 60%.

Examples of the abovementioned animal pests are:

from the order *Acarina*, for example,

Acarus siro, *Aceria sheldoni*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Calipitrimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus carpini*, *Eriophyes* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Oligonychus pratensis*, *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polypha-*

gotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp. and Tetranychus spp.;

from the order *Anoplura*, for example,

Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Pemphigus spp. and Phylloxera spp.;

from the order *Coleoptera*, for example,

Agriotes spp., Anthonomus spp., Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cosmopolites spp., Curculio spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Eremnus spp., Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus spp., Melolontha spp., Orycaephilus spp., Otiorhynchus spp., Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Tenebrio spp., Tribollum spp. and Trogoderma spp.;

from the order *Diptera*, for example,

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypodermia spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sclara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. and Tipula spp.;

from the order *Heteroptera*, for example,

Cimex spp., Distantiella theobroma, Dysdercus spp., Euchistus spp., Eurygaster spp., Lep-tocoris spp., Nezara spp., Piesma spp., Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotino-phara spp. and Triatoma spp.;

from the order *Homoptera*, for example,

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma lanigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephrotettix spp., Nilaparvata spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erythrae and Unaspis citri;

from the order *Hymenoptera*, for example,

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp. and Vespa spp.;

from the order *Isoptera*, for example,

Reticulitermes spp.;

from the order *Lepidoptera*, for example,

Acleris spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatalis*, *Archips* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Clysia ambigua*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydia* spp., *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp., *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis* spp., *Lobesia botrana*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Operophtera* spp., *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni* and *Yponomeuta* spp.;

from the order *Mallophaga*, for example,

Damallinea spp. and *Trichodectes* spp.;

from the order *Orthoptera*, for example,

Blatta spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Periplaneta* spp. and *Schistocerca* spp.;

from the order *Psocoptera*, for example,

Liposcells spp.;

from the order *Siphonaptera*, for example,

Ceratophyllus spp., *Ctenocephalides* spp. and *Xenopsylla cheopis*;

from the order *Thysanoptera*, for example,

Frankliniella spp., *Hercinothrips* spp., *Scirtothrips aurantii*, *Taeniothrips* spp., *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*; and

from the order *Thysanura*, for example,

Lepisma saccharina.

The active ingredients according to the invention can be used for controlling, i. e. containing or destroying, pests of the abovementioned type which occur in particular on plants, especially on useful plants and ornamentals in agriculture, in horticulture and in forests, or on or-

58
95

- 37 -

gans, such as fruits, flowers, foliage, stalks, tubers or roots, of such plants, and in some cases even plant organs which are formed at a later point in time remain protected against these pests.

Suitable target crops are, in particular, cereals, such as wheat, barley, rye, oats, rice, maize or sorghum; beet, such as sugar or fodder beet; fruit, for example pomaceous fruit, stone fruit or soft fruit, such as apples, pears, plums, peaches, almonds, cherries or berries, for example strawberries, raspberries or blackberries; leguminous crops, such as beans, lentils, peas or soya; oil crops, such as oilseed rape, mustard, poppies, olives, sunflowers, coconut, castor, cocoa or ground nuts; cucurbits, such as pumpkins, cucumbers or melons; fibre plants, such as cotton, flax, hemp or jute; citrus fruit, such as oranges, lemons, grapefruit or tangerines; vegetables, such as spinach, lettuce, asparagus, cabbages, carrots, onions, tomatoes, potatoes or bell peppers; Lauraceae, such as avocado, Cinnamomum or camphor; and also tobacco, nuts, coffee, eggplants, sugarcane, tea, pepper, grapevines, hops, the plantain family, latex plants and ornamentals.

The active ingredients according to the invention are especially suitable for controlling *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* and *Spodoptera littoralis* in cotton, vegetable, maize, rice and soya crops.

The term "crops" is to be understood as including also crops that have been rendered tolerant to herbicides like bromoxynil or classes of herbicides (such as, for example, HPPD inhibitors, ALS inhibitors, for example primisulfuron, prosulfuron and trifloxysulfuron, EPSPS (5-enol-pyrovyl-shikimate-3-phosphate-synthase) inhibitors, GS (glutamine synthetase) inhibitors as a result of conventional methods of breeding or genetic engineering. An example of a crop that has been rendered tolerant to imidazolinones, e.g. imazamox, by conventional methods of breeding (mutagenesis) is Clearfield® summer rape (Canola). Examples of crops that have been rendered tolerant to herbicides or classes of herbicides by genetic engineering methods include glyphosate- and glufosinate-resistant maize varieties commercially available under the trade names RoundupReady®, Herculex I® and LibertyLink®.

The term "crops" is to be understood as including also crop plants which have been so transformed by the use of recombinant DNA techniques that they are capable of synthesising one or more selectively acting toxins, such as are known, for example, from toxin-producing bacteria, especially those of the genus *Bacillus*.

Toxins that can be expressed by such transgenic plants include, for example, insecticidal proteins, for example insecticidal proteins from *Bacillus cereus* or *Bacillus popillae*; or insecticidal proteins from *Bacillus thuringiensis*, such as δ -endotoxins, e.g. CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) or Cry9c, or vegetative insecticidal proteins (VIP), e.g. VIP1, VIP2, VIP3 or VIP3A; or insecticidal proteins of bacteria colonising nematodes, for example *Photorhabdus* spp. or *Xenorhabdus* spp., such as *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxins produced by animals, such as scorpion toxins, arachnid toxins, wasp toxins and other insect-specific neurotoxins; toxins produced by fungi, such as *Streptomyces* toxins, plant lectins, such as pea lectins, barley lectins or snowdrop lectins; agglutinins; proteinase inhibitors, such as trypsin inhibitors, serine protease inhibitors, patatin, cystatin, papain inhibitors; ribosome-inactivating proteins (RIP), such as ricin, maize-RIP, abrin, luffin, saporin or bryodin; steroid metabolism enzymes, such as 3-hydroxysteroidoxidase, ecdysteroid-UDP-glycosyl-transferase, cholesterol oxidases, ecdysone inhibitors, HMG-CoA-reductase, ion channel blockers, such as blockers of sodium or calcium channels, juvenile hormone esterase, diuretic hormone receptors, stilbene synthase, bibenzyl synthase, chitinases and glucanases.

In the context of the present invention there are to be understood by δ -endotoxins, for example CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) or Cry9c, or vegetative insecticidal proteins (VIP), for example VIP1, VIP2, VIP3 or VIP3A, expressly also hybrid toxins, truncated toxins and modified toxins. Hybrid toxins are produced recombinantly by a new combination of different domains of those proteins (see, for example, WO 02/15701). In the case of modified toxins, one or more amino acids of the naturally occurring toxin are replaced. In such amino acid replacements, preferably non-naturally present protease recognition sequences are inserted into the toxin, such as, for example, in the case of CryIIIA055, a cathepsin-D-recognition sequence is inserted into a CryIIIA toxin (see WO 03/018810).

57
57

Examples of such toxins or transgenic plants capable of synthesising such toxins are disclosed, for example, in EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 and WO 03/052073.

The processes for the preparation of such transgenic plants are generally known to the person skilled in the art and are described, for example, in the publications mentioned above. CryI-type deoxyribonucleic acids and their preparation are known, for example, from WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 and WO 90/13651.

The toxin contained in the transgenic plants imparts to the plants tolerance to harmful insects. Such insects can occur in any taxonomic group of insects, but are especially commonly found in the beetles (Coleoptera), two-winged insects (Diptera) and butterflies (Lepidoptera).

Transgenic plants containing one or more genes that code for an insecticidal resistance and express one or more toxins are known and some of them are commercially available. Examples of such plants are: YieldGard® (maize variety that expresses a CryIA(b) toxin); YieldGard Rootworm® (maize variety that expresses a CryIIIB(b1) toxin); YieldGard Plus® (maize variety that expresses a CryIA(b) and a CryIIIB(b1) toxin); Starlink® (maize variety that expresses a Cry9(c) toxin); Herculex I® (maize variety that expresses a CryIF(a2) toxin and the enzyme phosphinothricine N-acetyltransferase (PAT) to achieve tolerance to the herbicide glufosinate ammonium); NuCOTN 33B® (cotton variety that expresses a CryIA(c) toxin); Bollgard I® (cotton variety that expresses a CryIA(c) toxin); Bollgard II® (cotton variety that expresses a CryIA(c) and a CryIIA(b) toxin); VIPCOT® (cotton variety that expresses a VIP toxin); NewLeaf® (potato variety that expresses a CryIIIA toxin); NatureGard® and Protecta®.

Further examples of such transgenic crops are:

1. Bt11 Maize from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Genetically modified *Zea mays* which has been rendered resistant to attack by the European corn borer (*Ostrinia nubilalis* and *Sesamia nonagrioides*) by transgenic expression of a truncated CryIA(b) toxin. Bt11 maize also

transgenically expresses the enzyme PAT to achieve tolerance to the herbicide glufosinate ammonium.

2. **Bt176 Maize** from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Genetically modified *Zea mays* which has been rendered resistant to attack by the European corn borer (*Ostrinia nubilalis* and *Sesamia nonagrioides*) by transgenic expression of a CryIA(b) toxin.

3. **MIR604 Maize** from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Maize which has been rendered insect-resistant by transgenic expression of a modified CryIIIA toxin. This toxin is Cry3A055 modified by insertion of a cathepsin-D-protease recognition sequence. The preparation of such transgenic maize plants is described in WO 03/018810.

4. **MON 863 Maize** from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/DE/02/9. MON 863 expresses a CryIIIB(b1) toxin and has resistance to certain Coleoptera insects.

5. **IPC 531 Cotton** from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/ES/96/02.

6. **1507 Maize** from Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, registration number C/NL/00/10. Genetically modified maize for the expression of the protein Cry1F for achieving resistance to certain Lepidoptera insects and of the PAT protein for achieving tolerance to the herbicide glufosinate ammonium.

7. **NK603 × MON 810 Maize** from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/GB/02/M3/03. Consists of conventionally bred hybrid maize varieties by crossing the genetically modified varieties NK603 and MON 810. NK603 × MON 810 Maize transgenically expresses the protein CP4 EPSPS, obtained from *Agrobacterium sp.* strain CP4, which imparts tolerance to the herbicide Roundup® (contains glyphosate), and also a CryIA(b) toxin obtained from *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* which brings about tolerance to certain Lepidoptera, include the European corn borer.

89
59

Transgenic crops of insect-resistant plants are also described in BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>).

The term "crops" is to be understood as including also crop plants which have been so transformed by the use of recombinant DNA techniques that they are capable of synthesising antipathogenic substances having a selective action, such as, for example, the so-called "pathogenesis-related proteins" (PRPs, see e.g. EP-A-0 392 225). Examples of such antipathogenic substances and transgenic plants capable of synthesising such antipathogenic substances are known, for example, from EP-A-0 392 225, WO 95/33818, and EP-A-0 353 191. The methods of producing such transgenic plants are generally known to the person skilled in the art and are described, for example, in the publications mentioned above.

Antipathogenic substances which can be expressed by such transgenic plants include, for example, ion channel blockers, such as blockers for sodium and calcium channels, for example the viral KP1, KP4 or KP6 toxins; stilbene synthases; bibenzyl synthases; chitinases; glucanases; the so-called "pathogenesis-related proteins" (PRPs; see e.g. EP-A-0 392 225); antipathogenic substances produced by microorganisms, for example peptide antibiotics or heterocyclic antibiotics (see e.g. WO 95/33818) or protein or polypeptide factors involved in plant pathogen defence (so-called "plant disease resistance genes", as described in WO 03/000906).

Other fields of application of the active ingredients according to the invention are the protection of stored products and stores and of material, such as wood, textiles, floor coverings or buildings, and, in the hygiene sector, particularly the protection of humans, domestic animals and productive livestock against pests of the abovementioned type.

The invention therefore also relates to pesticidal compositions such as emulsifiable concentrates, suspension concentrates, directly sprayable or dilutable solutions, spreadable pastes, dilute emulsions, soluble powders, dispersible powders, wettable powders, dusts, granules or encapsulations in polymeric substances, which comprise - at least - one of the active ingredients according to the invention and which are to be selected to suit the intended aims and the prevailing circumstances.

57
60

In these compositions, the active ingredient is employed in pure form, a solid active ingredient for example in a specific particle size, or, preferably, together with - at least - one of the auxiliaries conventionally used in the art of formulation, such as extenders, for example solvents or solid carriers, or such as surface-active compounds (surfactants).

Examples of suitable solvents are: unhydrogenated or partially hydrogenated aromatic hydrocarbons, preferably the fractions C₈ to C₁₂ of alkylbenzenes, such as xylene mixtures, alkylated naphthalenes or tetrahydronaphthalene, aliphatic or cycloaliphatic hydrocarbons, such as paraffins or cyclohexane, alcohols such as ethanol, propanol or butanol, glycols and their ethers and esters such as propylene glycol, dipropylene glycol ether, ethylene glycol or ethylene glycol monomethyl ether or ethylene glycol monoethyl ether, ketones, such as cyclohexanone, isophorone or diacetone alcohol, strongly polar solvents, such as N-methylpyrrolid-2-one, dimethyl sulfoxide or N,N-dimethylformamide, water, unepoxidized or epoxidized vegetable oils, such as unepoxidized or epoxidized rapeseed, castor, coconut or soya oil, and silicone oils.

Solid carriers which are used for example for dusts and dispersible powders are, as a rule, ground natural minerals such as calcite, talc, kaolin, montmorillonite or attapulgite. To improve the physical properties, it is also possible to add highly disperse silicas or highly disperse absorptive polymers. Suitable particulate adsorptive carriers for granules are porous types, such as pumice, brick grit, sepiolite or bentonite, and suitable non-sorptive carrier materials are calcite or sand. In addition, a large number of granulated materials of inorganic or organic nature can be used, in particular dolomite or comminuted plant residues.

Suitable surface-active compounds are, depending on the type of the active ingredient to be formulated, non-ionic, cationic and/or anionic surfactants or surfactant mixtures which have good emulsifying, dispersing and wetting properties. The surfactants mentioned below are only to be considered as examples; a large number of further surfactants which are conventionally used in the art of formulation and suitable according to the invention are described in the relevant literature.

Suitable non-ionic surfactants are, especially, polyglycol ether derivatives of aliphatic or cycloaliphatic alcohols, of saturated or unsaturated fatty acids or of alkyl phenols which may

.. 21
61

contain approximately 3 to approximately 30 glycol ether groups and approximately 8 to approximately 20 carbon atoms in the (cyclo)aliphatic hydrocarbon radical or approximately 6 to approximately 18 carbon atoms in the alkyl moiety of the alkyl phenols. Also suitable are water-soluble polyethylene oxide adducts with polypropylene glycol, ethylenediaminopolypropylene glycol or alkyl polypropylene glycol having 1 to approximately 10 carbon atoms in the alkyl chain and approximately 20 to approximately 250 ethylene glycol ether groups and approximately 10 to approximately 100 propylene glycol ether groups. Normally, the abovementioned compounds contain 1 to approximately 5 ethylene glycol units per propylene glycol unit. Examples which may be mentioned are nonylphenoxypolyethoxyethanol, castor oil polyglycol ether, polypropylene glycol/polyethylene oxide adducts, tributylphenoxypolyethoxyethanol, polyethylene glycol or octylphenoxypolyethoxyethanol. Also suitable are fatty acid esters of polyoxyethylene sorbitan, such as polyoxyethylene sorbitan trioleate.

The cationic surfactants are, especially, quaternary ammonium salts which generally have at least one alkyl radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms as substituents and as further substituents (unhalogenated or halogenated) lower alkyl or hydroxyalkyl or benzyl radicals. The salts are preferably in the form of halides, methylsulfates or ethylsulfates. Examples are stearyltrimethylammonium chloride and benzylbis(2-chloroethyl)ethylammonium bromide.

Examples of suitable anionic surfactants are water-soluble soaps or water-soluble synthetic surface-active compounds. Examples of suitable soaps are the alkali, alkaline earth or (unsubstituted or substituted) ammonium salts of fatty acids having approximately 10 to approximately 22 C atoms, such as the sodium or potassium salts of oleic or stearic acid, or of natural fatty acid mixtures which are obtainable for example from coconut or tall oil; mention must also be made of the fatty acid methyl taurates. However, synthetic surfactants are used more frequently, in particular fatty sulfonates, fatty sulfates, sulfonated benzimidazole derivatives or alkylaryl sulfonates. As a rule, the fatty sulfonates and fatty sulfates are present as alkali, alkaline earth or (substituted or unsubstituted) ammonium salts and they generally have an alkyl radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms, alkyl also to be understood as including the alkyl moiety of acyl radicals; examples which may be mentioned are the sodium or calcium salts of lignosulfonic acid, of the dodecylsulfuric ester or of a fatty alcohol sulfate mixture prepared from natural fatty acids. This group also includes the salts of the sulfuric esters and sulfonic acids of fatty alcohol/ethylene oxide adducts. The

62
62

- 44 -

sulfonated benzimidazole derivatives preferably contain 2 sulfonyl groups and a fatty acid radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms. Examples of alkylarylsulfonates are the sodium, calcium or triethanolammonium salts of decylbenzenesulfonic acid, of dibutyl-naphthalenesulfonic acid or of a naphthalenesulfonic acid/formaldehyde condensate. Also possible are, furthermore, suitable phosphates, such as salts of the phosphoric ester of a p-nonylphenol/(4-14)ethylene oxide adduct, or phospholipids.

As a rule, the compositions comprise from 0.0001 to 99.9999 %, in particular 0.1 to 95 %, of active ingredient, and 0.0001 to 99.9999 %, in particular 5 to 99.9 %, of - at least - one solid or liquid auxiliary, it being possible, as a rule, for 0 to 25 %, in particular 0.1 to 20 %, of the compositions to be surfactants (% in each case is per cent by weight). While concentrated compositions are more preferred as commercially available goods, the end user uses, as a rule, dilute compositions which have considerably lower concentrations of active ingredient.

The activity of the compositions according to the invention can be broadened considerably, and adapted to prevailing circumstances, by adding other insecticidally or acaricidally active ingredients. Suitable additions to active ingredients here are, for example, representatives of the following classes of active ingredients: organophosphorus compounds, nitrophenol derivatives, thioureas, juvenile hormones, formamidines, benzophenone derivatives, ureas, pyrrole derivatives, carbamates, pyrethroids, chlorinated hydrocarbons, acylureas, pyridyl-methyleneamino derivatives, macrolides, neonicotinoids and *Bacillus thuringiensis* preparations.

Examples of especially suitable mixing partners include compounds selected from the following group M:

Group M: especially suitable mixing partners for the compounds of formula I:

azamethiphos; chlorfenvinphos; cypermethrin, cypermethrin high-cis; cyromazine; diafenthiuron; diazinon; dichlorvos; dicrotophos; dicyclanil; fenoxycarb; fluazuron; furathiocarb; isazofos; lodfenphos; kinoprene; lufenuron; methacriphos; methidathion; monocrotophos; phosphamidon; profenofos; diofenolan; a compound obtainable from the *Bacillus thuringiensis* strain GC91 or from strain NCTC11821; pymetrozine; bromopropylate; methoprene; disulfoton; quinalphos; tau-fluvalinate; thiocyclam; thiometon; aldicarb; azinphos-methyl; benfuracarb; bifenthrin; buprofezin; carbofuran; dibutylaminothio; cartap;

chlorfluazuron; chlorpyrifos; cyfluthrin; lambda-cyhalothrin; alpha-cypermethrin; zeta-cypermethrin; deltamethrin; diflubenzuron; endosulfan; ethiofencarb; fenitrothion; fenobucarb; fenvalerate; formothion; methiocarb; heptenophos; imidacloprid; thiamethoxam; clothianidin; isoprocarb; methamidophos; methomyl; mevinphos; parathion; parathion-methyl; phosalone; pirimicarb; propoxur; teflubenzuron; terbufos; triazamate; fenobucarb; tebufenozide; fipronil; beta-cyfluthrin; silafluofen; fenpyroximate; pyridaben; fenazaquin; pyriproxyfen; pyrimidifen; nitenpyram; acetamiprid; emamectin; emamectin-benzoate; spinosad; a plant extract that is active against insects; a preparation that comprises nematodes and is active against insects; a preparation obtainable from *Bacillus subtilis*; a preparation that comprises fungi and is active against insects; a preparation that comprises viruses and is active against insects; chlorfenapyr; acephate; acrinathrin; alanycarb; alphamethrin; amitraz; AZ 60541; azinphos A; azinphos M; azocyclotin; bendlocarb; bensultap; beta-cyfluthrin; BPMC; brofenprox; bromophos A; bufencarb; butocarboxin; butylpyridaben; cadusafos; carbaryl; carbophenothion; chloethocarb; chlorethoxyfos; chlor-mephos; cis-resmethrin; clopythrin; clofentezine; cyanophos; cycloprothrin; cyhexatin; demeton M; demeton S; demeton-S-methyl; dichlofenthion; dicliphos; diethion; dimethoate; dimethylvinphos; dioxathion; edifenphos; esfenvalerate; ethion; ethofenprox; ethoprophos; etrimphos; fenamiphos; fenbutatin oxide; fenothiocarb; fenpropathrin; fenpyrad; fenthion; fluazinam; flucycloxuron; flucythrinate; flufenoxuron; flufenprox; fonophos; fosthiazate; fubfenprox; HCH; hexaflumuron; hexythiazox; IKI-220; iprobenfos; isofenphos; isoxathion; ivermectin; malathion; mecarbam; mesulfenphos; metaldehyde; metolcarb; milbemectin; moxidectin; naled; NC 184; omethoate; oxamyl; oxydemethon M; oxydeprofos; permethrin; phenthoate; phorate; phosmet; phoxlm; pirimiphos M; pirimiphos E; promecarb; propaphos; prothiofos; prothoate; pyrachlophos; pyradaphenthion; pyresmethrin; pyrethrum; tebufenozide; salithion; sebufos; sulfotep; sulprofos; tebufenpyrad; tebupirimphos; tefluthrin; temephos; terbam; tetrachlorvinphos; thiacloprid; thiafenox; thiodicarb; thiofanox; thionazin; thuringlensin; tralomethrin; triarathene; triazophos; triazuron; trichlorfon; triflumuron; trimethacarb; vamidothion; xylylcarb; YI 5301/5302; zetamethrin; DPX-MP062 — indoxacarb; methoxyfenozide; bifenazate; XMC (3,5-xylyl methylcarbamate); or the fungus pathogen *Metarhizium anisopliae*.

The following mixtures of the compounds of formula I with one member of the group M are preferred (in the following listing, "M" means one member selected from the group M.)

T1.1 + M; T38.3 + M; T37.3 + M; T20.1 + M; T1.3 + M; T1.121 + M; T2.1 + M; T2.3 + M; T6.1 + M; T6.3 + M; T7.1 + M; T7.3 + M; T21.3 + M; T22.3 + M; T46.1 + M; T46.3 + M; T50.1 + M; T50.3 + M; T51.1 + M; T51.3 + M; T52.1 + M; T52.3 + M; T53.1 + M; T53.3 + M; T72.1 + M; T72.3 + M; T72.207 + M; T72.273 + M; T73.1 + M; T73.3 + M; T73.207 + M; T73.273 + M; T74.1 + M; T74.3 + M; T75.1 + M; T75.3 + M; T76.1 + M; T76.3 + M; T77.1 + M; T77.3 + M; T78.1 + M; T78.3 + M; T79.1 + M; T80.3 + M; T81.1 + M; T81.3 + M; T82.1 + M; T83.3 + M; T84.3 + M and T85.3 + M; P2.001 + M; P2.002 + M; P2.003 + M; P2.004 + M; P2.005 + M; P2.006 + M; P2.007 + M; P2.008 + M; P2.009 + M; P2.010 + M; P2.011 + M; P2.012 + M; P2.013 + M; P2.014 + M; P2.015 + M; P2.016 + M; P2.017 + M; P2.018 + M; P2.019 + M; P2.020 + M; P2.021 + M; P2.022 + M; P2.023 + M; P2.024 + M; P2.025 + M; P2.026 + M; P2.027 + M; P2.028 + M; P2.029 + M; P2.030 + M; P2.031 + M; P2.032 + M; P2.033 + M; P2.034 + M; P2.035 + M; P2.036 + M; P2.037 + M; P2.038 + M; P2.039 + M; P2.040 + M; P2.041 + M; P2.042 + M; P2.043 + M; P2.044 + M; P2.045 + M; P2.046 + M; P2.047 + M; P2.048 + M; P2.049 + M; P2.050 + M; P2.051 + M; P2.052 + M; P2.053 + M; P2.054 + M; P2.055 + M; P2.056 + M; P2.057 + M; P2.058 + M; P2.059 + M; P2.060 + M; P2.061 + M; P2.062 + M; P2.063 + M; P2.064 + M; P2.065 + M; P2.066 + M; P2.067 + M; P2.068 + M; P2.069 + M; P2.070 + M; P2.071 + M; P2.072 + M; P2.073 + M; P2.074 + M; P2.075 + M; P2.076 + M; P2.077 + M; P2.078 + M; P2.079 + M; P2.080 + M; P2.081 + M; P2.082 + M; P2.083 + M; P2.084 + M; P2.085 + M; P2.086 + M; P2.087 + M; P2.088 + M; P2.089 + M; P2.090 + M; P2.091 + M; P2.092 + M; P2.093 + M; P2.094 + M; P2.095 + M; P2.096 + M; P2.097 + M; P2.098 + M; P2.099 + M; P2.100 + M; P2.101 + M; P2.102 + M; P2.103 + M; P2.104 + M; P2.105 + M; P2.106 + M; P2.107 + M; P2.108 + M; P2.109 + M; P2.110 + M; P2.111 + M; P2.112 + M; P2.113 + M; P2.114 + M; P2.115 + M; P2.116 + M; P2.117 + M; P2.118 + M; P2.119 + M; P2.120 + M; P2.121 + M; P2.122 + M; P2.123 + M; P2.124 + M; P2.125 + M; P2.126 + M; P2.127 + M; P2.128 + M; P2.129 + M; P2.130 + M; P2.131 + M; P2.132 + M; P2.133 + M; P2.134 + M; P2.135 + M; P2.136 + M; P2.137 + M; P2.138 + M; P2.139 + M; P2.140 + M; P2.141 + M; P2.142 + M; P2.143 + M; P2.144 + M; P2.145 + M; P2.146 + M; P2.147 + M; P2.148 + M; P2.149 + M; P2.150 + M; P2.151 + M; P2.152 + M; P2.153 + M; P2.154 + M; P2.155 + M; P2.156 + M; P2.157 + M; P2.158 + M; P2.159 + M; P2.160 + M; P2.161 + M; P2.162 + M; P2.163 + M; P2.164 + M and P2.165 + M.

The compositions can also comprise further solid or liquid auxiliaries, such as stabilizers, for example unepoxidized or epoxidized vegetable oils (for example epoxidized coconut oil,

rapeseed oil or soya oil), antifoams, for example silicone oil, preservatives, viscosity regulators, binders and/or tackifiers, fertilizers or other active ingredients for achieving specific effects, for example bactericides, fungicides, nematocides, plant activators, molluscicides or herbicides.

The compositions according to the invention are prepared in a manner known per se, in the absence of auxiliaries for example by grinding, screening and/or compressing a solid active ingredient and in the presence of at least one auxiliary for example by intimately mixing and/or grinding the active ingredient with the auxiliary (auxiliaries). These processes for the preparation of the compositions and the use of the compounds of formula I for the preparation of these compositions are also a subject of the invention.

The application methods for the compositions, that is the methods of controlling pests of the abovementioned type, such as spraying, atomizing, dusting, brushing on, dressing, scattering or pouring - which are to be selected to suit the intended aims of the prevailing circumstances - and the use of the compositions for controlling pests of the abovementioned type are other subjects of the invention. Typical rates of concentration are between 0.1 and 1000 ppm, preferably between 0.1 and 500 ppm, of active ingredient. The rate of application per hectare is generally 1 to 2000 g of active ingredient per hectare, in particular 10 to 1000 g/ha, preferably 10 to 600 g/ha.

A preferred method of application in the field of crop protection is application to the foliage of the plants (foliar application), it being possible to select frequency and rate of application to match the danger of infestation with the pest in question. Alternatively, the active ingredient can reach the plants via the root system (systemic action), by drenching the locus of the plants with a liquid composition or by incorporating the active ingredient in solid form into the locus of the plants, for example into the soil, for example in the form of granules (soil application). In the case of paddy rice crops, such granules can be metered into the flooded paddy-field.

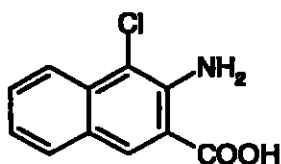
The compositions according to the invention are also suitable for the protection of plant propagation material, for example seeds, such as fruit, tubers or kernels, or nursery plants, against pests of the abovementioned type. The propagation material can be treated with the compositions prior to planting, for example seed can be treated prior to sowing. Alternatively,

the compositions can be applied to seed kernels (coating), either by soaking the kernels in a liquid composition or by applying a layer of a solid composition. It is also possible to apply the compositions when the propagation material is planted to the site of application, for example into the seed furrow during drilling. These treatment methods for plant propagation material and the plant propagation material thus treated are further subjects of the invention.

The examples which follow are intended to illustrate the invention. They do not limit the invention. Temperatures are given in degrees Celsius. The abbreviation "M. P." means "melting point".

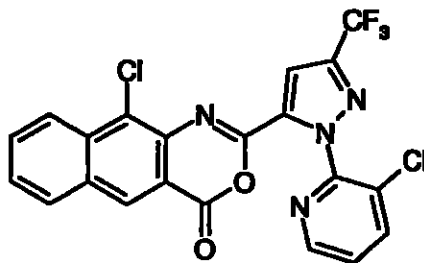
Preparation Examples

Example P1



1.9 g (14.7 mmol) of N-chlorosuccinimide and 10 mg of 2,2'-azoisobutyric nitrile are added to a suspension of 2.5 g (13.3 mmol) of 2-amino-3-carboxy-naphthalene in 100 ml of tetrachloromethane. The reaction mixture is stirred for 18 hours at room temperature, treated with 250 ml of aqueous sodium chloride solution and extracted with ethyl acetate (3 x 250 ml). The combined organic layers are dried over magnesium sulfate and filtered, and the filtrate is concentrated in vacuo. This gives the title compound in the form of a brown solid [¹H-NMR (CDCl₃): 8.53 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.25 (t, 1H)].

Example P2

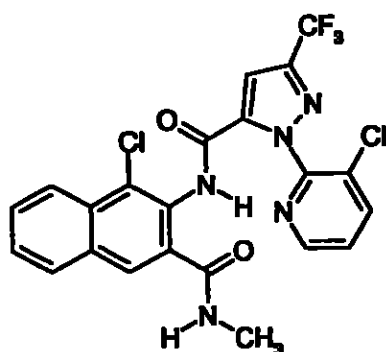


In a nitrogen atmosphere 0.5 ml (5.75 mmol) of oxalyl chloride are added dropwise at room temperature with stirring to a suspension of 295 mg (1.0 mmol) of 5-carboxy-1-(3-chloropyrid-2-yl)-3-trifluoromethyl-pyrazole in 2 ml of dichloromethane. The reaction mixture

67
67

is stirred for 1 hour and then added dropwise to a solution of 0.25 g (1 mmol) of the title compound of Example P1 in a mixture of 20 ml of dichloromethane and 0.38 ml of triethylamine. The reaction mixture is subsequently stirred for 3 hours. Further 0.7 ml of triethylamine are added, followed by the addition of a single portion of 0.22 ml (2.8 mmol) of methane sulfonic acid chloride. The reaction mixture is then stirred for 18 hours and concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography [silica gel; hexane/ethyl acetate (3:1)], which gives the title compound [$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8.78 (s, 1H), 8.61 (m, 1H), 8.30 (m, 2H), 8.03 (dd, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.56 (m, 2H); MS (electrospray): 477, 479, 481 ((M+H) $^+$)].

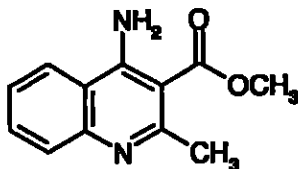
Example P3



(T1.1)

In a nitrogen atmosphere 1 ml of a solution (2.0 M) of methylamine in anhydrous tetrahydrofuran is added with stirring to a solution of 0.07 g (0.15 mmol) of the title compound of Example P2 in 5 ml of anhydrous tetrahydrofuran. The reaction mixture is heated to 50° for 1 hour, allowed to cool to room temperature and concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography [silica gel; hexane, followed by hexane/ethyl acetate (3:1)], which gives the title compound T1.1 [$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$): 10.80 (s, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.45 (br s, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.08 (m, 2H), 7.87 (s, 1H), 7.78 (t, 1H), 7.70 (t, 1H), 7.64 (dd, 1H), 2.70 (d, 3H); MS (electrospray): 508, 510, 512 ((M+H) $^+$)].

Example P4

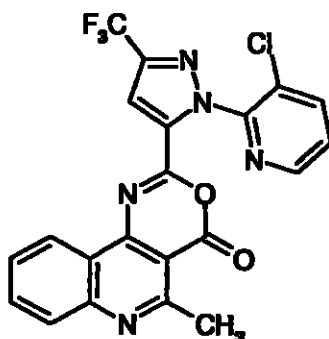


0.91 ml (8.46 mmol) of methyl acetoacetate and 1.98 ml (16.9 mmol) of tin tetrachloride are added to a solution of 1 g (8.46 mmol) of 1-amino-2-cyano-benzene in 20 ml of toluene. The

68
69

reaction mixture is heated to reflux for 2 hours, allowed to cool to room temperature and concentrated in vacuo. The residue is suspended in 250 ml of aqueous sodium carbonate solution, and the suspension is stirred for 30 minutes, allowed to stand overnight and then extracted with ethyl acetate (3 x 250 ml). The combined organic layers are dried over magnesium sulfate and filtered, the filtrate is concentrated in vacuo, and the yellow solid residue is triturated with diethyl ether. This gives the title compound in the form of a yellow powder [¹H-NMR (CDCl₃): 7.88 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.06 (br s, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.82 (s, 3H); MS (electrospray): 217 ((M+H)⁺)].

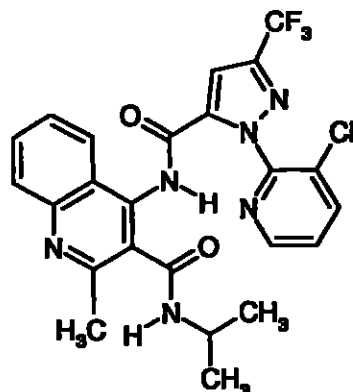
Example P5



In a nitrogen atmosphere 4 drops of N,N-dimethylformamide and then 0.08 ml (0.93 mmol) of oxalyl chloride are added dropwise at room temperature with stirring to a suspension of 250 mg (0.86 mmol) of 5-carboxy-1-(3-chloropyrid-2-yl)-3-trifluoromethyl-pyrazole in 10 ml of dichloromethane. The reaction mixture is stirred for 1 hour, the solvent is removed in vacuo, and the residue is co-evaporated three times with toluene and then suspended in 3 ml of toluene to give the suspension "A". 105 mg (0.858 mmol) of 4-dimethylaminopyridine are added to a suspension of 185 mg (0.858 mmol) of the title compound of Example P4 in 3 ml of toluene to give the suspension "B". The suspension "A" is added to the suspension "B", for a complete transfer of the suspension "A" into the reaction flask the vessel containing the suspension "A" being rinsed out with a small amount of a mixture of toluene and a few drops of N,N-dimethylformamide. The reaction mixture is heated to reflux for 3 hours and then allowed to cool to room temperature. The yellow precipitate is filtered off and washed with diethyl ether. The filtrate is washed with 10 ml of water, and the water is back-extracted with ethyl acetate (2 x 50 ml). The combined organic layers are dried over magnesium sulfate and filtered, the filtrate is concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography [silica gel; hexane/ethyl acetate (1:2)], which gives the title compound [¹H-

NMR (CDCl₃): 8.66 (d, 1H), 8.09 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.86 (t, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.40 (dd, 1H), 3.09 (s, 3H); MS (electrospray): 458 ((M+H)⁺).

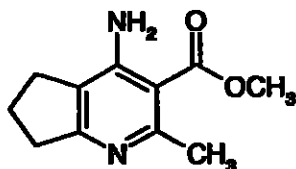
Example P6



(T38.3)

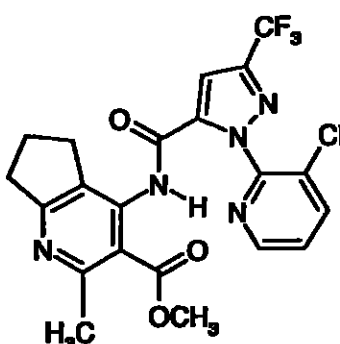
0.022 ml (0.262 mmol) of isopropylamine are added with stirring to a suspension of 40 mg (0.087 mmol) of the title compound of Example P5 in 1 ml of anhydrous tetrahydrofuran. The reaction mixture is heated to 60° for 90 minutes, allowed to cool to room temperature and concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography [silica gel; methanol/dichloromethane (1:9)], which gives the title compound T38.3 [¹H-NMR (CDCl₃): 11.17 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.71 (t, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.36 (m, 1H), 6.31 (d, 1H), 4.23 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.16 (d, 6H); MS (electrospray): 517 ((M+H)⁺).

Example P7



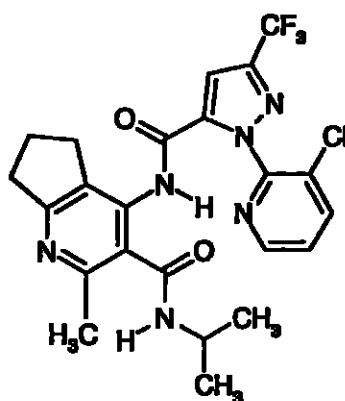
Starting from 1-amino-2-cyano-cyclopent-1-ene, the title compound can be prepared in a manner analogous to the procedure described in Example P4 [¹H-NMR (CDCl₃): 5.77 (br s, 2H), 3.90 (s, 3H), 2.97 (m, 2H), 2.70 (m, 2H), 2.15 (m, 2H); MS (electrospray): 207 ((M+H)⁺).

Example P8



In a nitrogen atmosphere 4 drops of N,N-dimethylformamide and then 0.16 ml (1.86 mmol) of oxalyl chloride are added dropwise at room temperature with stirring to a suspension of 0.5 g (1.72 mmol) of 5-carboxy-1-(3-chloropyrid-2-yl)-3-trifluoromethyl-pyrazole in 20 ml of dichloromethane. The reaction mixture is stirred for 90 minutes, the solvent is removed in vacuo, and the residue is co-evaporated three times with toluene and then dissolved in 10 ml of tetrahydrofuran to give the solution "A". 0.24 ml (1.72 mmol) of triethylamine are added to a suspension of 195 mg (0.95 mmol) of the title compound of Example P7 in 10 ml of tetrahydrofuran to give the suspension "B". 5 ml of the solution "A" are added in portions over a period of 30 minutes to the suspension "B". The reaction mixture is stirred for 2.5 hours, treated with 10 ml of aqueous sodium hydrogen carbonate solution and extracted with ethyl acetate (2 x 40 ml). The combined organic layers are dried over magnesium sulfate and filtered, the filtrate is concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography (silica gel; ethyl acetate), which gives the title compound [$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 10.15 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.22 (s, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.99 (m, 2H), 2.75 (m, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.06 (m, 2H); MS (electrospray): 480 ((M+H) $^+$)].

Example P9



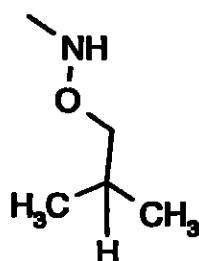
(T37.3)

0.04 ml (0.47 mmol) of isopropylamine are added at room temperature with stirring to a mixture of 0.24 ml of a solution (2.0 M) of trimethylaluminum in hexane and 3 ml of

dichloromethane. The reaction mixture is stirred for 40 minutes. A solution of 110 mg (0.22 mmol) of the title compound of Example P8 in 3 ml of dichloromethane is added, and the reaction mixture is heated to reflux for 6 hours, allowed to cool to room temperature and to stand overnight and then poured into 20 ml of water. The mixture is extracted with dichloromethane (2 x 30 ml). The combined organic layers are dried over magnesium sulfate and filtered, the filtrate is concentrated in vacuo, and the residue is purified by column chromatography [silica gel; ethyl acetate/hexane (2:1), followed by neat ethyl acetate], which gives the title compound T37.3 [$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 10.69 (s, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.42 (m, 1H), 5.89 (d, 1H), 4.24 (m, 1H), 2.87 (t, 2H), 2.57 (t, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.02 (m, 2H), 1.19 (d, 6H); MS (electrospray): 507 ((M+H) $^+$)].

Example P10

The compounds listed in the Table P1 and P2 can be prepared in a manner analogous to the procedures described in the Examples P1 to P9. Melting points are given in $^{\circ}\text{C}$. In the following structures, tertiary hydrogen atoms attached to carbon atoms are not drawn, e.g. the group



is drawn as follows:

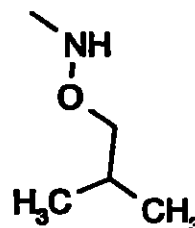
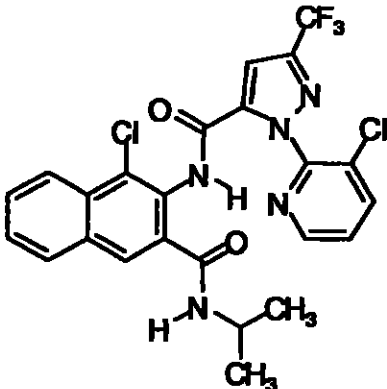
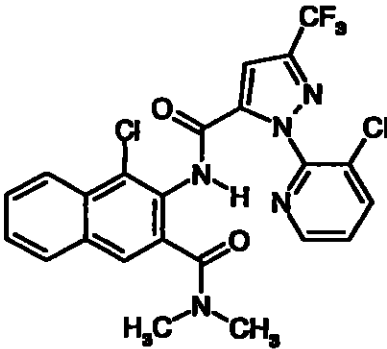
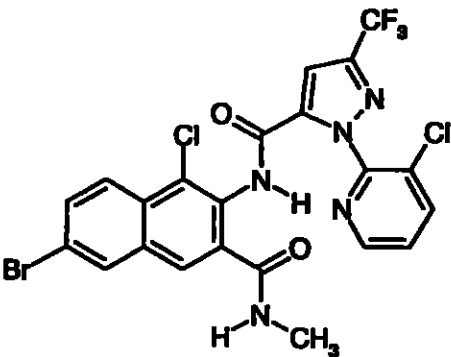
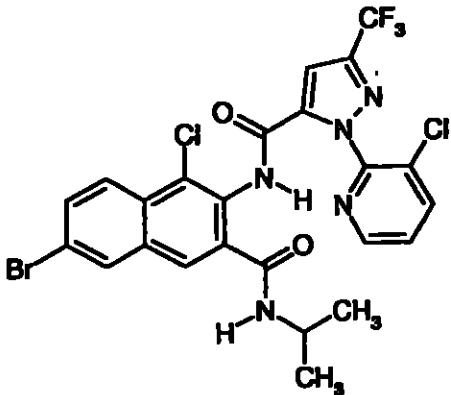
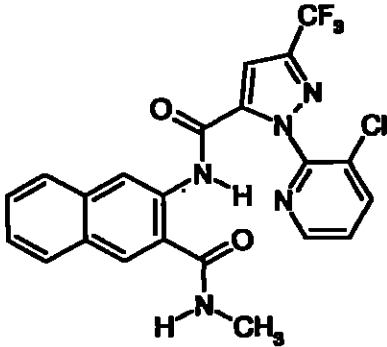
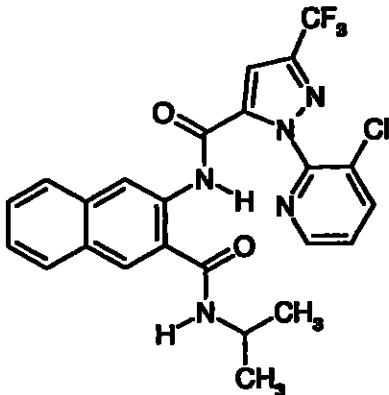


Table P1:

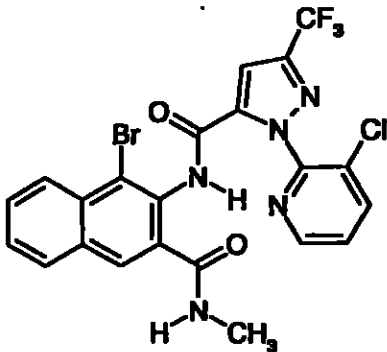
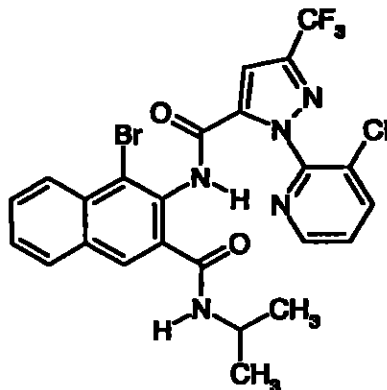
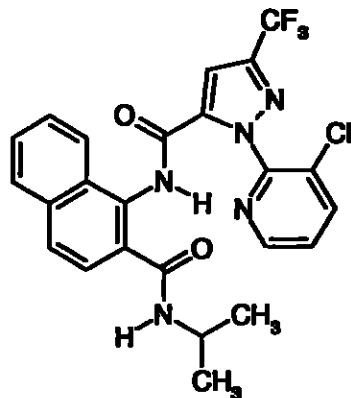
Compound	Structure	MS	$^1\text{H-NMR}$	M. P.
----------	-----------	----	------------------	-------

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T1.3		Electrospray: 536, 538, 540 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 8.43 (d, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.59 (t, 2H), 7.33 (m, 2H), 7.22 (m, 1H), 6.19 (d, 1H), 4.19 (m, 1H), 1.18 (d, 6H).	
T1.121		Electrospray: 522, 524, 526 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.95 (s, 1H), 8.43 (dd, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.35 (m, 3H), 7.16 (t, 1H), 2.77 (s, 3H), 2.71 (s, 3H).	
T2.1		Electrospray: 584, 586, 588, 590 ((M-H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.82 (s, 1H), 8.52 (dd, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.89 (m, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.64 (dd, 1H), 2.69 (d, 3H).	

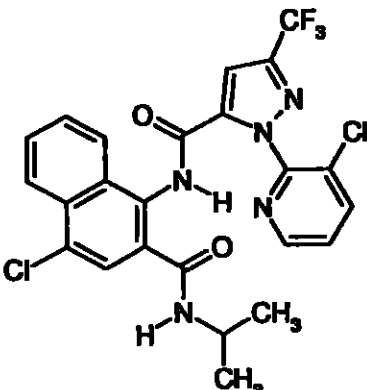
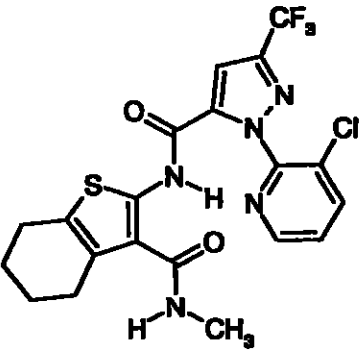
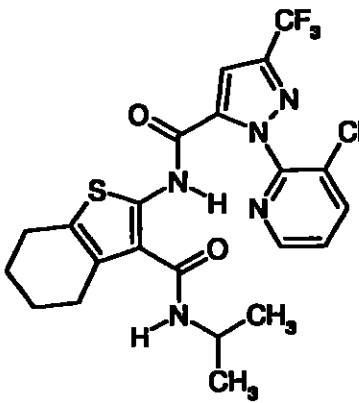
73
73

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T2.3		Electrospray: 614, 616, 618 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.80 (s, 1H), 8.50 (dd, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.32 (d, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.88 (m, 1H), 7.63 (dd, 1H), 3.92 (m, 1H), 1.06 (d, 6H).	
T6.1		Electrospray: 474, 476 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 12.75 (s, 1H), 9.13 (d, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.55 (m, 3H), 2.89 (d, 3H).	
T6.3		Electrospray: 502, 504 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 12.55 (s, 1H), 8.90 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.55 (m, 3H), 4.21 (m, 1H), 1.23 (d, 6H).	

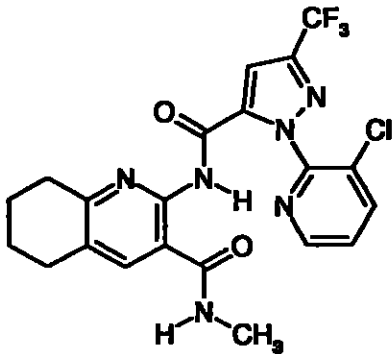
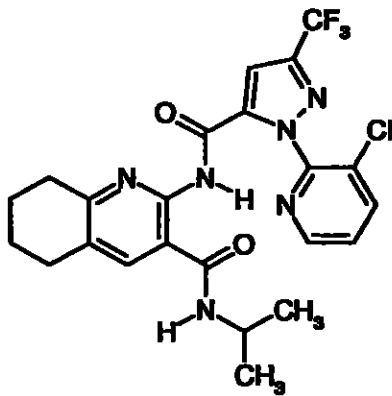
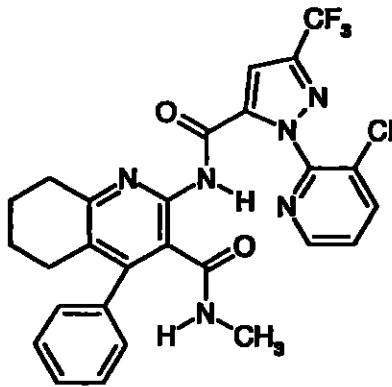
74
74

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T7.1		Electrospray: 552, 554, 556 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 10.80 (s, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.20 (m, 2H), 8.11 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.64 (m, 2H), 2.70 (d, 3H).	
T7.3		Electrospray: 580, 582, 584 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.65 (s, 1H), 8.43 (d, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.20 (m, 1H), 1.17 (d, 6H).	
T21.3		Electrospray: 502, 504 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.97 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.84 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.11 (d, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.23 (m, 1H), 1.19 (d, 6H).	

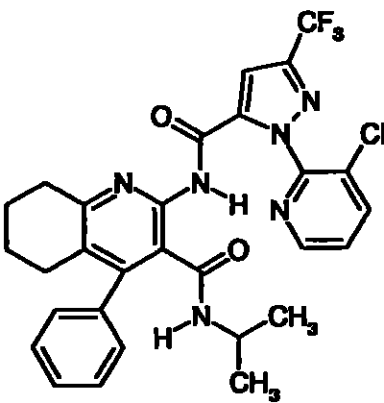
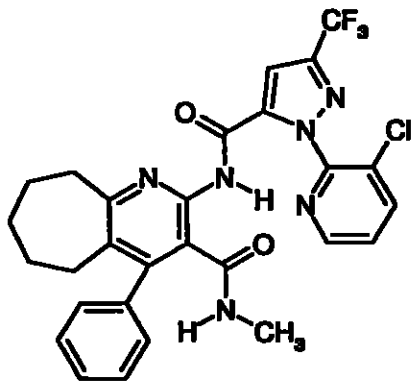
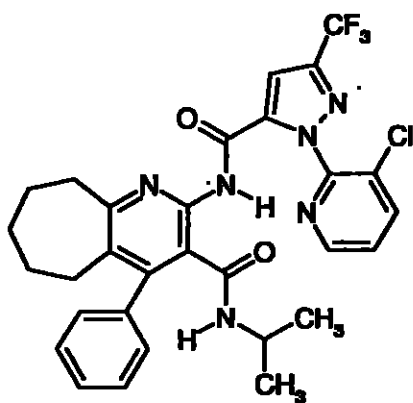
75
75

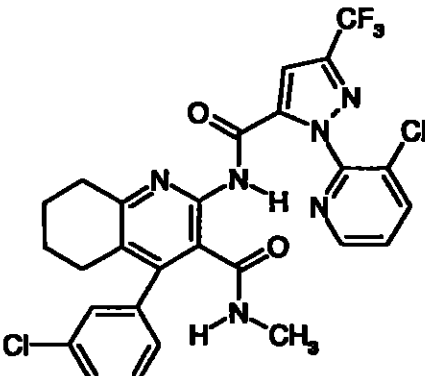
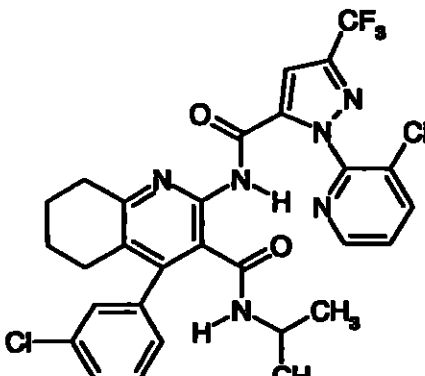
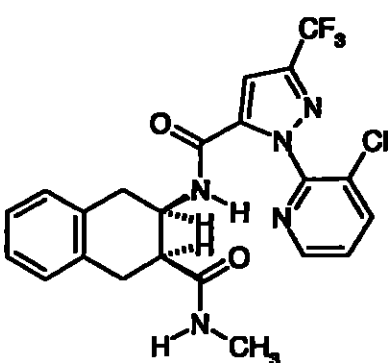
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T22.3		Electrospray: 536, 538 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.00 (s, 1H), 8.43 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.81 (m, 2H), 7.58 (m, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.20 (m, 1H), 1.20 (d, 6H).	
T46.1				261 - 263
T46.3				246 - 248

7/5
7/6

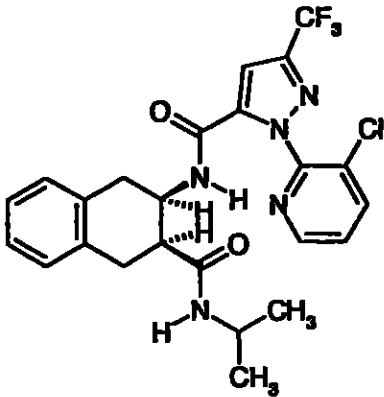
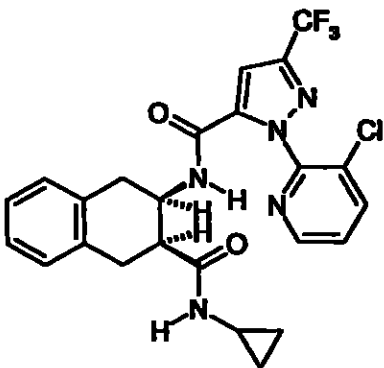
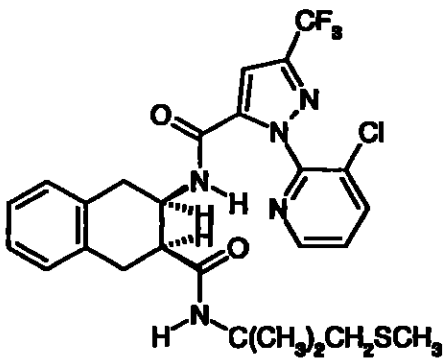
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T50.1				145 – 147
T50.3				143 – 145
T51.1				165 – 168

7.1
XX

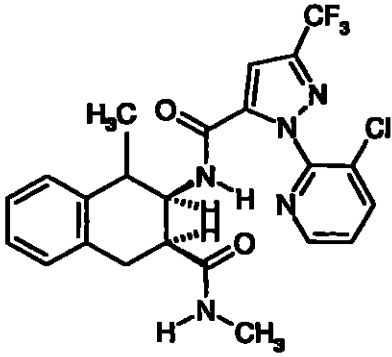
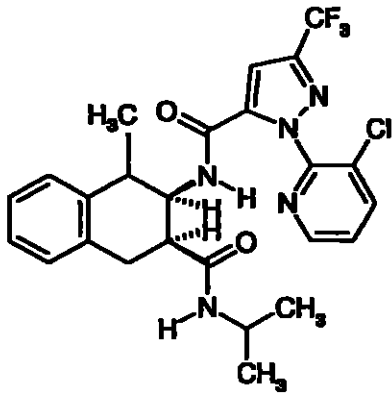
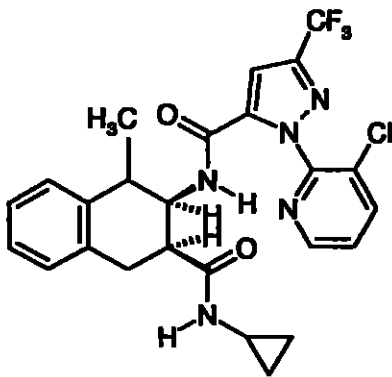
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T51.3				146 – 148
T52.1				211 – 213
T52.3				269 – 270

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T53.1				183 - 185
T53.3				259 - 260
T72.1				226 - 228

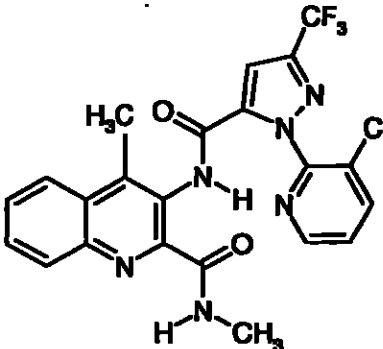
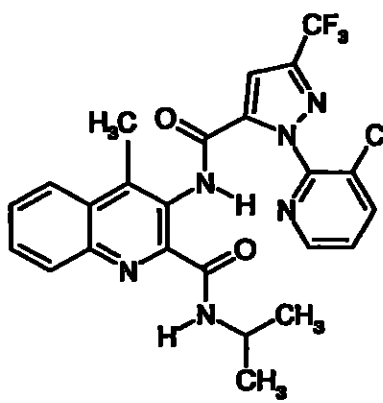
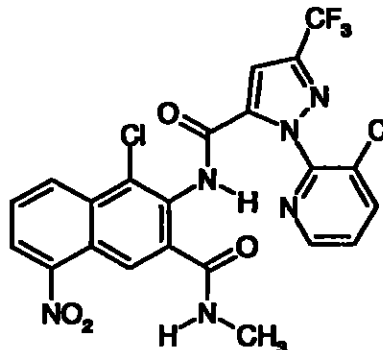
79/29

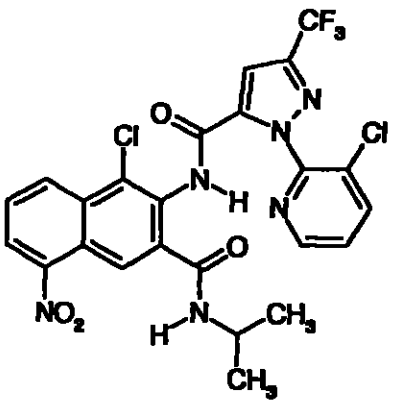
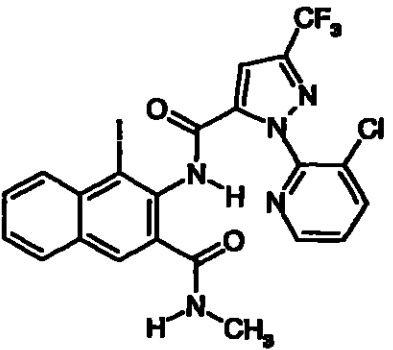
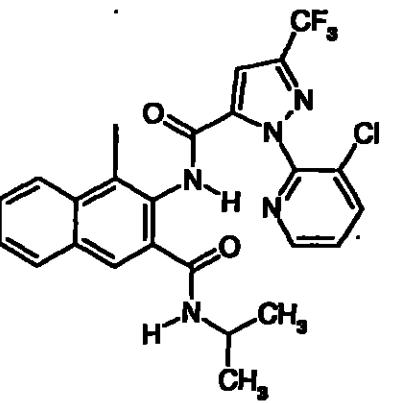
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T72.3				229 – 232
T72.207				230 – 233
T72.273				184 – 186

8p
00

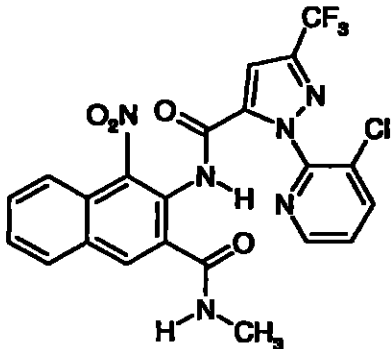
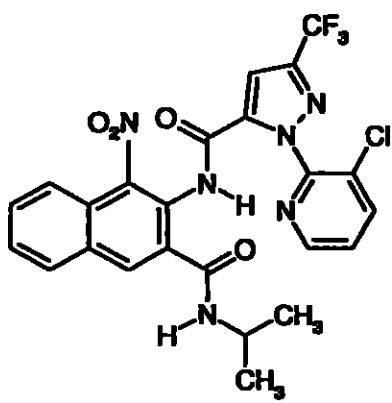
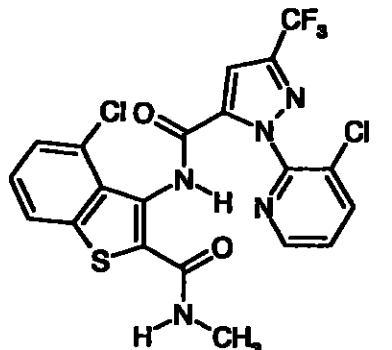
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T73.1				205 - 207
T73.3				223 - 225
T73.207				192 - 194

82
82

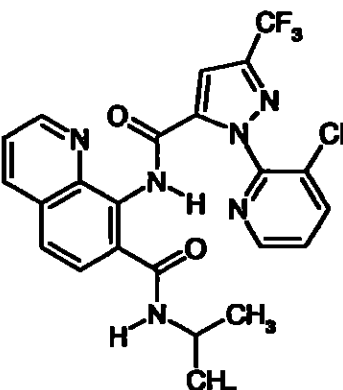
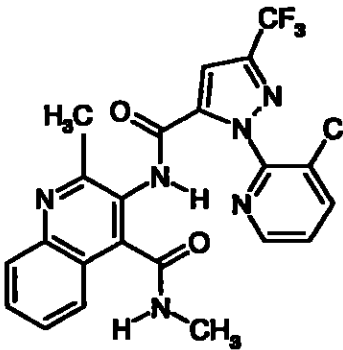
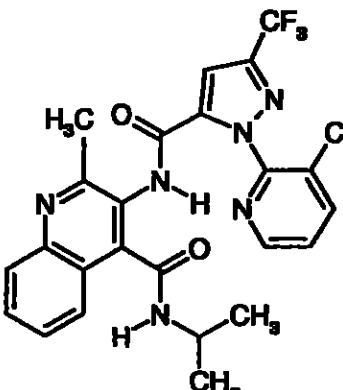
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T75.1		Electrospray: 489 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.97 (s, 1H), 8.50 (br s, 1H), 8.49 (dd, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.41 (m, 1H), 3.09 (d, 3H), 2.52 (s, 3H).	
T75.3		Electrospray: 517 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 12.06 (s, 1H), 8.49 (dd, 1H), 8.33 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.41 (m, 1H), 4.30 (m, 1H), 2.52 (s, 3H), 1.35 (d, 6H).	
T76.1			CDCl ₃ : 8.47 (d, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.13 (d, 1H), 8.08 (m, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.48 (m, 1H), 2.93 (d, 3H).	

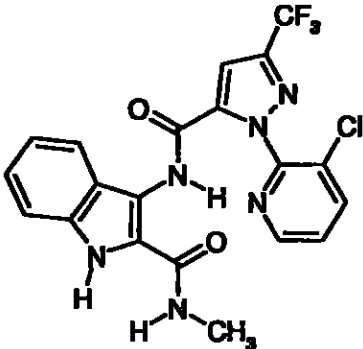
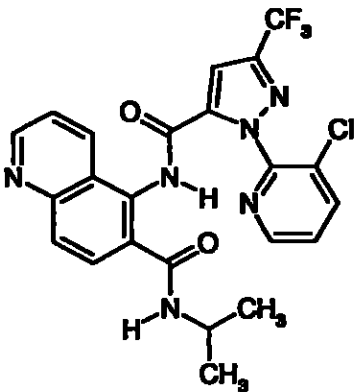
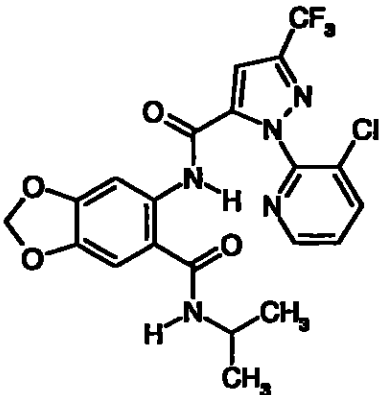
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T76.3		Electrospray: 581 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.95 (s, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.47 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 1.11 (d, 6H).	
T77.1		Electrospray: 600 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.29 (s, 1H), 8.47 (dd, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 6.26 (m, 1H), 2.96 (d, 3H).	
T77.3		Electrospray: 628 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.61 (s, 1H), 8.45 (dd, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.36 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 6.10 (d, 1H), 4.20 (m, 1H), 1.16 (d, 6H).	

84
84

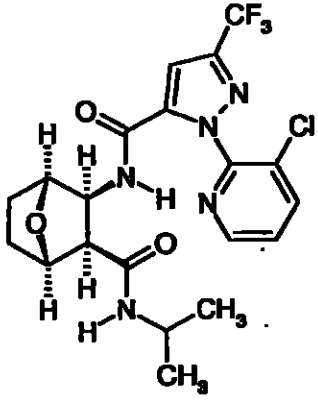
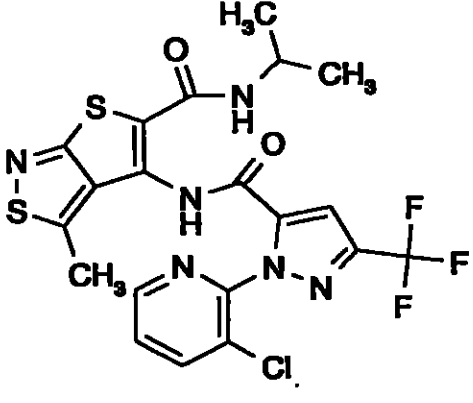
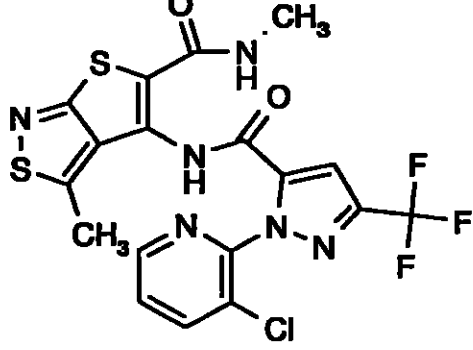
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T78.1		Electrospray: 519 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.82 (br s, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 6.58 (br s, 1H), 2.98 (d, 3H).	
T78.3		Electrospray: 547 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.02 (br s, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.40 (m, 1H), 6.20 (br s, 1H), 4.27 (m, 1H), 1.27 (d, 6H).	
T79.1		Electrospray: 514 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 9.15 (s, 1H), 8.53 (dd, 1H), 8.22 (dd, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.47 (m, 2H), 2.77 (s, 3H).	

85
85

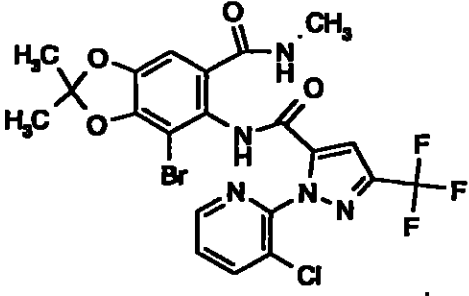
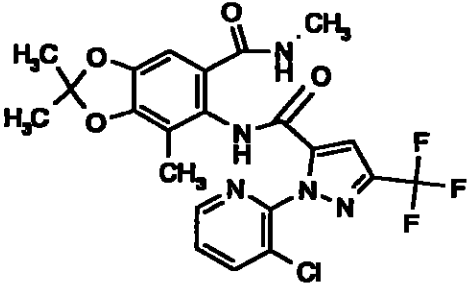
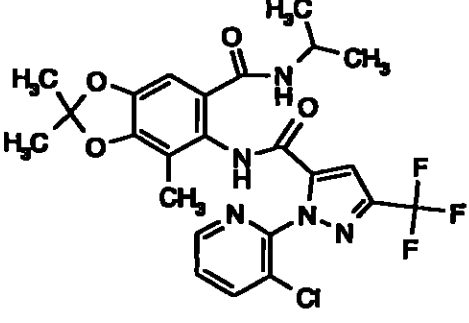
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T80.3		Electrospray: 503, 505 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.10 (s, 1H), 8.87 (d, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.58 (m, 2H), 7.49 (m, 2H), 7.38 (m, 1H), 6.01 (d, 1H), 4.17 (m, 1H), 1.14 (d, 6H).	
T81.1		Electrospray: 489 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.20 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.76 (t, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.41 (m, 1H), 6.45 (m, 1H), 3.04 (d, 3H), 1.94 (s, 3H).	
T81.3		Electrospray: 517 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10.49 (s, 1H), 8.44 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.39 (m, 1H), 6.29 (d, 1H), 4.28 (m, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.18 (d, 6H).	

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T82.1		Electrospray: 463 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 11.58 (s, 1H), 10.65 (s, 1H), 8.57 (dd, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.84 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.03 (t, 1H), 2.82 (s, 3H).	
T83.3		Electrospray: 503, 505 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11.22 (s, 1H), 8.90 (m, 1H), 8.44 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.40 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.25 (m, 1H), 1.22 (d, 6H).	
T84.3		Electrospray: 496, 498 ((M+H) ⁺).	DMSO-d ₆ : 13.48 (s, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.02 (m, 2H), 7.56 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.00 (s, 2H), 4.28 (m, 1H), 1.26 (d, 6H).	

87
87

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T85.3				220 – 224
T88.3				261- 263
T88.1				264- 266

88
98

Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T89.1				274- 276
T90.1				242- 244
T90.3				256- 258

89
89

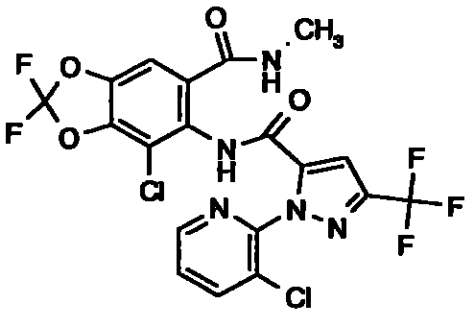
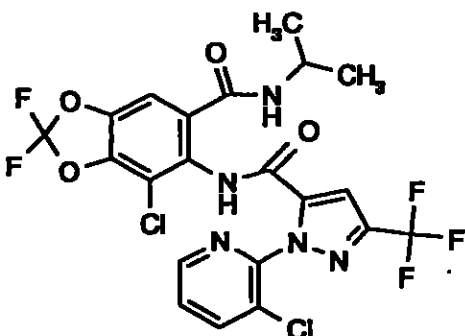
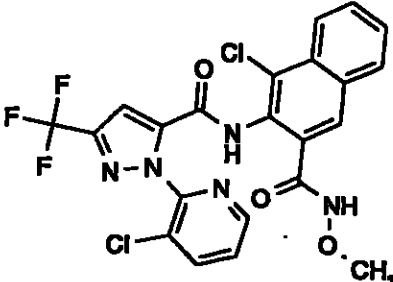
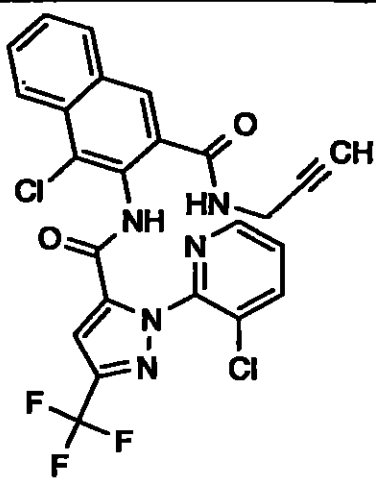
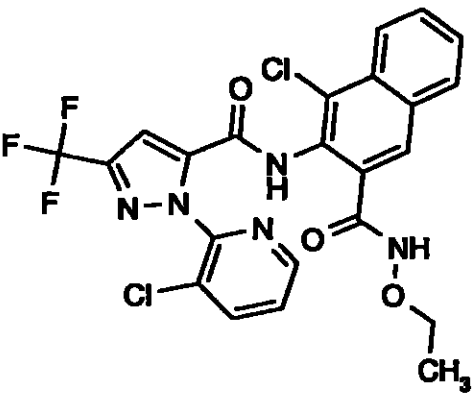
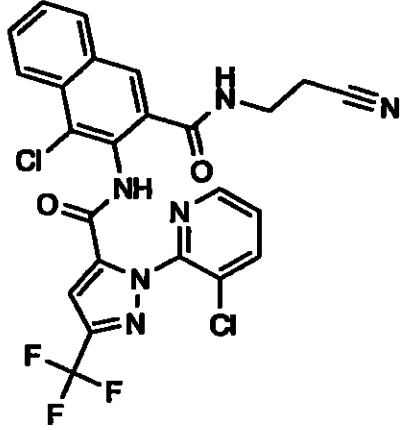
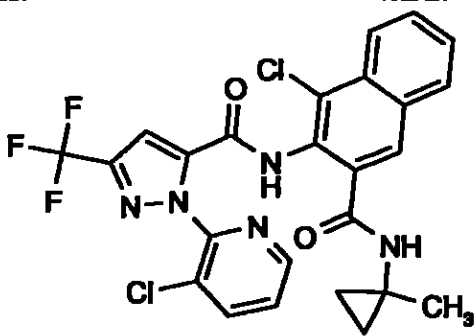
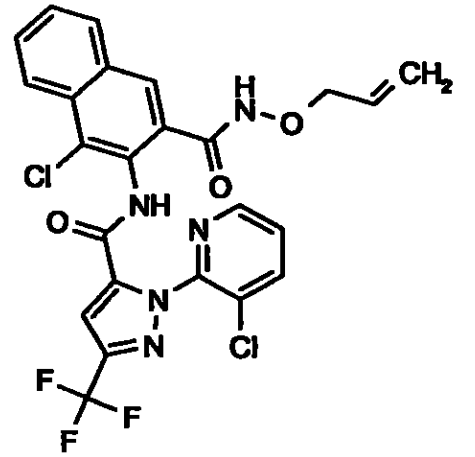
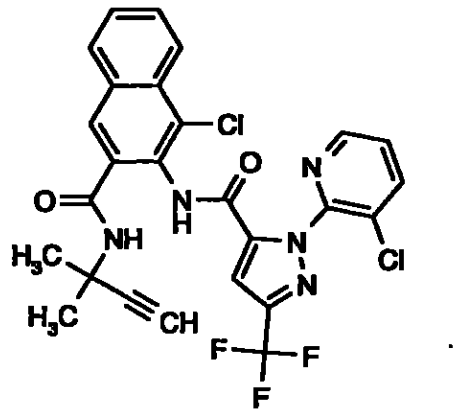
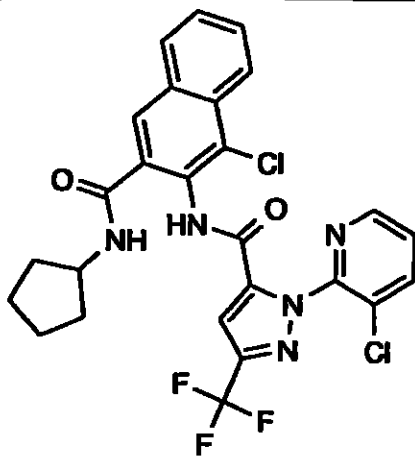
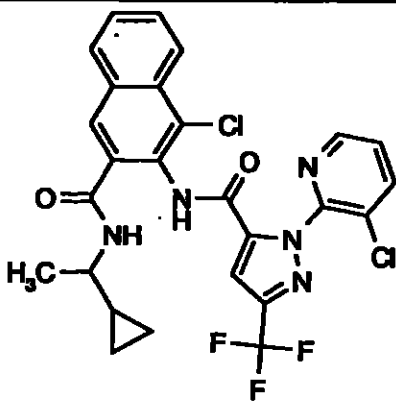
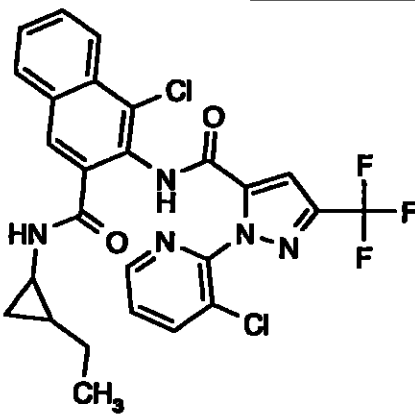
Compound	Structure	MS	¹ H-NMR	M. P.
T91.1				265- 267
T91.3				251- 253

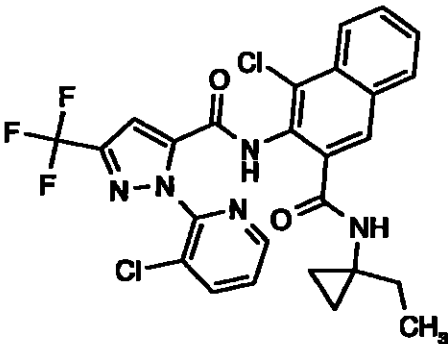
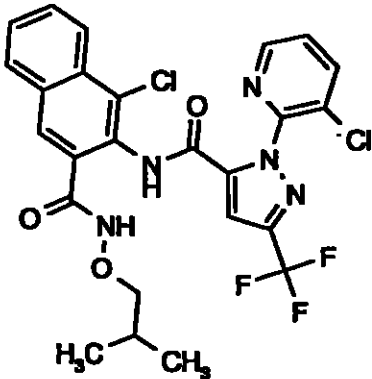
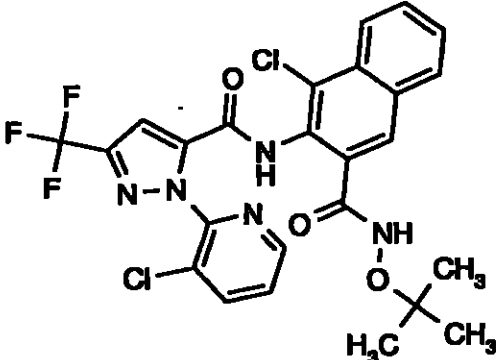
Table P2:

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.001		524 (M+H)+)

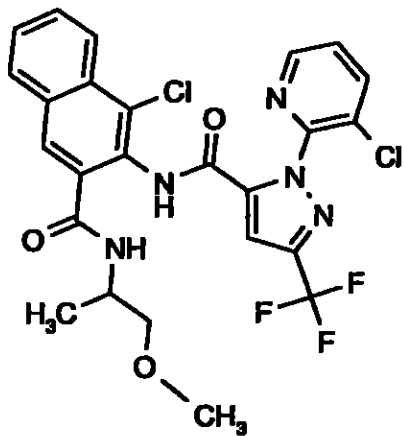
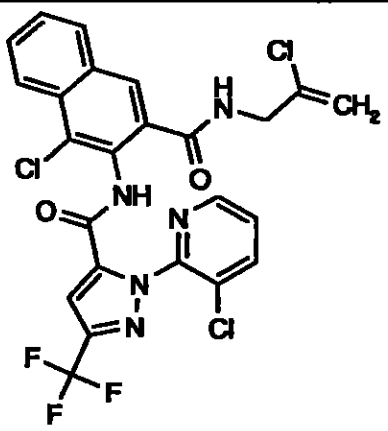
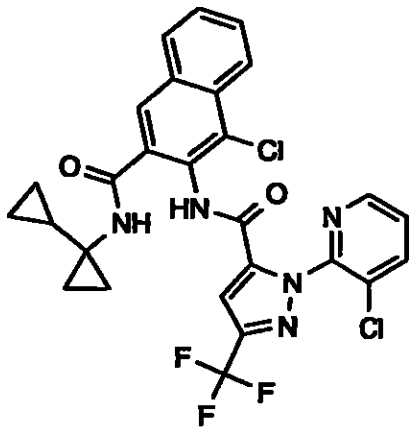
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.002		532 ((M+H)+)
P2.003		538 ((M+H)+)
P2.004		547 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.005		548 ((M+H)+)
P2.006		550 ((M+H)+)
P2.007		560 ((M+H)+)

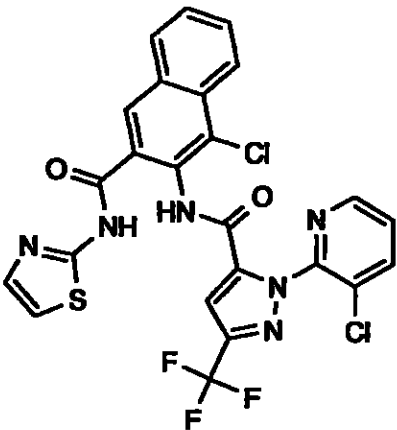
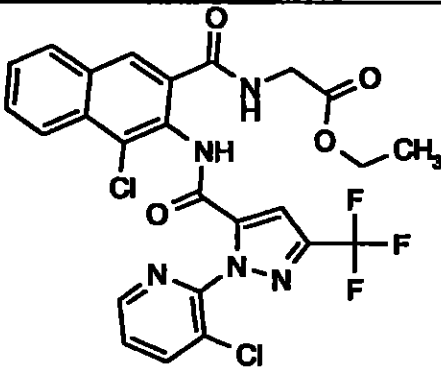
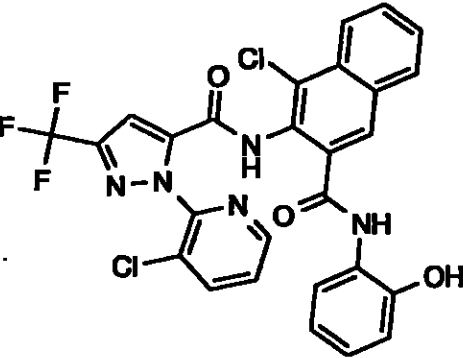
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.008		562 ((M+H)+)
P2.009		562 ((M+H)+)
P2.010		562 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.011		562 ((M+H)+)
P2.012		566 ((M+H)+)
P2.013		566 ((M+H)+)

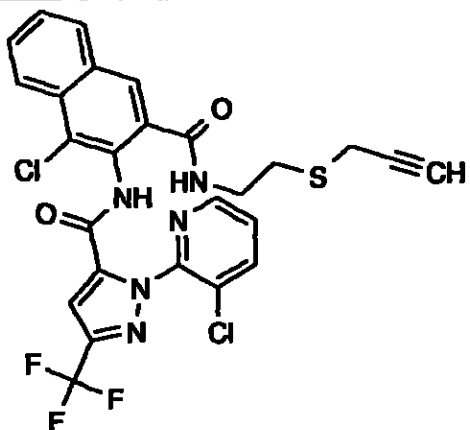
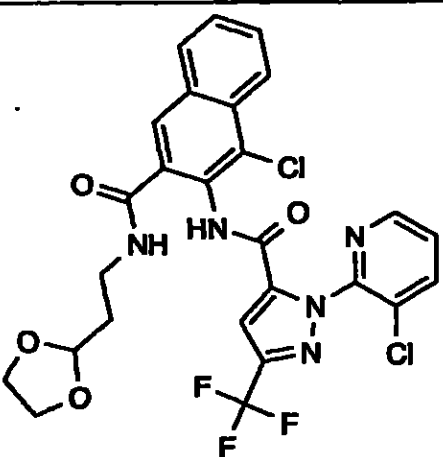
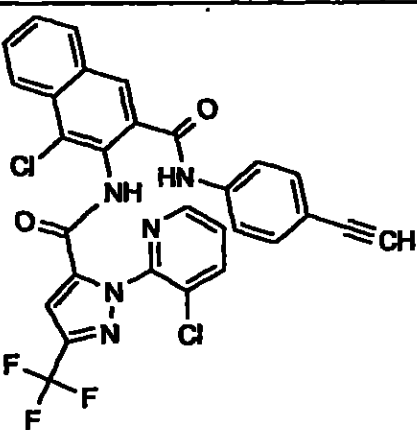
9A
94

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.014		566 ((M+H)+)
P2.015		568 ((M+H)+)
P2.016		574 ((M+H)+)

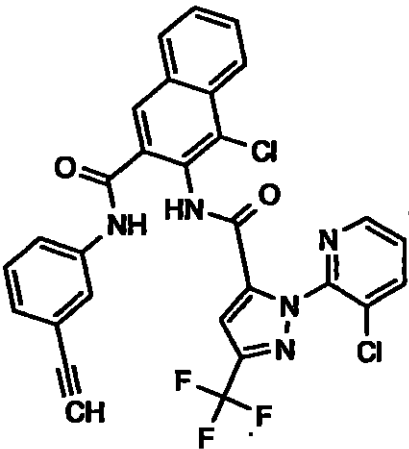
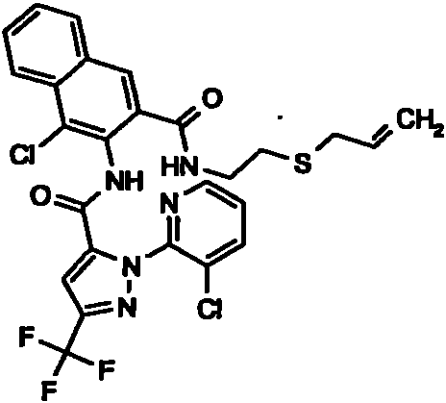
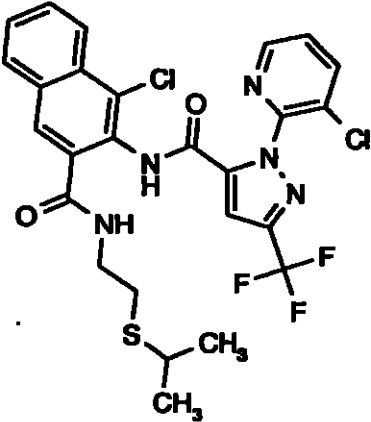
9/6
ab

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.020		577 ((M+H)+)
P2.021		580 ((M+H)+)
P2.022		586 ((M+H)+)

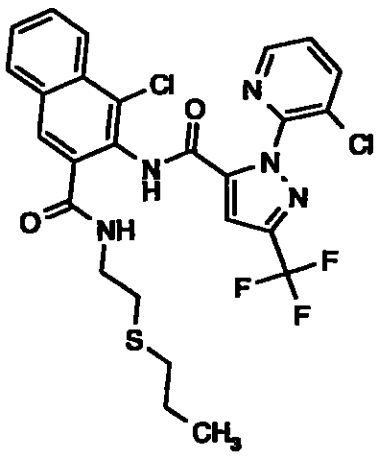
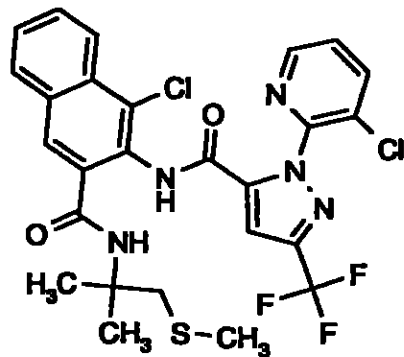
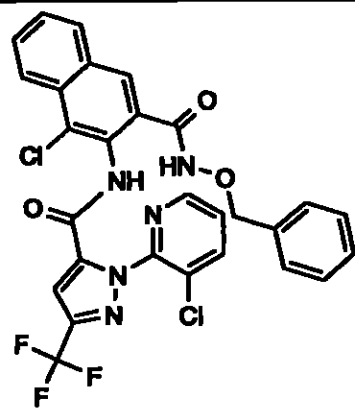
9A
dx

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.023		592 ((M+H)+)
P2.024		594 ((M+H)+)
P2.025		594 ((M+H)+)

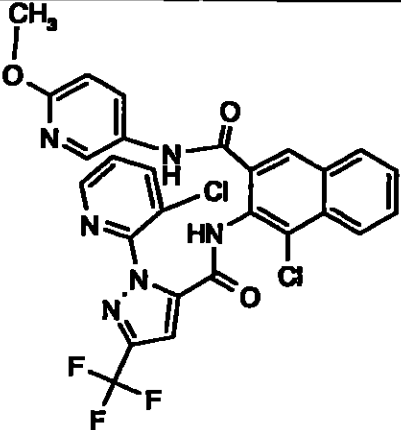
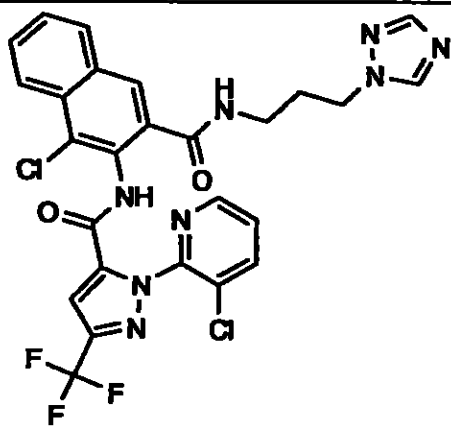
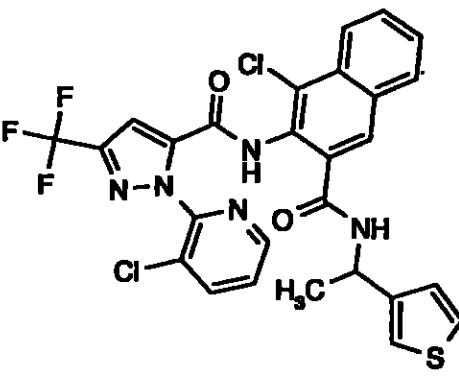
98
98

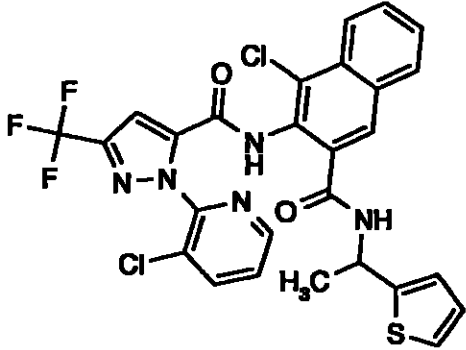
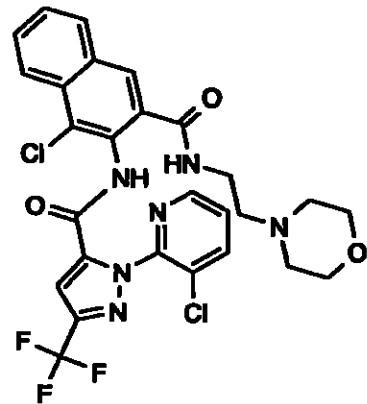
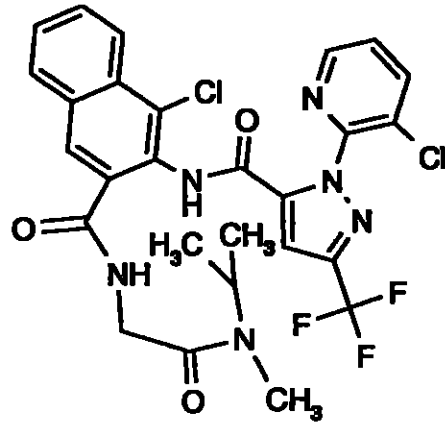
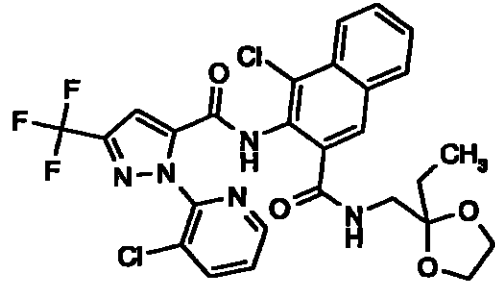
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.026		594 ((M+H)+)
P2.027		594 ((M+H)+)
P2.028		596 ((M+H)+)

99
69

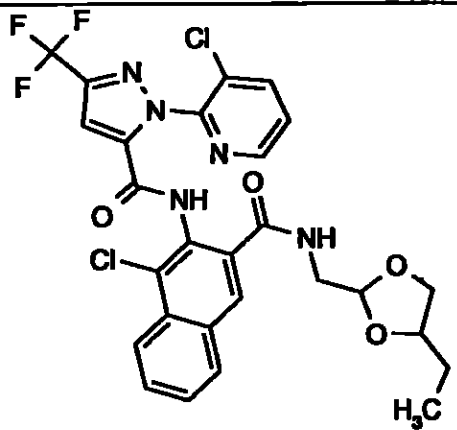
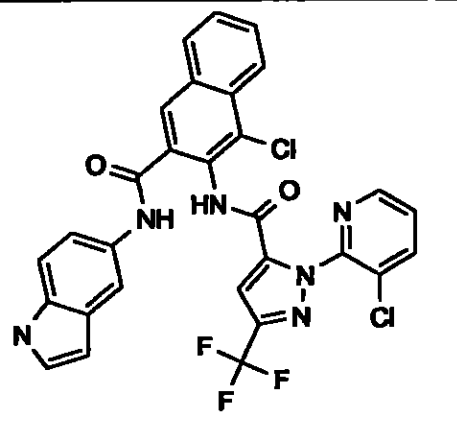
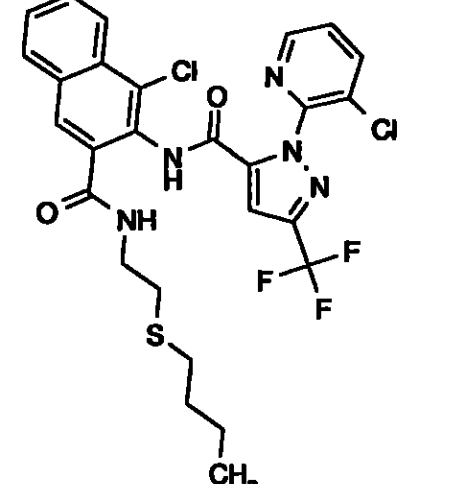
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.029		596 ((M+H)+)
P2.030 (T1.273)		596 ((M+H)+)
P2.031		600 ((M+H)+)

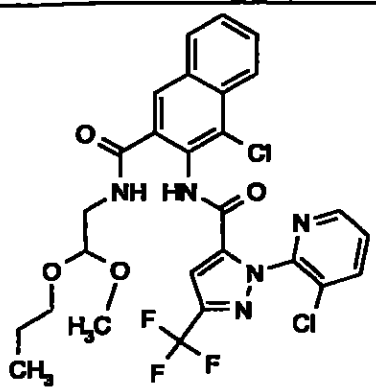
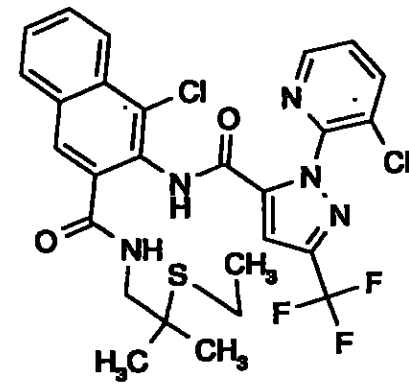
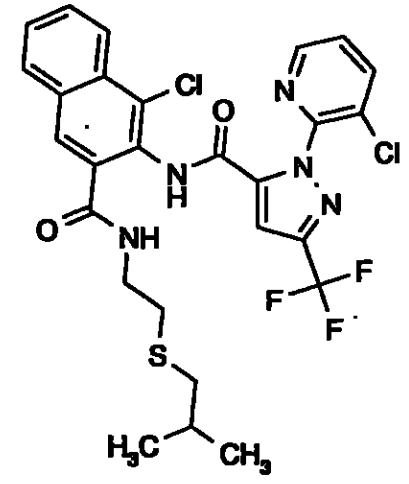
190
100

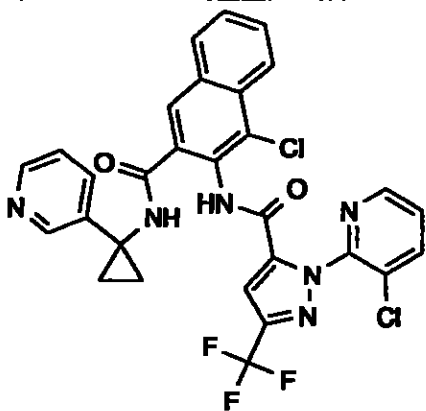
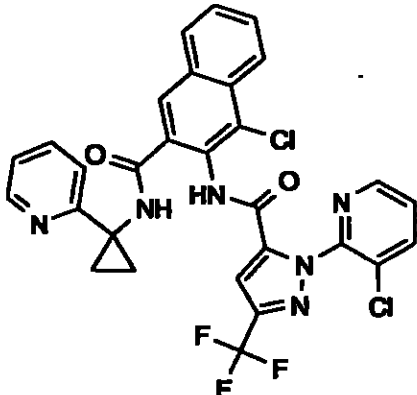
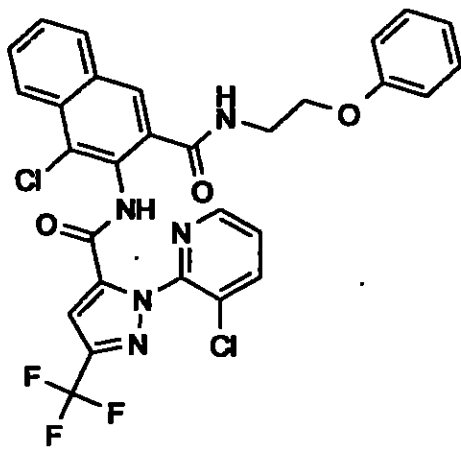
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.032		601 ((M+H)+)
P2.033		603 ((M+H)+)
P2.034		604 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.035		604 ((M+H)+)
P2.036		607 ((M+H)+)
P2.037		607 ((M+H)+)
P2.038		608 ((M+H)+)

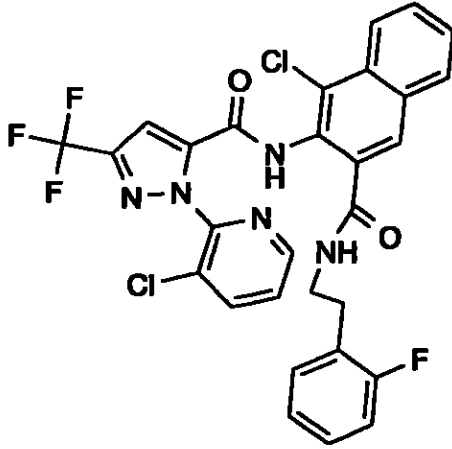
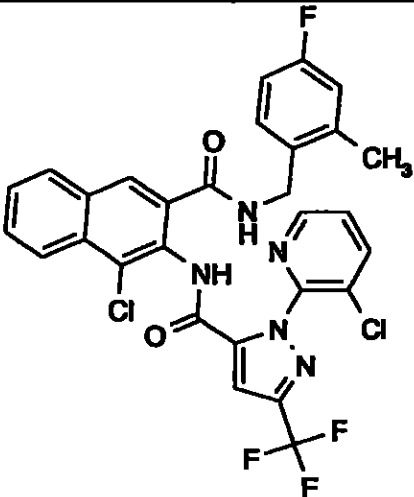
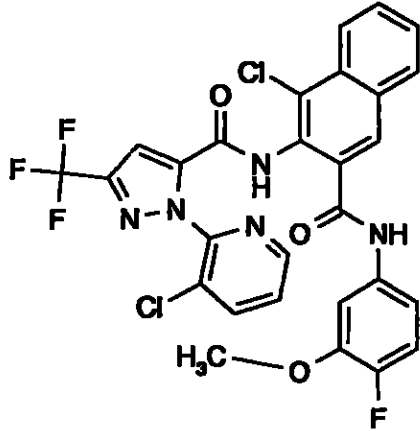
102
102

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.039		608 ((M+H)+)
P2.040		609 ((M+H)+)
P2.041		610 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P In °C)
P2.042		610 ((M+H)+)
P2.043		610 ((M+H)+)
P2.044		610 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.045		611 ((M+H)+)
P2.046		611 ((M+H)+)
P2.047		614 ((M+H)+)

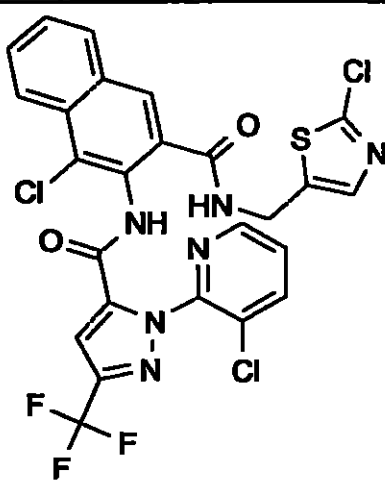
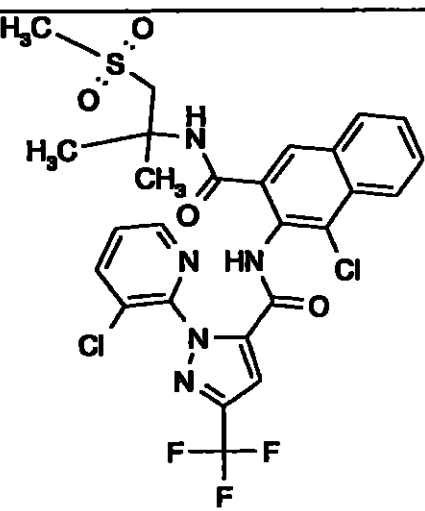
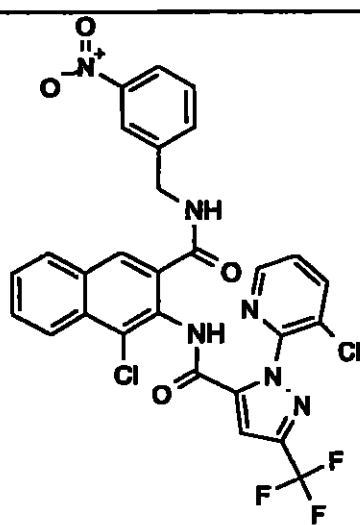
105
195

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.048		616 ((M+H)+)
P2.049		616 ((M+H)+)
P2.050		618 ((M+H)+)

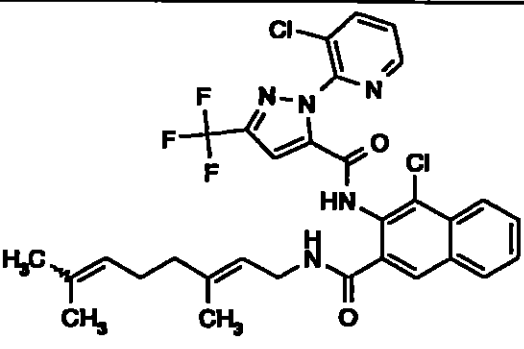
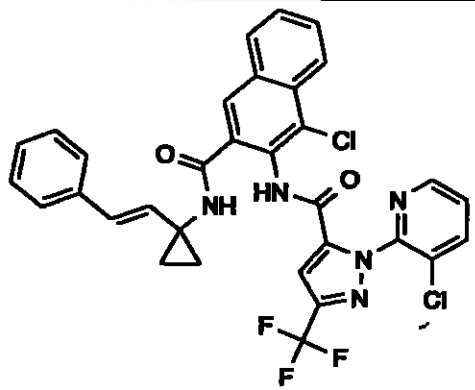
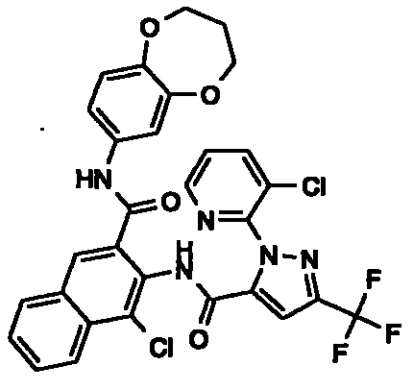
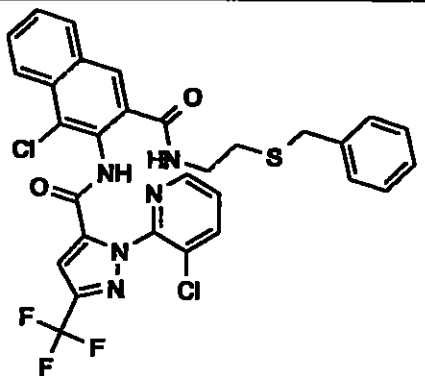
126
196

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.051		622 ((M+H)+)
P2.052		622 ((M+H)+)
P2.053		624 ((M+H)+)

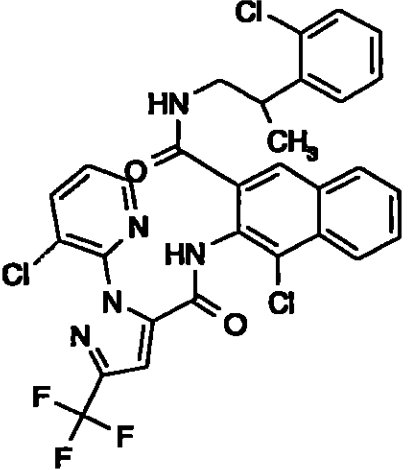
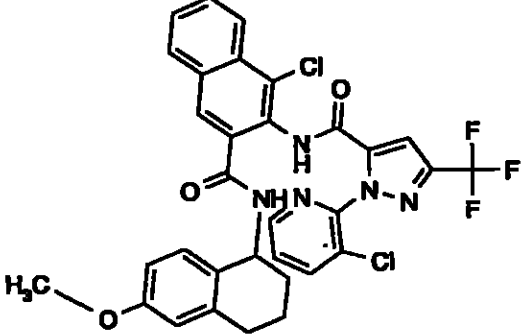
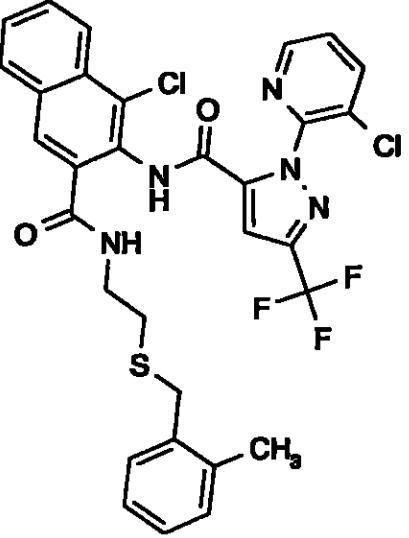
107
198

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.054		625 ((M+H)+)
P2.055		628 ((M+H)+)
P2.056		629 ((M+H)+)

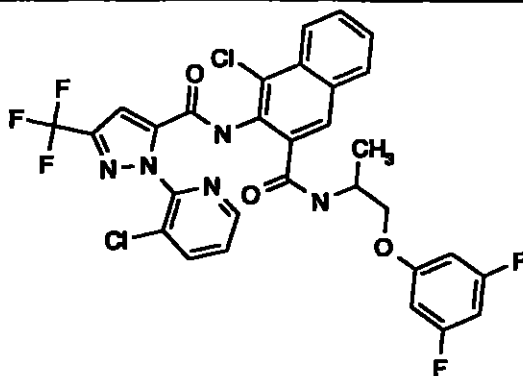
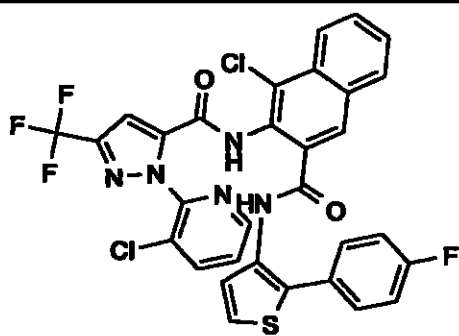
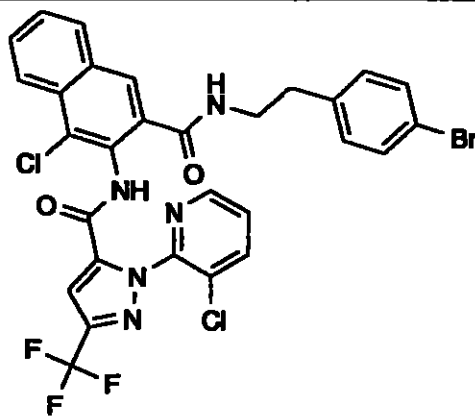
108
100

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.057		630 ((M+H)+)
P2.058		636 ((M+H)+)
P2.059		642 ((M+H)+)
P2.060		644 ((M+H)+)

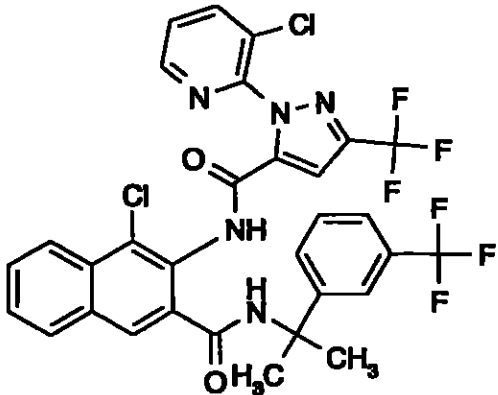
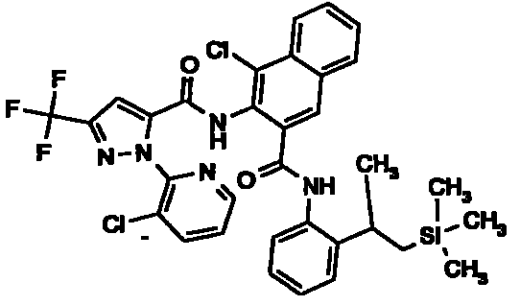
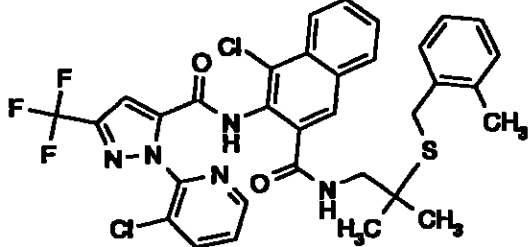
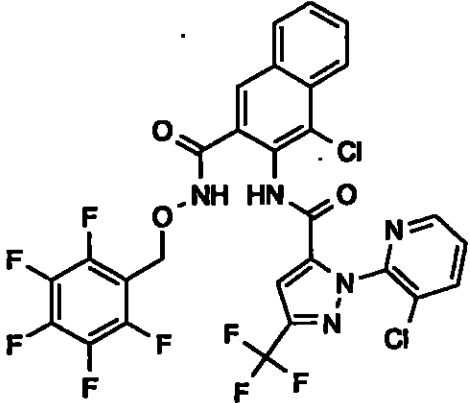
104
109

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.061		646 ((M+H)+)
P2.062		654 ((M+H)+)
P2.063		658 ((M+H)+)

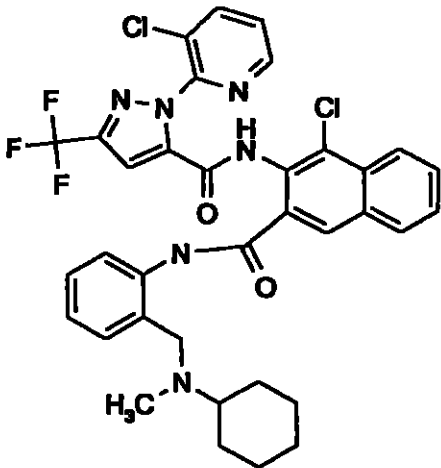
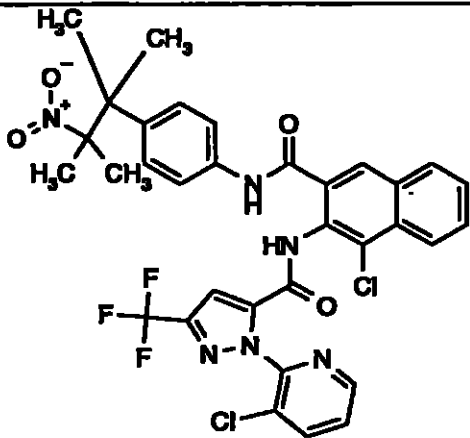
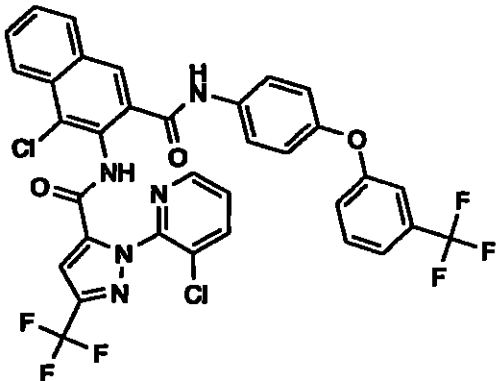
110.
112

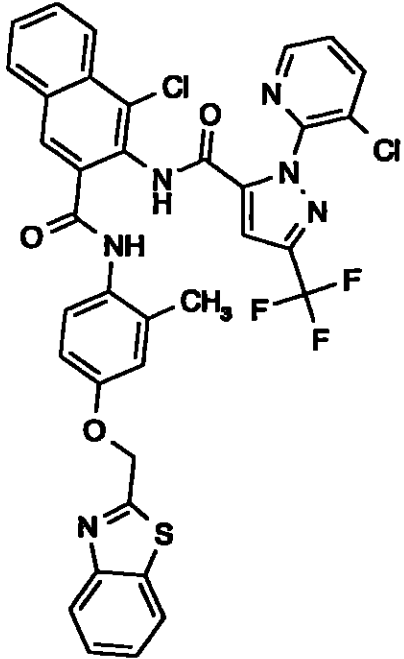
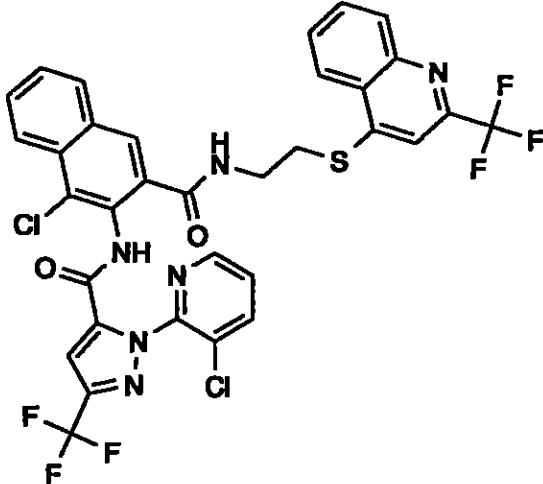
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.064		664 ((M+H)+)
P2.065		670 ((M+H)+)
P2.066		676 ((M+H)+)

121
111

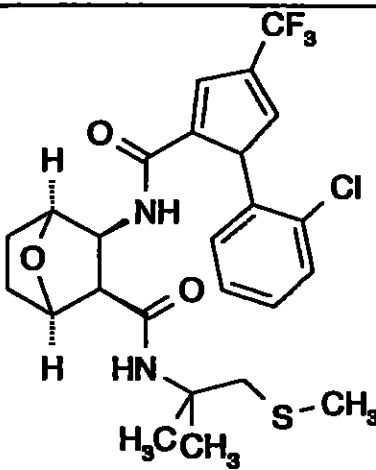
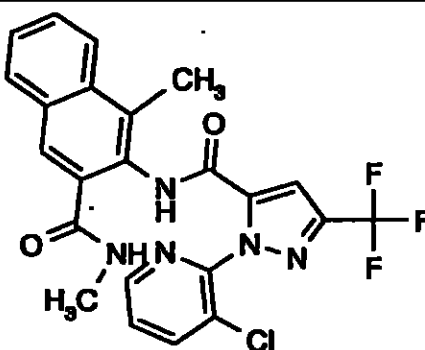
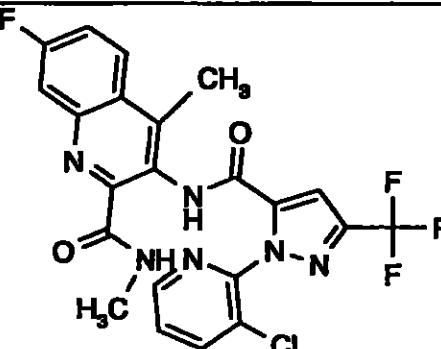
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.067		680 ((M+H)+)
P2.068		684 ((M+H)+)
P2.069		686 ((M+H)+)
P2.070		690 ((M+H)+)

H2
112

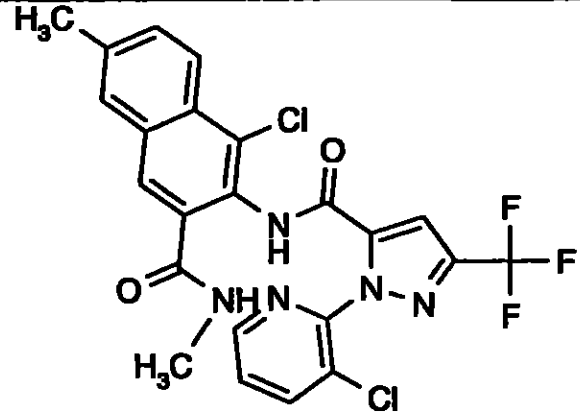
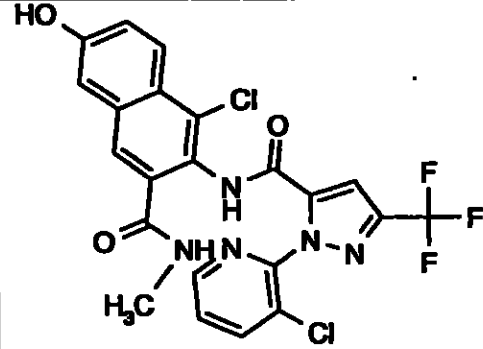
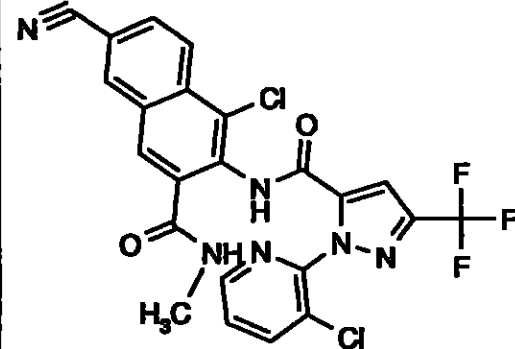
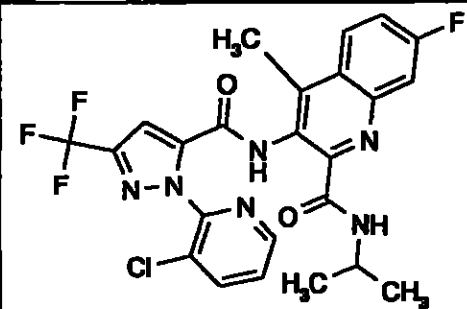
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.071		695 ((M+H)+)
P2.072		699 ((M+H)+)
P2.073		730 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.074	 The structure of P2.074 is a complex molecule. It features a central benzimidazole core. One nitrogen of the benzimidazole is substituted with a 4-(benzothiazol-2-ylmethoxy)phenyl group. The other nitrogen is substituted with a 2-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl group. The 2-position of the benzimidazole ring is substituted with a 2-chloro-1-(4-(benzothiazol-2-ylmethoxy)phenyl)benzoyl group.	747 ((M+H)+)
P2.075	 The structure of P2.075 is a complex molecule. It features a central benzimidazole core. One nitrogen of the benzimidazole is substituted with a 2-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl group. The other nitrogen is substituted with a 2-chloro-1-(4-(benzothiazol-2-ylmethoxy)phenyl)benzoyl group. The 2-position of the benzimidazole ring is substituted with a 2-chloro-1-(4-(benzothiazol-2-ylmethoxy)phenyl)benzoyl group.	749 ((M+H)+)

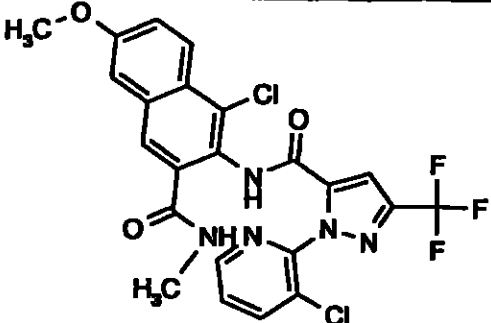
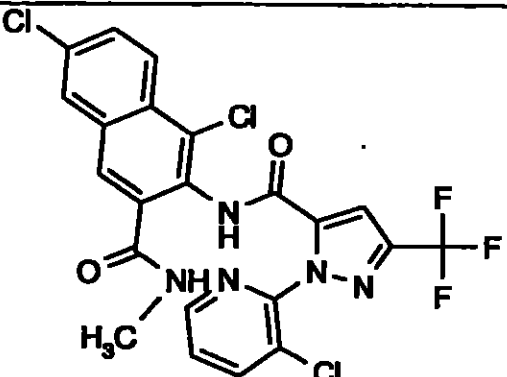
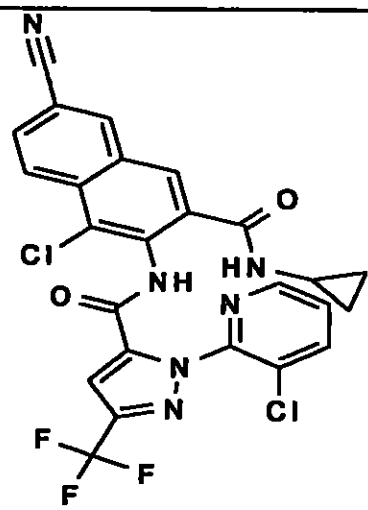
114
114

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.076 (T85.273)		459 ((M+H)+) oil
P2.077 (T8.1)		488 ((M+H)+)
P2.078		507 ((M+H)+)

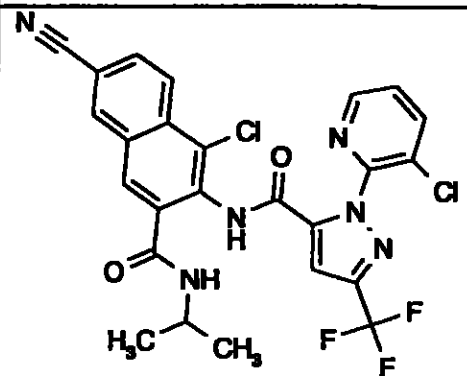
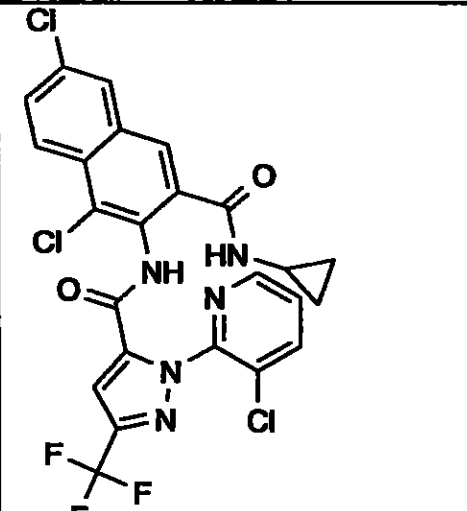
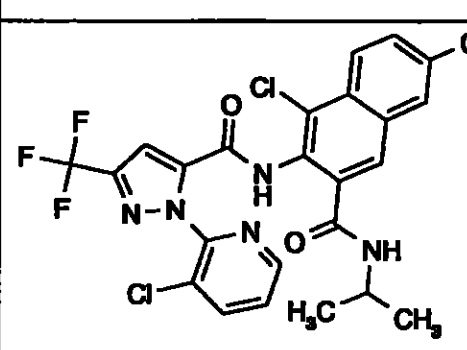
115
115

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.079		522 ((M+H)+)
P2.080		524 ((M+H)+)
P2.081 (T5.1)		533 ((M+H)+)
P2.082		535 ((M+H)+)

116
116

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.083		538 ((M+H)+)
P2.084 (T20.1)		544 ((M+H)+)
P2.085 (T5.207)		559 ((M+H)+)

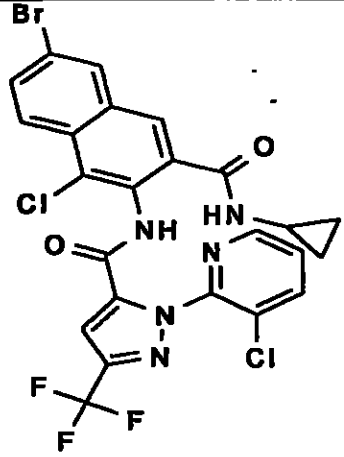
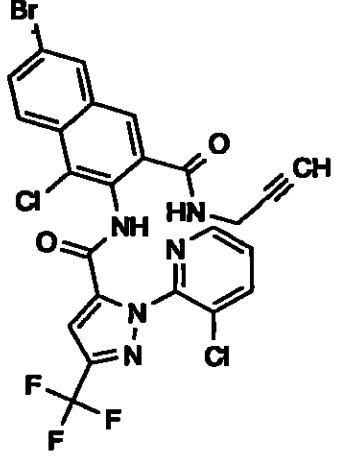
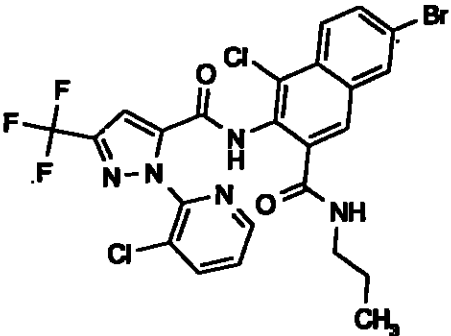
47
(1X)

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.086 (T5.3)		561 ((M+H)+)
P2.087 (T20.207)		568 ((M+H)+)
P2.088 (T20.3)		570 ((M+H)+)

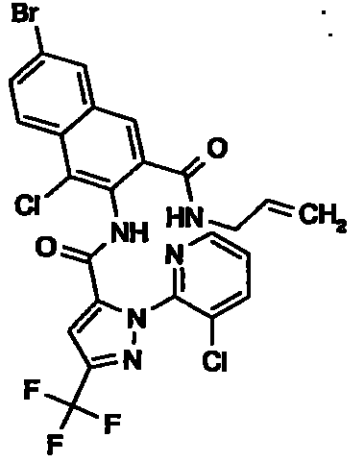
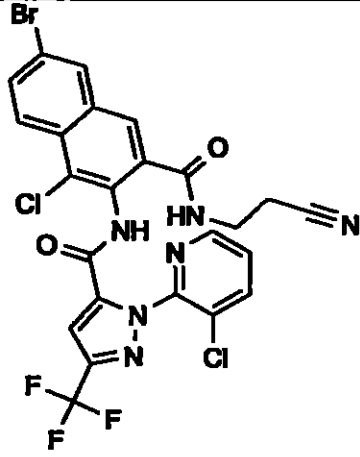
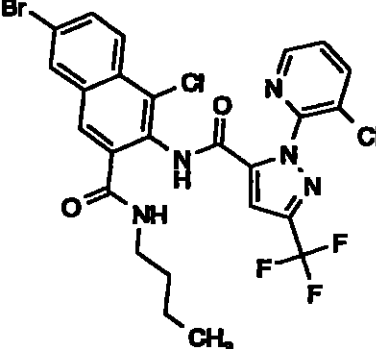
48
118

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P ln °C)
P2.089	 <chem>CC(C)NC(=O)c1ccc2c(c1)c(c3ccccc3[n+](=O)[O-])cc2ClNC(=O)c4cc(Cl)ccn4C(F)(F)F</chem>	581 ((M+H)+)
P2.090	 <chem>CCNC(=O)c1ccc2c(c1)c(c3ccccc3C(=O)OC)cc2ClNC(=O)c4cc(Cl)ccn4C(F)(F)F</chem>	582 ((M+H)+)
P2.091	 <chem>CC(C)NC(=O)c1ccc2c(c1)c(c3ccccc3NC(=O)C)cc2ClNC(=O)c4cc(Cl)ccn4C(F)(F)F</chem>	593 ((M+H)+)
P2.092 (T2.2)	 <chem>CCNC(=O)c1ccc2c(c1)c(c3ccccc3Br)cc2ClNC(=O)c4cc(Cl)ccn4C(F)(F)F</chem>	602 ((M+H)+)

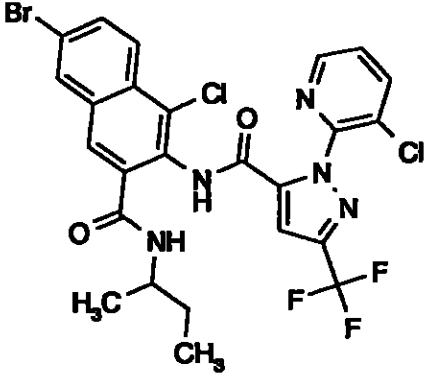
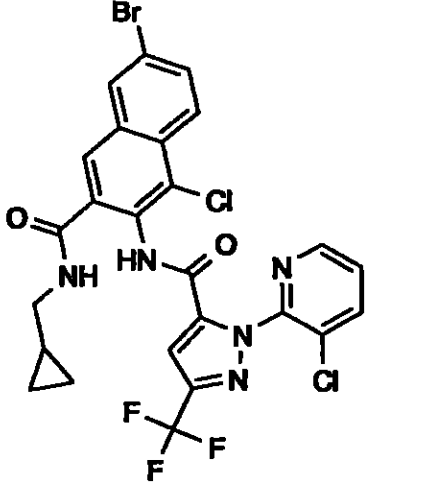
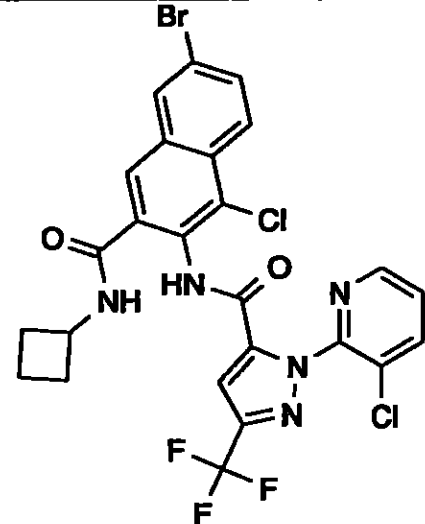
119
119

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.093 (T2.207)		612 ((M-1)-)
P2.094		612 ((M+H)+)
P2.095		614 ((M-1)-)

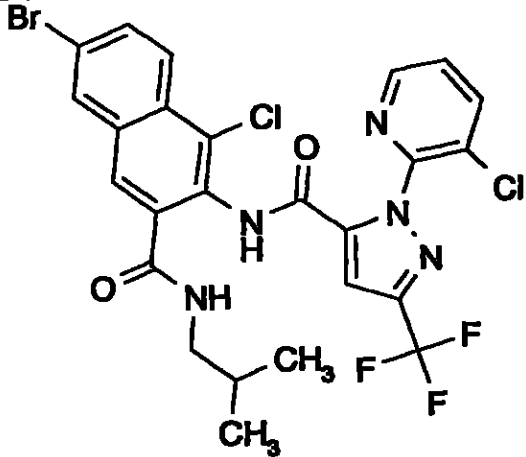
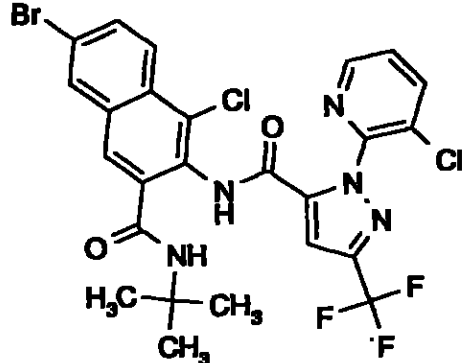
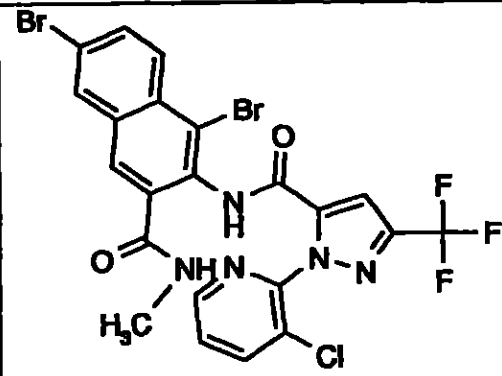
20
120

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.096		614 ((M+H)+)
P2.097		627 ((M+H)+)
P2.098		628 ((M+H)+)

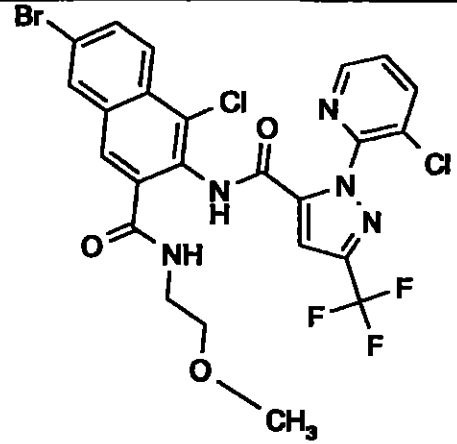
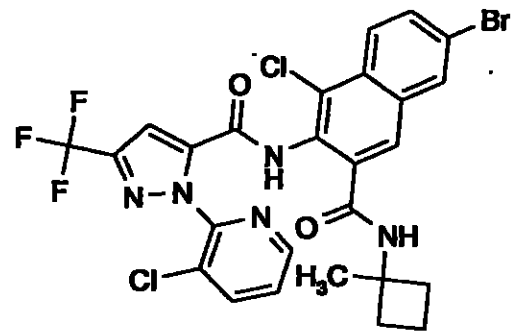
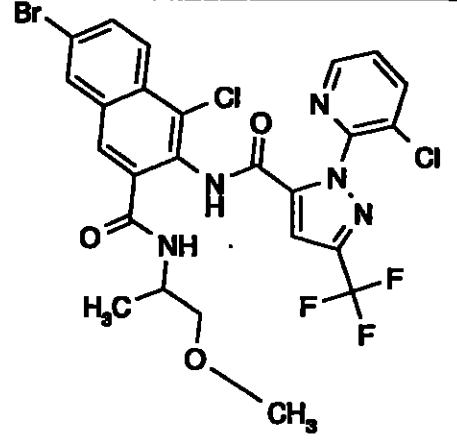
121
12

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.099		628 ((M-1)-)
P2.100		628 ((M+H)+)
P2.101		628 ((M+H)+)

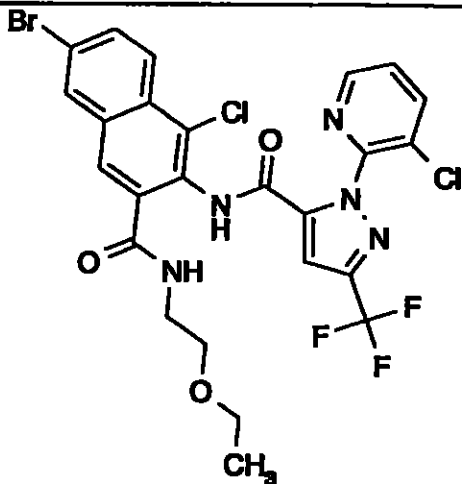
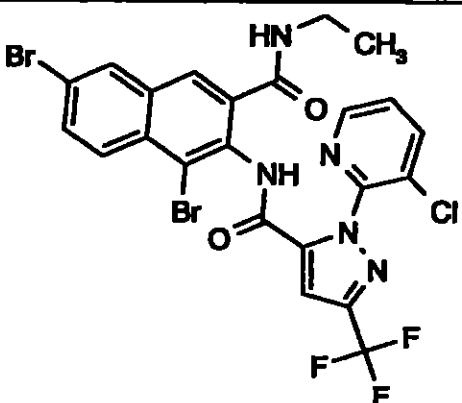
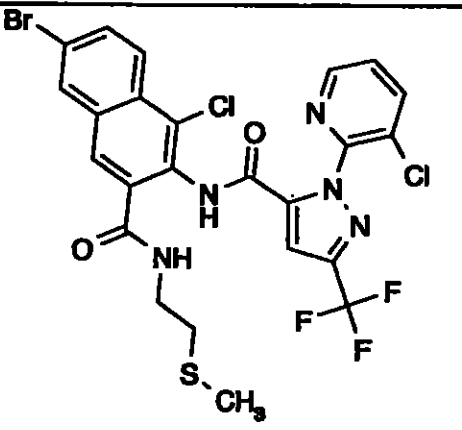
12

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.102		630 ((M+H)+)
P2.103		630 ((M+H)+)
P2.104 (T9.1)		632 ((M+H)+)

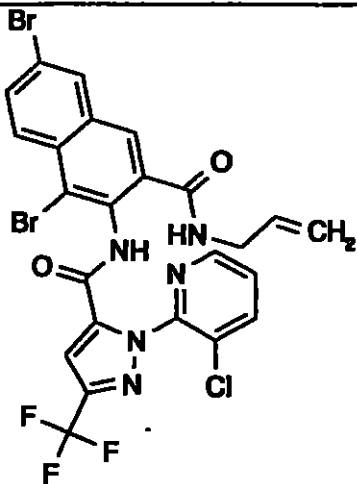
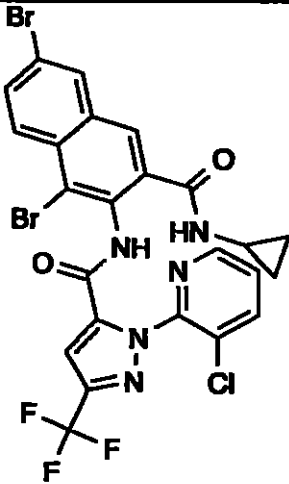
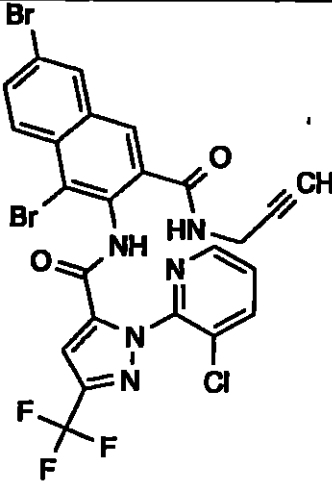
123
123

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.105		632 ((M+H)+)
P2.106		642 ((M+H)+)
P2.107		646 ((M+H)+)

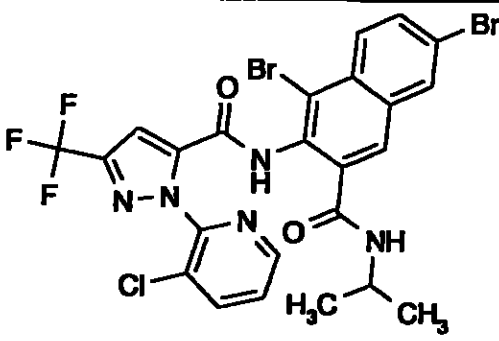
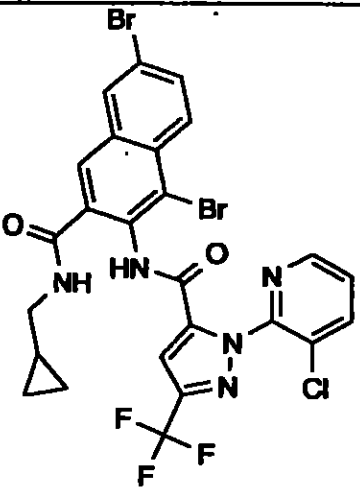
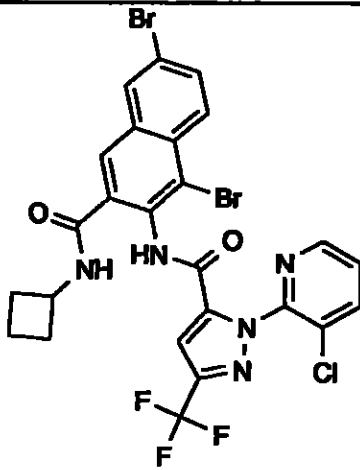
124
124

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.108		646 ((M+H)+)
P2.109 (T9.2)		646 ((M+H)+)
P2.110		648 ((M+H)+)

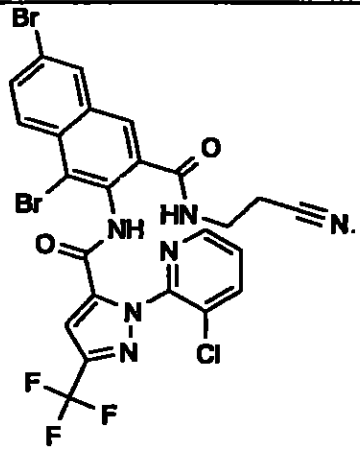
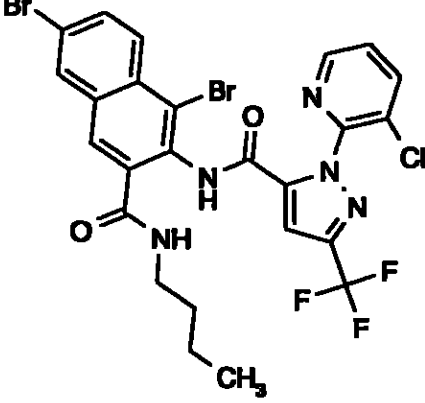
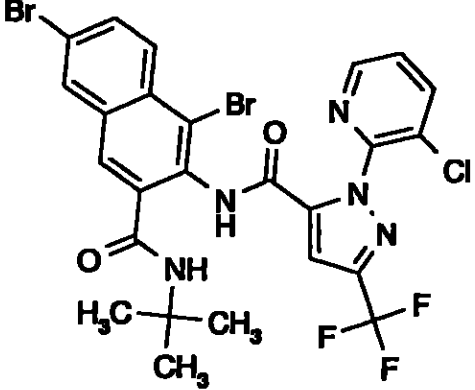
125
125

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.111		656 ((M+H)+)
P2.112 (T9.207)		656 ((M+H)+)
P2.113		656 ((M+H)+)

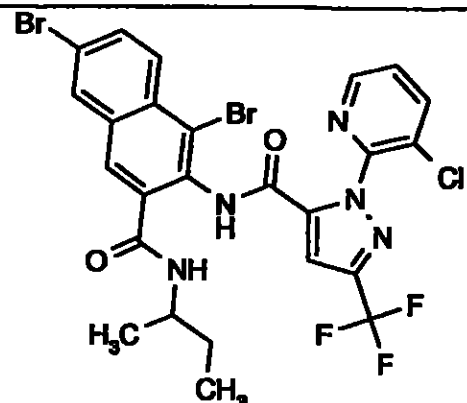
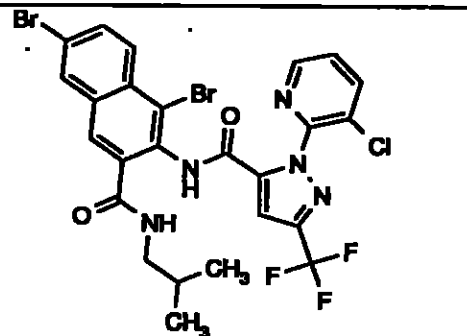
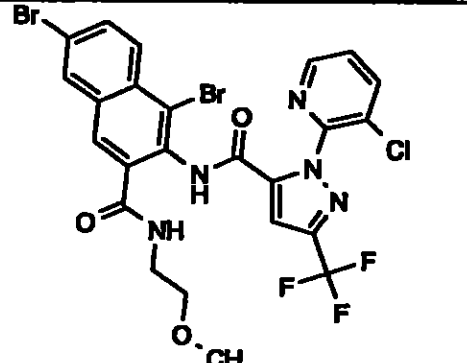
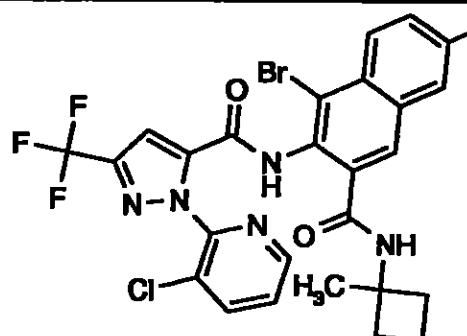
126
126

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.114 (T9.3)		660 ((M+H)+)
P2.115		670 ((M+H)+)
P2.116		670 ((M+H)+)

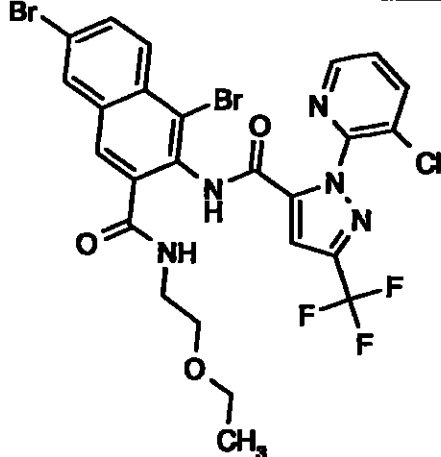
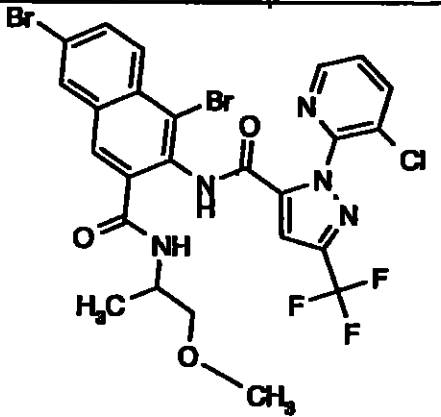
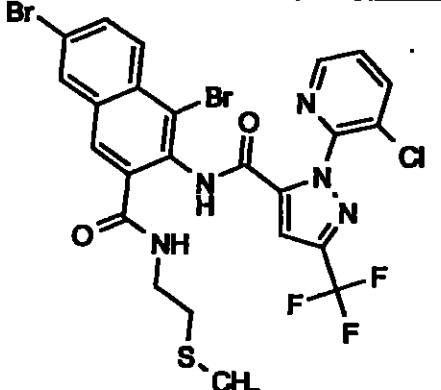
127
127

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.117		671 ((M+H)+)
P2.118		672 ((M+H)+)
P2.119 (T9.145)		672 ((M-1)-)

128
128

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.120		674 ((M+H)+)
P2.121		674 ((M+H)+)
P2.122		676 ((M+H)+)
P2.123		686 ((M+H)+)

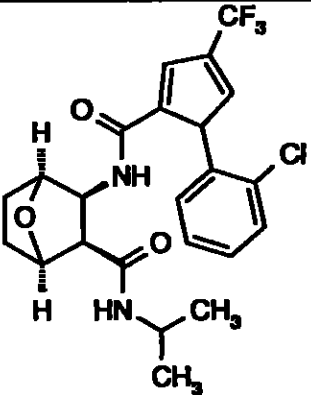
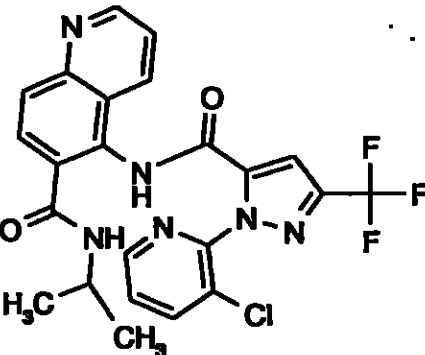
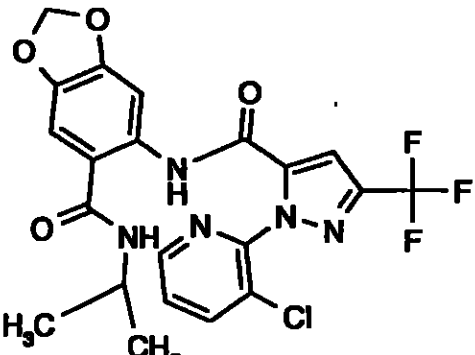
179
129

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.124		688 ((M+H)+)
P2.125		690 ((M+H)+)
P2.126		692 ((M+H)+)

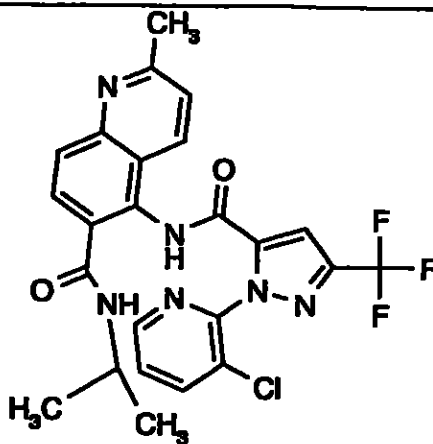
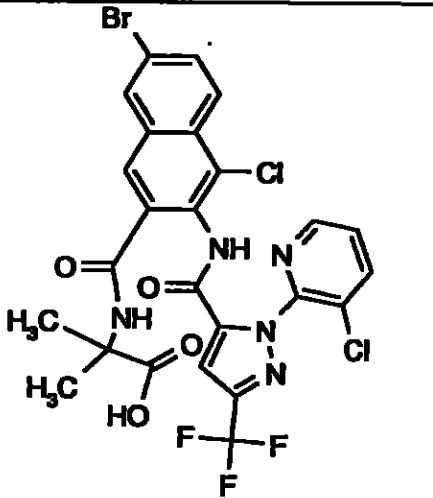
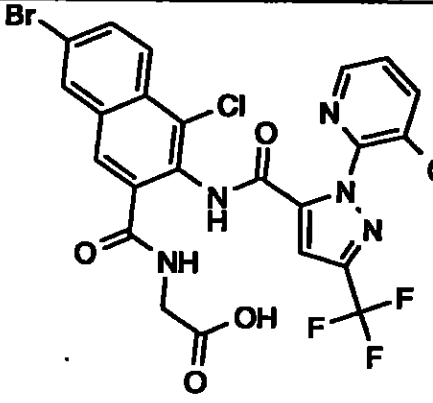
138
139

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.127		0.82-0.86 (t, 3H), 1.37-1.46 (m, 2H), 3.07-3.12 (m, 2H), 7.64-7.66 (m, 1H), 7.87-7.89 (dd, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.13-8.15 (d, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.41-8.42 (d, 1H), 8.48 (br, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H)
P2.128		1.07-7.08 (d, 6H), 3.90-3.97 (m, 1H), 6.10 (br s, 2H), 6.79-6.80 (d, 1H), 7.33-7.35 (d, 1H), 7.39-7.43 (m, 1H), 7.63-7.66 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.00-8.02 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H), 10.67 (s, 1H)

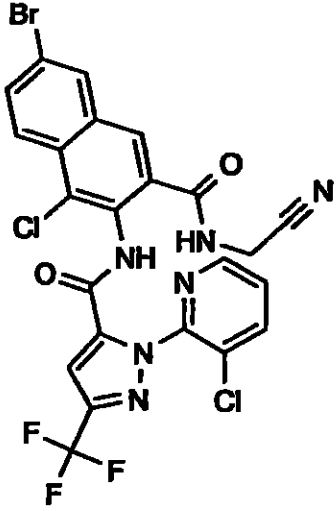
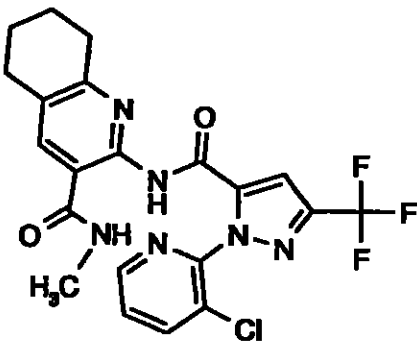
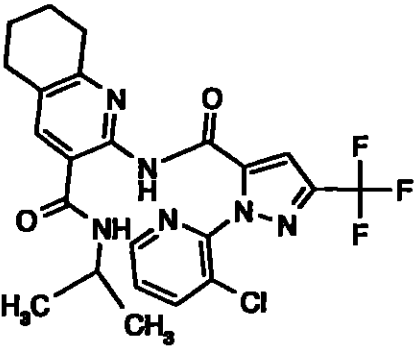
131
131

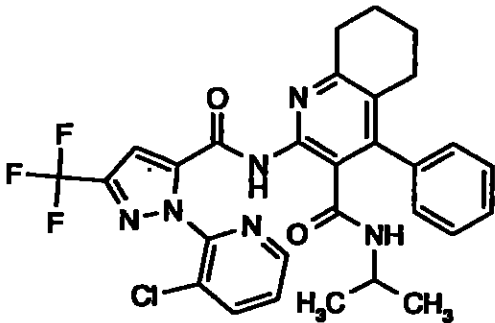
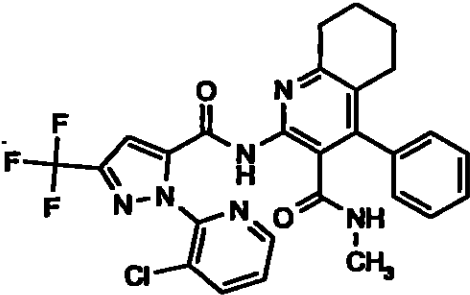
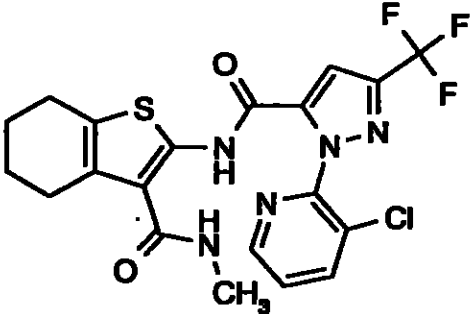
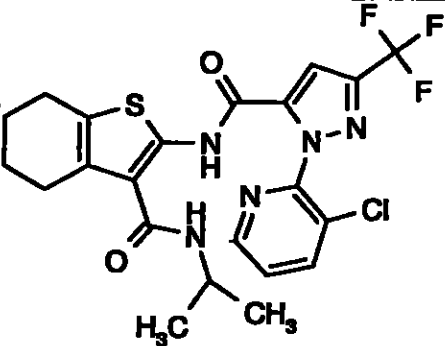
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
		1H)
P2.129 (T85.3)		220-224°C
P2.130		503 ((M+H)+)
P2.131 (T84.3)		496 ((M+H)+)

732
132

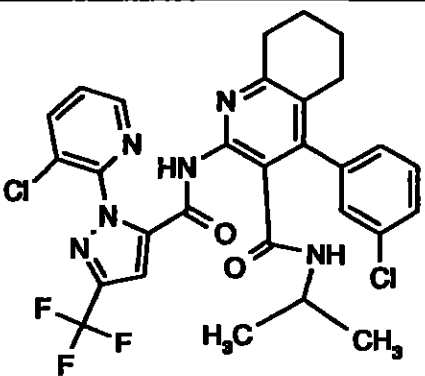
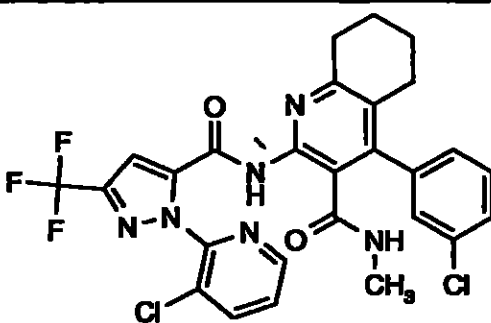
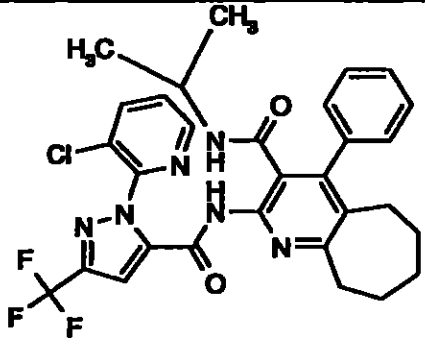
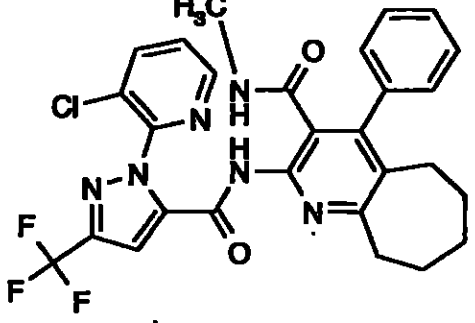
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.132		517 ((M+H)+)
P2.133		658 ((M+H)+)
P2.134		630 ((M+H)+)

133
139

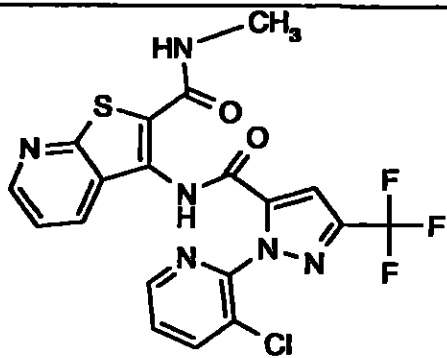
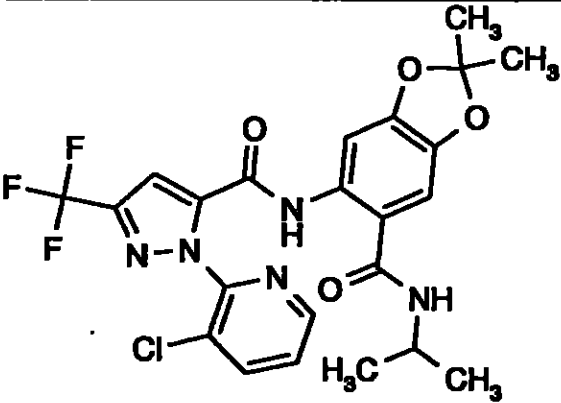
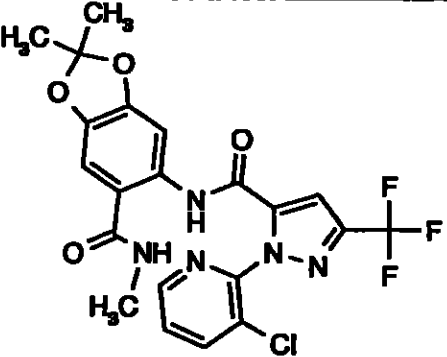
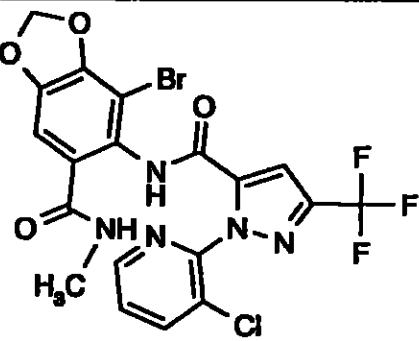
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.135		611 ((M+H)+)
P2.136 (T50.1)		145-147 °C
P2.137 (T50.3)		143-145 °C

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.138 (T51.3)		146-148 °C
P2.139 (T51.1)		165-168 °C
P2.140 (T46.1)		261-263 °C
P2.141 (T46.1)		246-248 °C

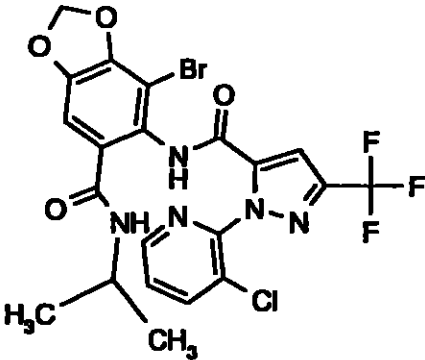
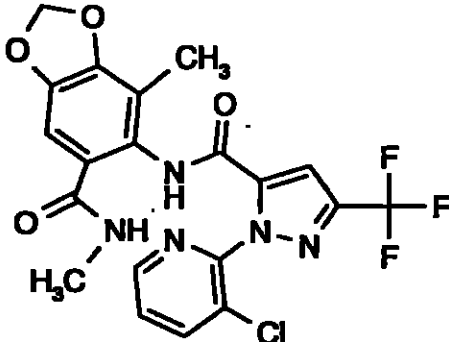
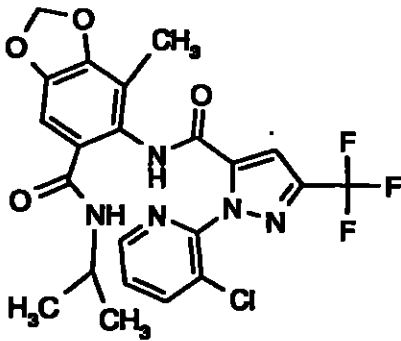
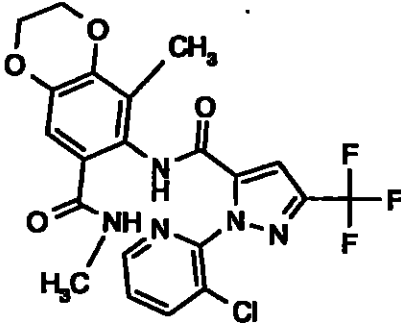
135
139

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.142 (T53.3)		259-260 °C
P2.143 (T53.1)		183-185 °C
P2.144 (T52.3)		269-270 °C
P2.145 (T52.1)		211-213 °C

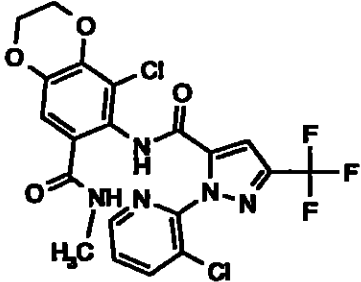
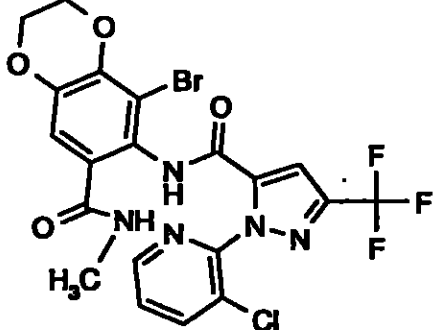
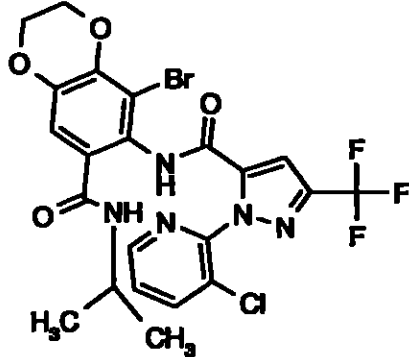
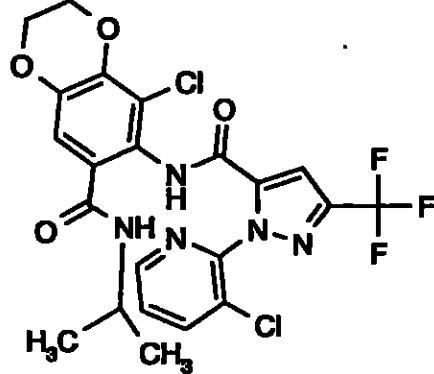
137
137X

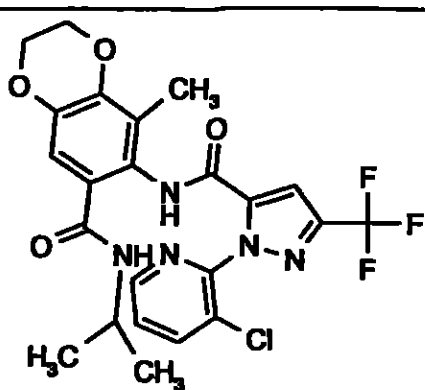
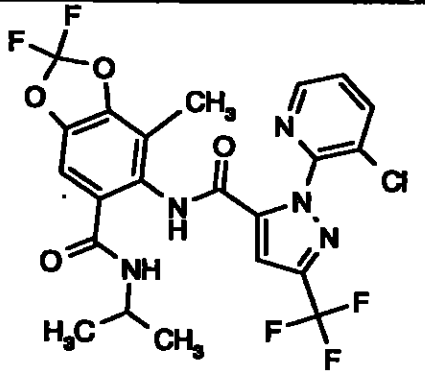
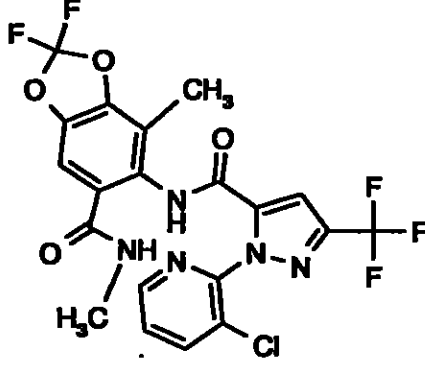
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P In °C)
P2.149		253-255 °C
P2.150		284-286 °C
P2.151		273-275 °C
P2.152		255-257 °C

138
139

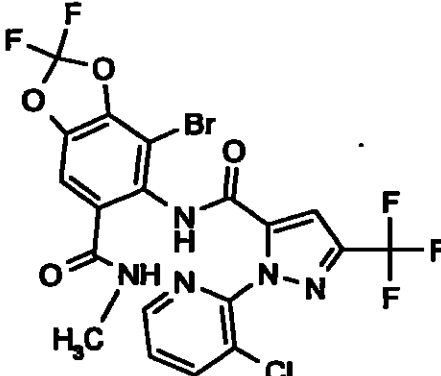
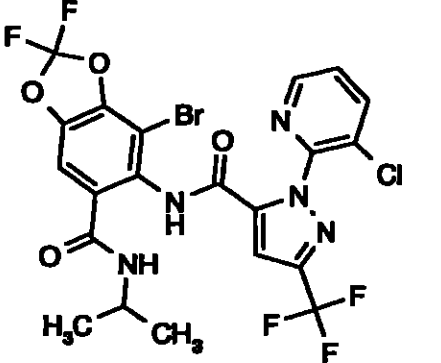
Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.153		274-276 °C
P2.154		255-257 °C
P2.155		267-270 °C
P2.156		265-267 °C

139
139

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.157 (T57.1)		257-259 °C
P2.158		253-255 °C
P2.159		274-276 °C
P2.160 (T57.3)		265-267 °C

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.161		265-267 °C
P2.162		254-255 °C
P2.163		272-274 °C

141

Comp. Nr.	Structure	Phys. Data (MS., NMR, M.P in °C)
P2.164		234-236 °C
P2.165		284-286 °C

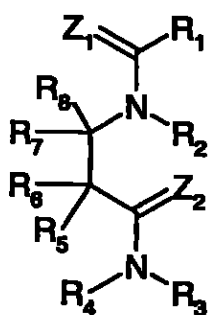
Example P11

The other compounds listed in the Tables 1 to 85 can also be prepared in a manner analogous to the procedures described in the Examples P1 to P10.

The Table A discloses 338 meanings of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ in a compound of the formula I.

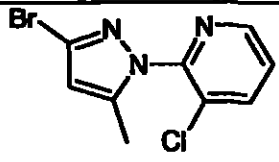
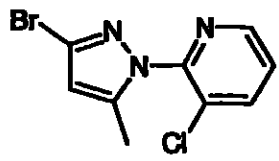
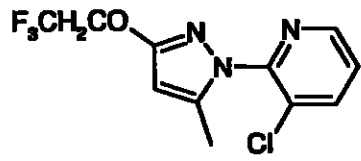
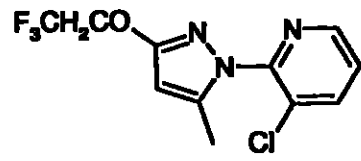
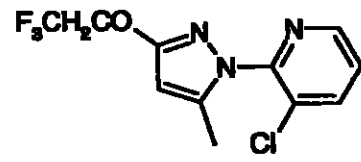
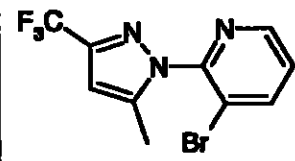
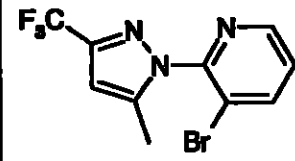
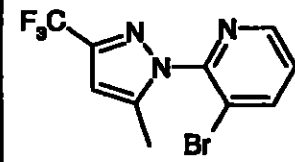
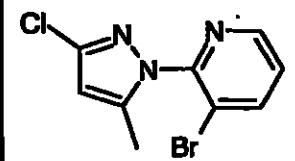
Table A

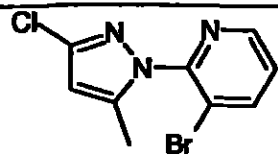
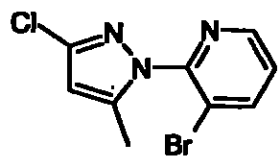
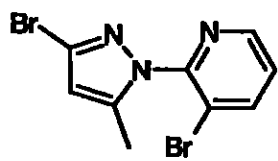
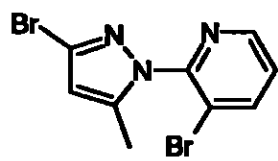
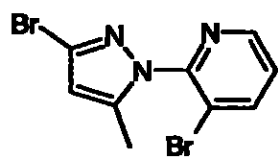
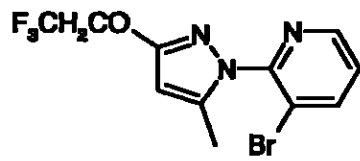
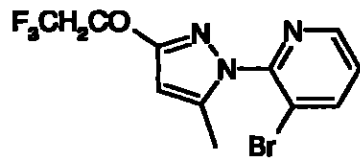
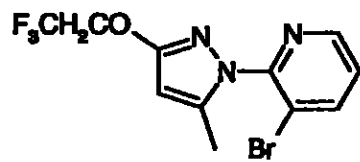
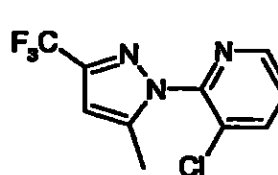
142
142



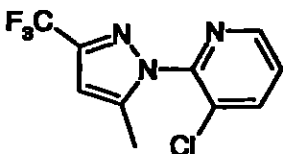
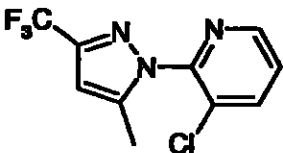
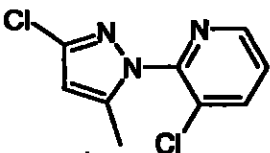
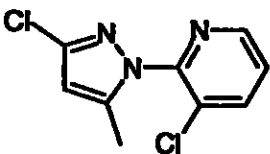
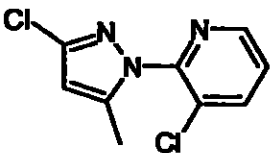
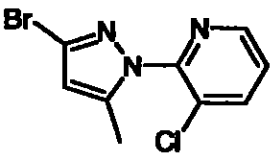
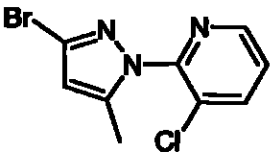
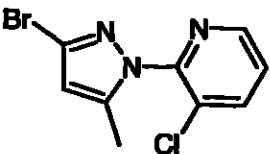
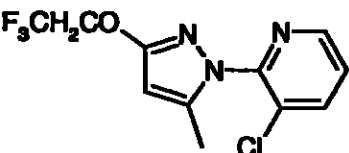
(I)

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.1	O	O		H	H	CH ₃
A.2	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.3	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.4	O	O		H	H	CH ₃
A.5	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.6	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.7	O	O		H	H	CH ₃

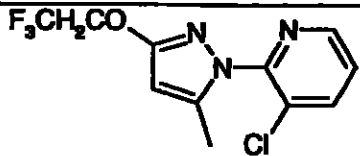
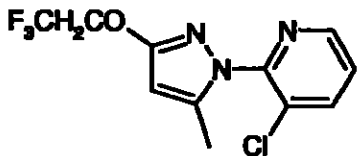
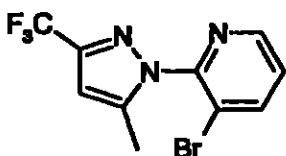
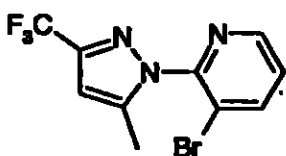
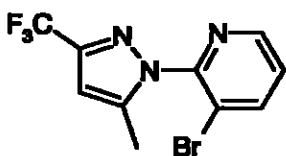
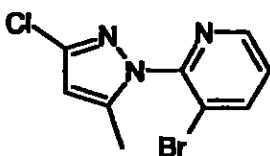
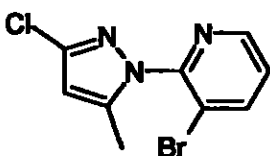
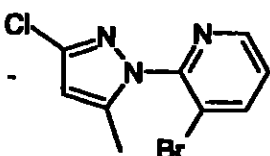
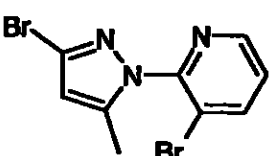
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.8	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.9	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.10	O	O		H	H	CH ₃
A.11	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.12	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.13	O	O		H	H	CH ₃
A.14	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.15	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16	O	O		H	H	CH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.17	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19	O	O		H	H	CH ₃
A.20	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.21	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.22	O	O		H	H	CH ₃
A.23	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.24	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.25	S	S		H	H	CH ₃

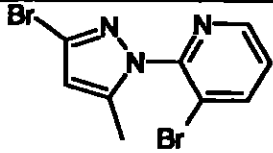
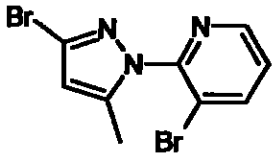
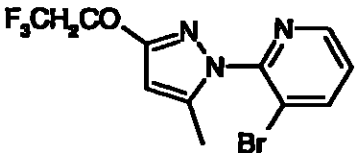
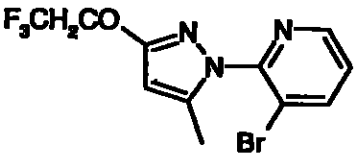
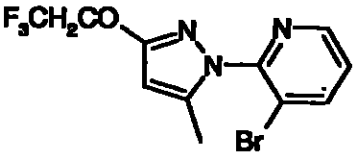
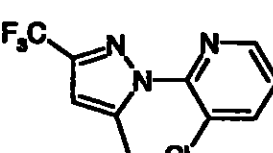
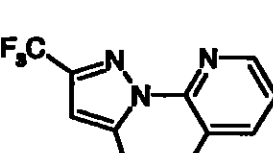
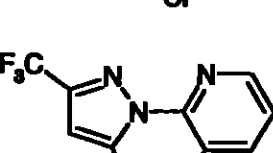
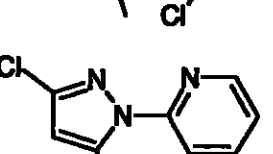
145
145

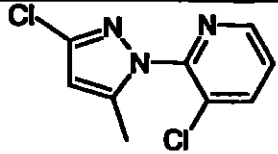
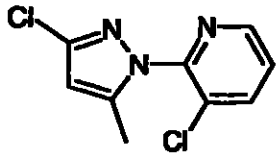
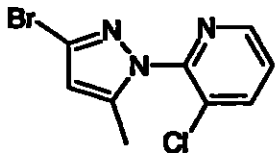
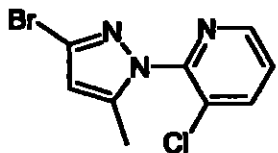
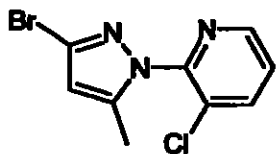
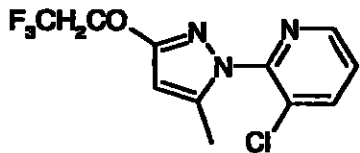
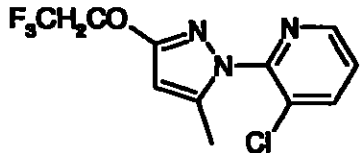
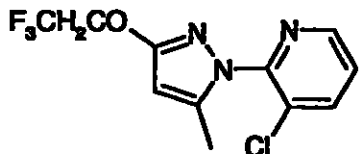
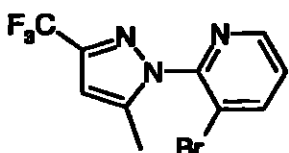
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.26	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.27	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.28	S	S		H	H	CH ₃
A.29	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.30	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.31	S	S		H	H	CH ₃
A.32	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.33	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.34	S	S		H	H	CH ₃

146
146

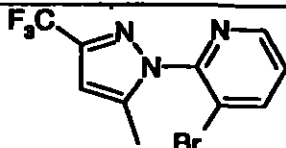
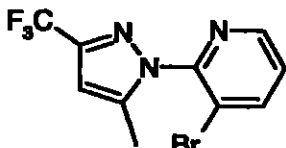
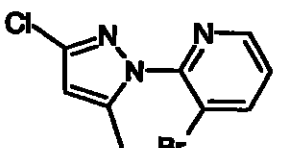
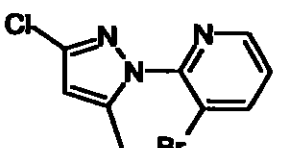
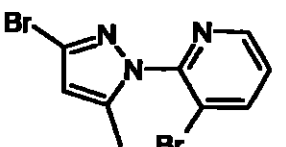
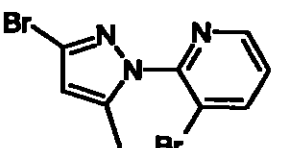
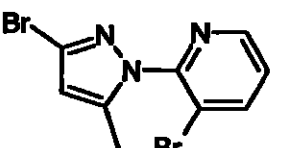
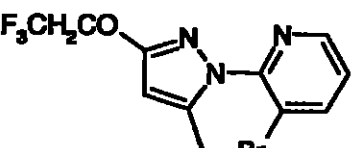
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.35	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.36	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.37	S	S		H	H	CH ₃
A.38	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.39	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.40	S	S		H	H	CH ₃
A.41	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.42	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.43	S	S		H	H	CH ₃

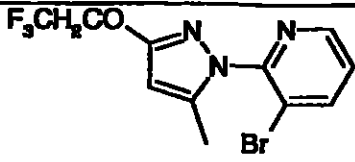
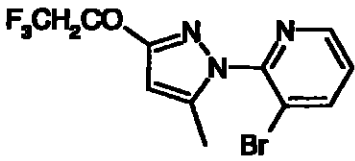
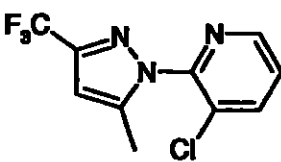
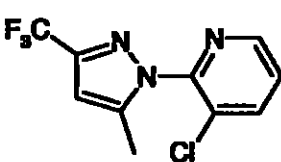
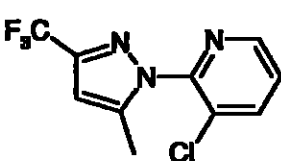
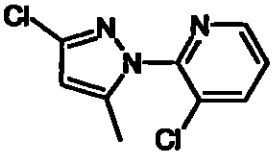
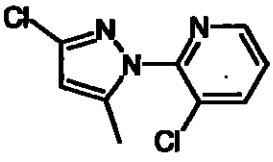
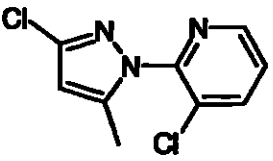
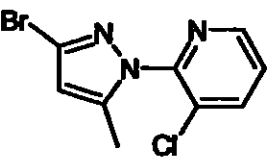
147
149

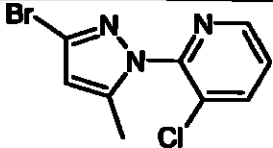
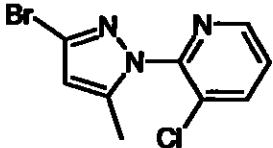
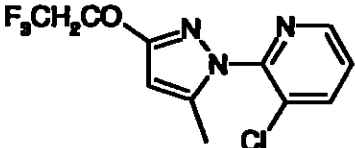
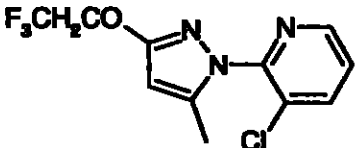
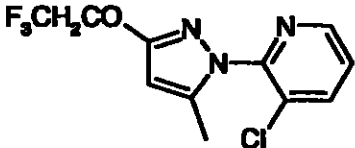
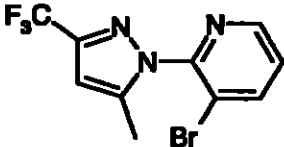
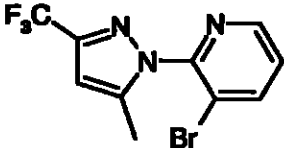
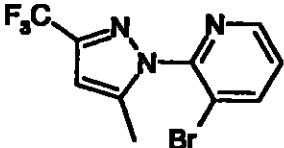
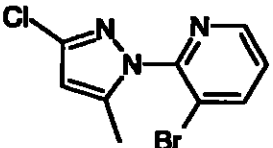
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.44	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.45	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.46	S	S		H	H	CH ₃
A.47	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.48	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.49	O	S		H	H	CH ₃
A.50	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.51	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.52	O	S		H	H	CH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.53	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.54	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.55	O	S		H	H	CH ₃
A.56	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.57	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.58	O	S		H	H	CH ₃
A.59	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.60	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.61	O	S		H	H	CH ₃

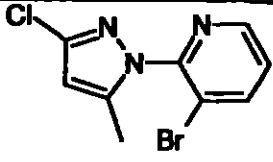
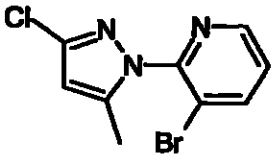
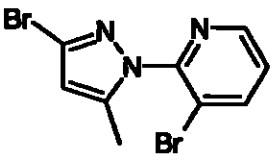
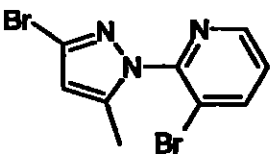
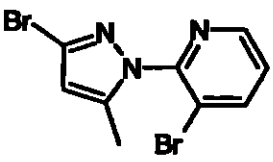
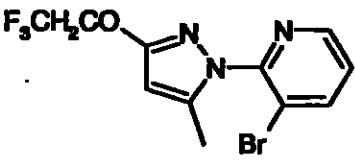
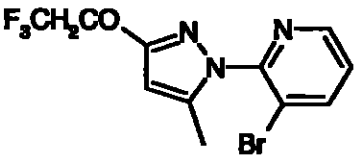
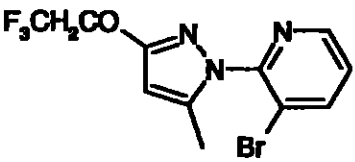
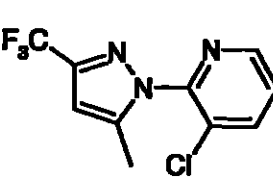
149

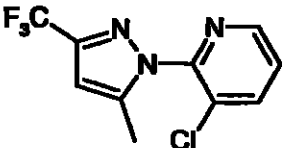
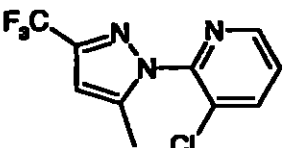
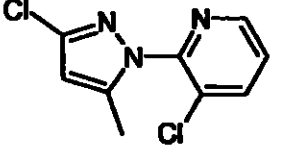
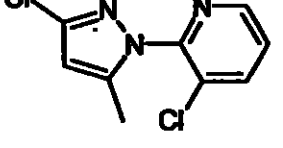
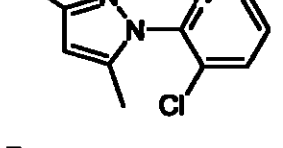
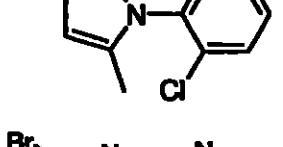
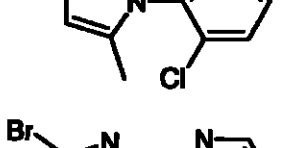
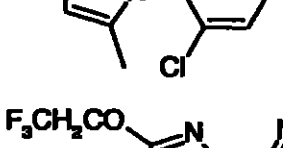
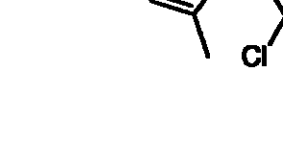
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.62	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.63	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.64	O	S		H	H	CH ₃
A.65	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.66	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.67	O	S		H	H	CH ₃
A.68	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.69	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.70	O	S		H	H	CH ₃

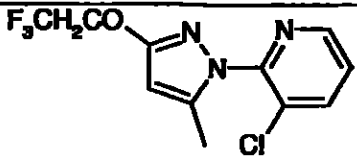
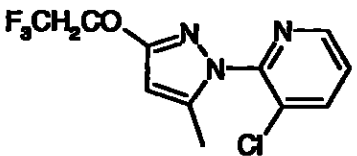
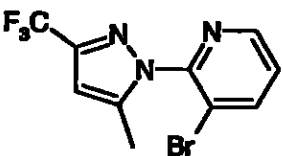
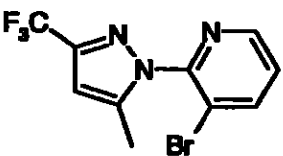
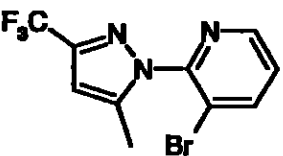
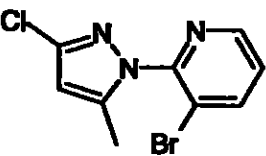
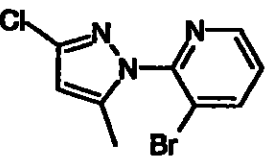
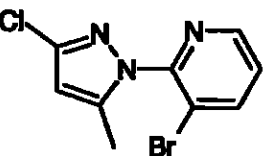
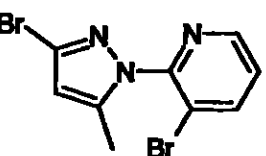
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.71	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.72	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.73	S	O		H	H	CH ₃
A.74	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.75	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.76	S	O		H	H	CH ₃
A.77	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.78	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.79	S	O		H	H	CH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.80	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.81	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.82	S	O		H	H	CH ₃
A.83	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.84	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.85	S	O		H	H	CH ₃
A.86	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.87	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.88	S	O		H	H	CH ₃

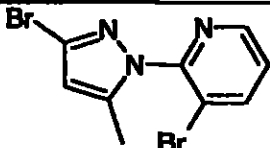
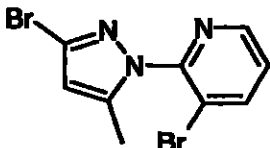
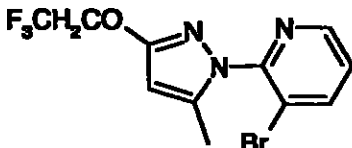
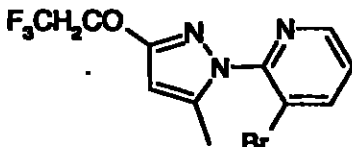
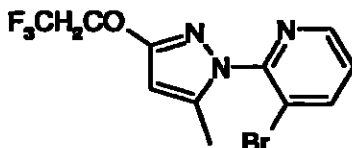
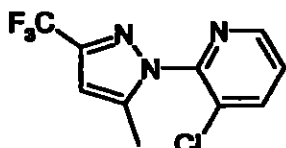
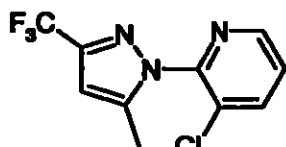
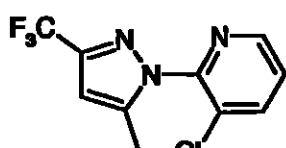
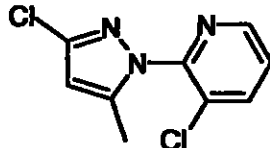
182
152

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.89	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.90	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.91	S	O		H	H	CH ₃
A.92	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.93	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.94	S	O		H	H	CH ₃
A.95	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.96	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.97	O	O		CH ₃	H	CH ₃

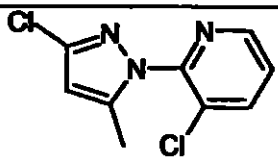
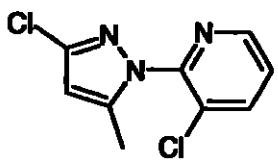
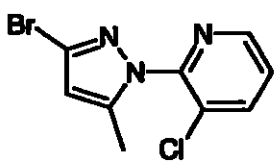
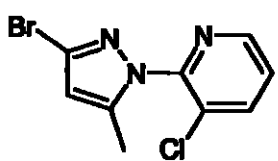
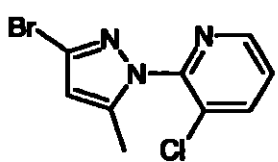
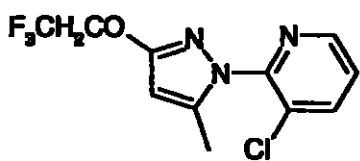
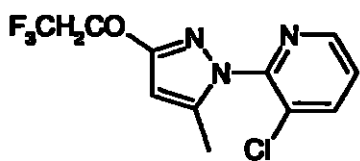
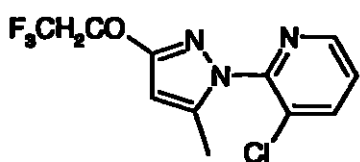
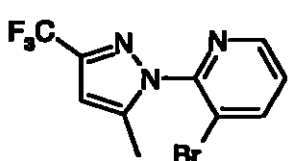
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.98	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.99	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.100	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.101	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.102	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.103	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.104	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.105	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.106	O	O		CH ₃	H	CH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.107	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.108	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.109	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.110	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.111	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.112	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.113	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.114	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.115	O	O		CH ₃	H	CH ₃

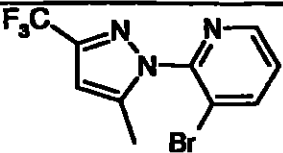
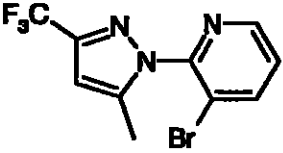
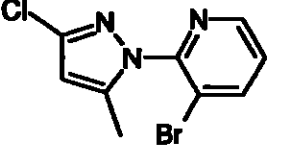
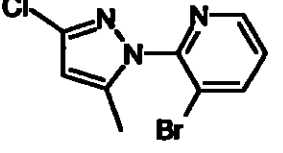
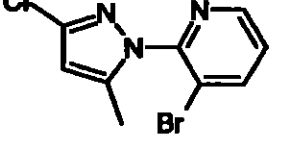
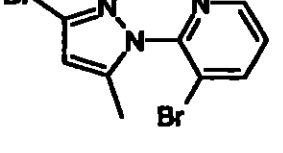
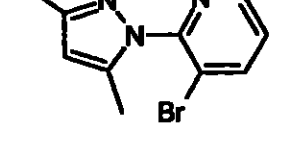
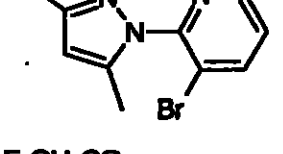
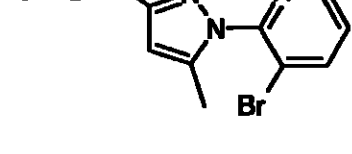
153
155

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.116	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.117	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.118	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.119	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.120	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.121	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.122	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.123	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.124	O	O		H	CH ₃	CH ₃

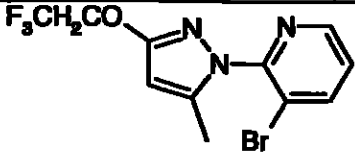
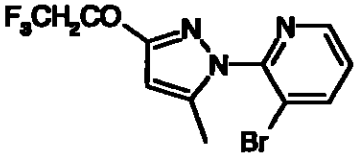
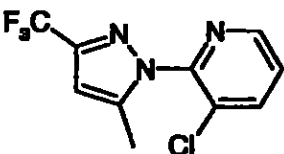
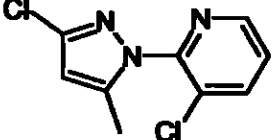
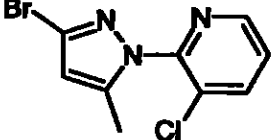
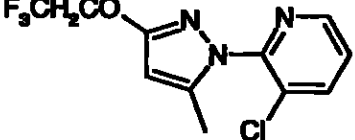
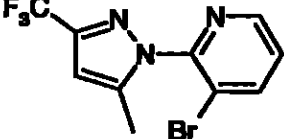
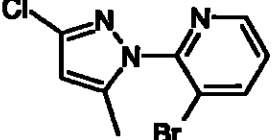
186
196

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.125	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.126	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.127	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.128	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.129	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.130	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.131	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.132	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.133	O	O		H	CH ₃	CH ₃

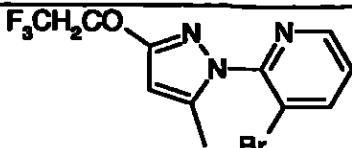
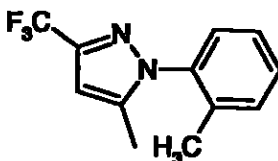
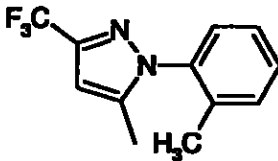
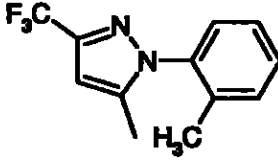
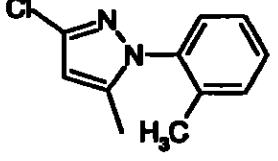
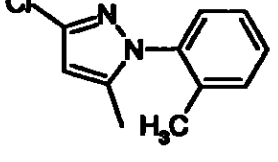
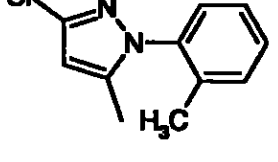
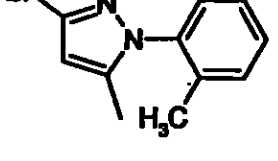
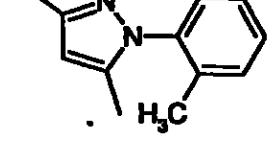
187
157

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.134	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.135	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.136	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.137	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.138	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.139	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.140	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.141	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.142	O	O		H	CH ₃	CH ₃

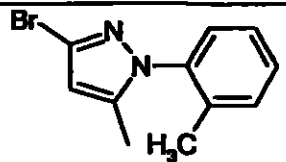
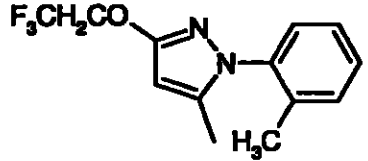
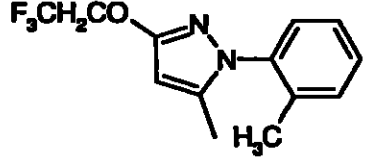
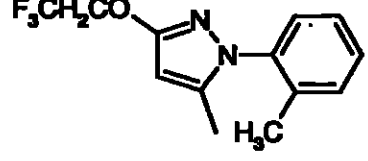
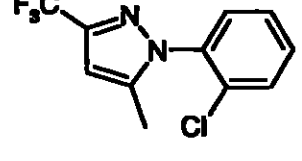
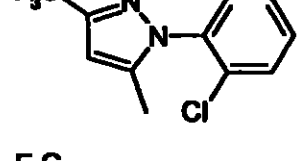
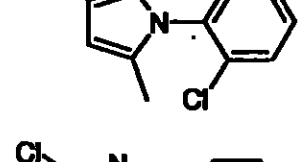
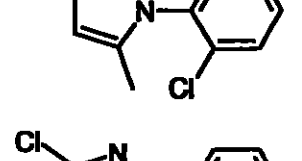
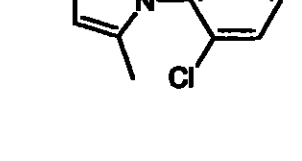
158
160

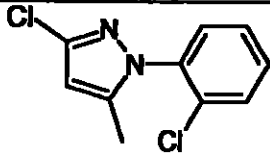
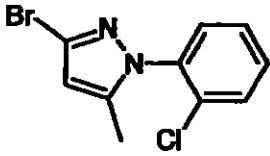
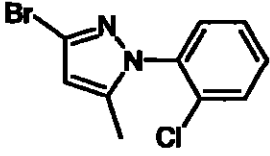
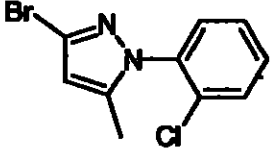
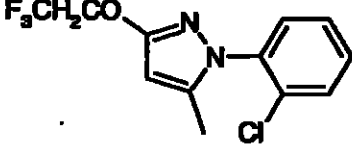
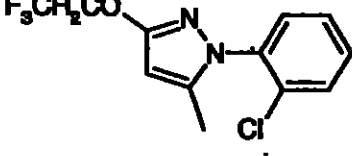
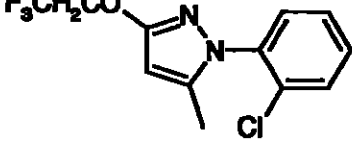
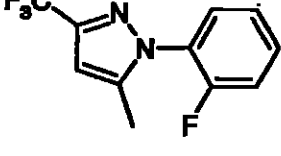
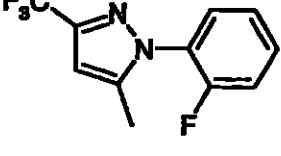
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.143	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.144	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.145	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.146	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.147	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.148	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.149	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.150	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.151	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃

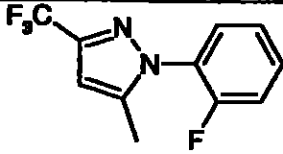
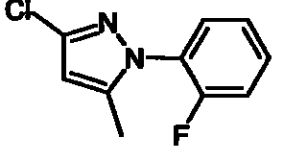
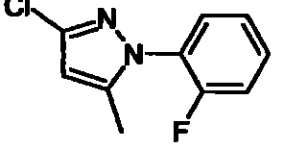
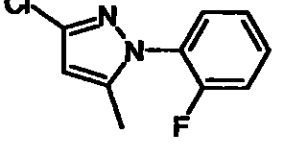
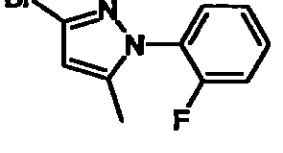
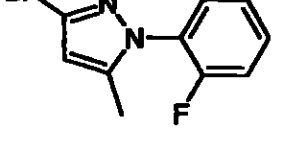
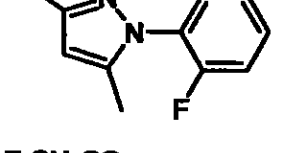
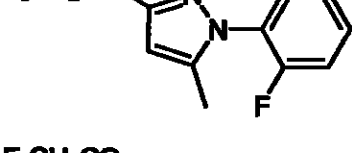
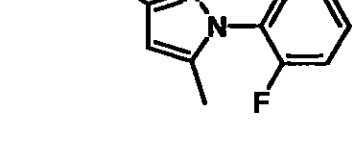
159
169

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.152	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.153	O	O		H	H	CH ₃
A.154	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.155	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.156	O	O		H	H	CH ₃
A.157	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.158	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.159	O	O		H	H	CH ₃
A.160	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

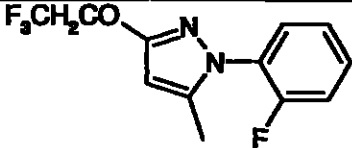
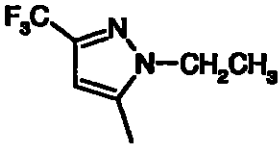
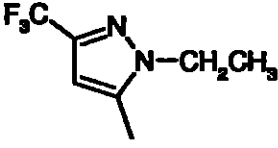
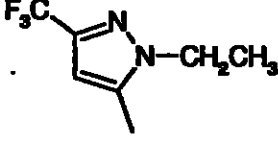
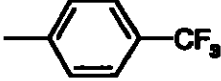
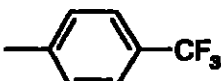
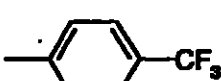
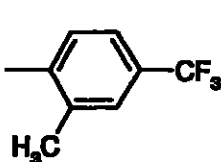
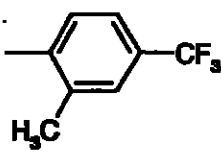
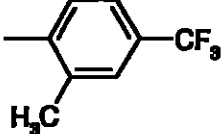
160
160

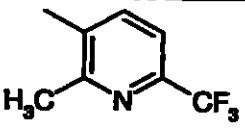
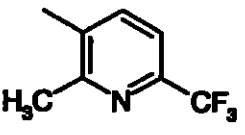
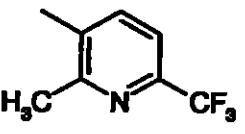
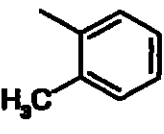
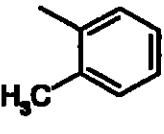
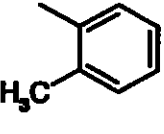
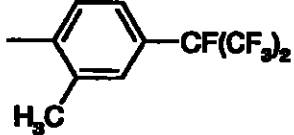
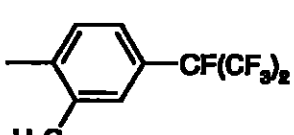
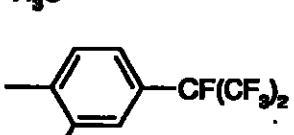
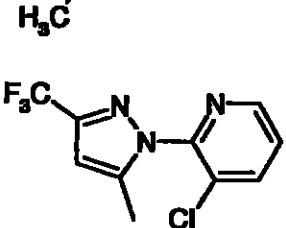
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.161	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.162	O	O		H	H	CH ₃
A.163	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.164	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.165	O	O		H	H	CH ₃
A.166	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.167	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.168	O	O		H	H	CH ₃
A.169	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.170	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.171	O	O		H	H	CH ₃
A.172	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.173	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.174	O	O		H	H	CH ₃
A.175	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.176	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.177	O	O		H	H	CH ₃
A.178	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

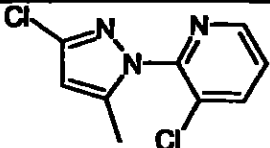
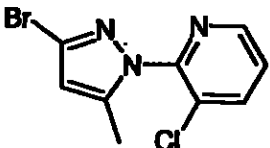
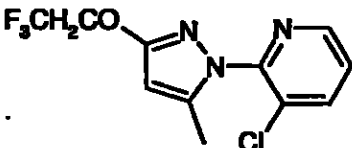
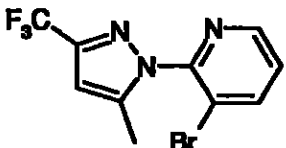
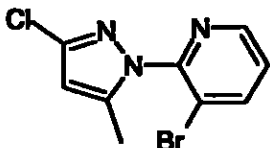
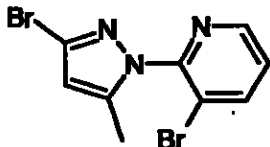
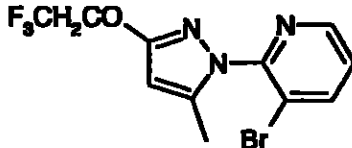
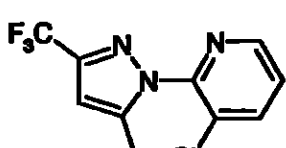
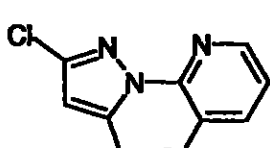
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.179	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.180	O	O		H	H	CH ₃
A.181	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.182	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.183	O	O		H	H	CH ₃
A.184	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.185	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.186	O	O		H	H	CH ₃
A.187	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

163

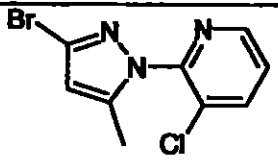
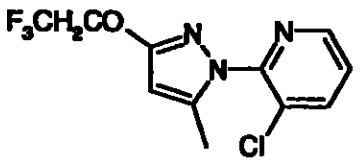
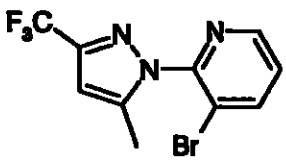
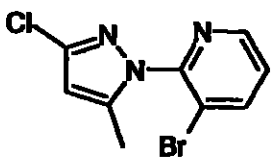
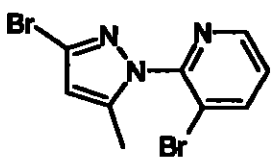
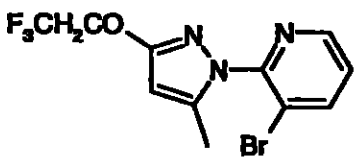
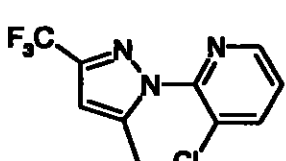
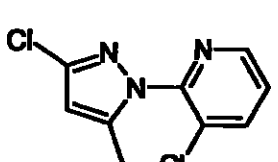
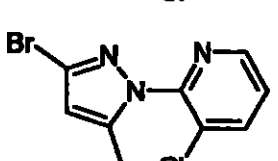
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.188	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.189	O	O		H	H	CH ₃
A.190	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.191	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.192	O	O		H	H	CH ₃
A.193	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.194	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.195	O	O		H	H	CH ₃
A.196	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.197	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.198	O	O		H	H	CH ₃
A.199	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.200	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.201	O	O		H	H	CH ₃
A.202	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.203	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.204	O	O		H	H	CH ₃
A.205	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.206	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.207	O	O		H	H	Cyclopropyl

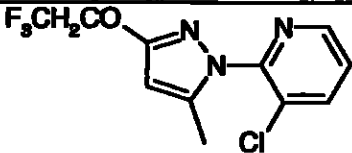
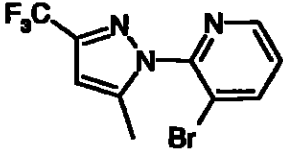
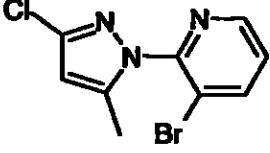
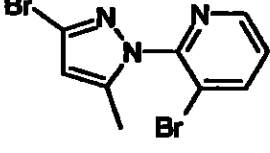
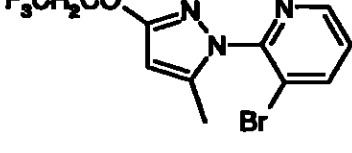
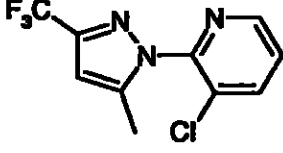
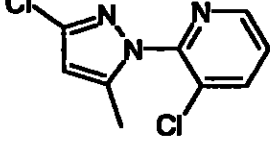
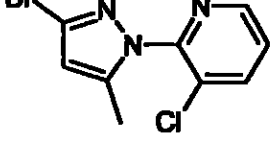
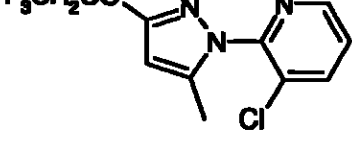
165
165

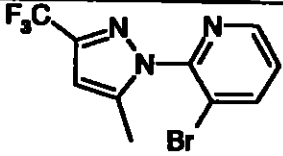
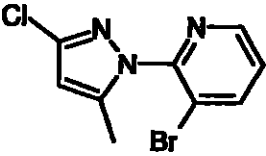
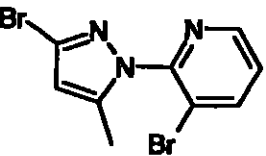
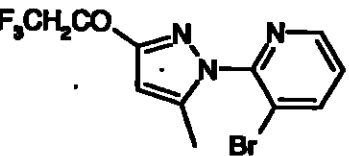
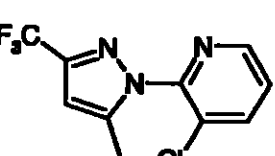
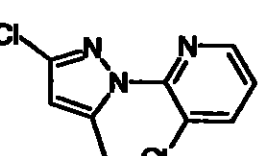
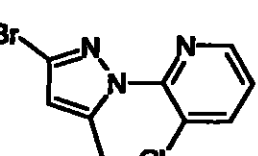
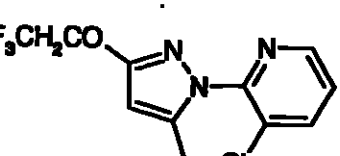
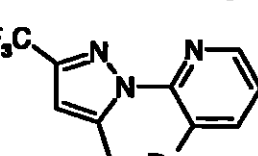
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.208	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.209	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.210	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.211	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.212	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.213	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.214	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.215	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.216	S	S		H	H	Cyclopropyl

146
166

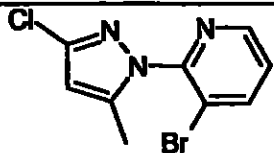
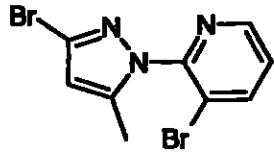
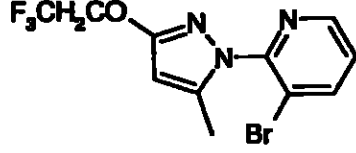
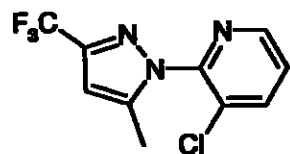
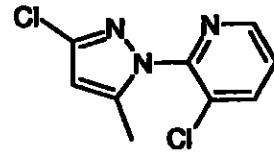
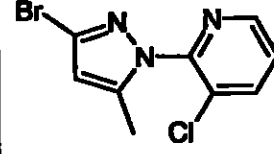
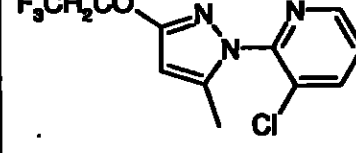
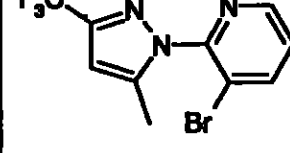
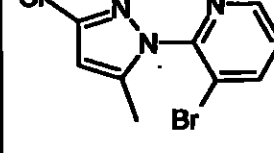
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.217	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.218	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.219	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.220	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.221	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.222	S	S		H	H	Cyclopropyl
A.223	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.224	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.225	O	S		H	H	Cyclopropyl

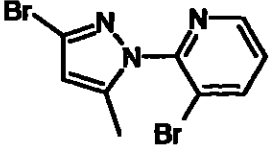
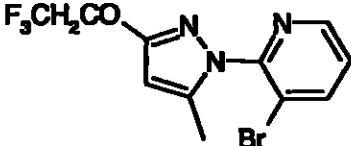
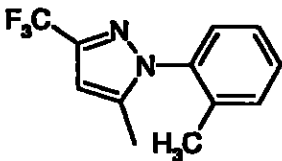
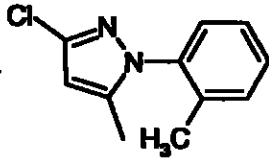
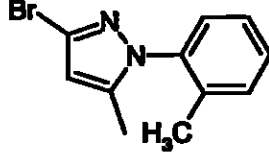
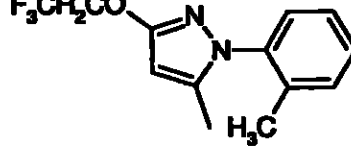
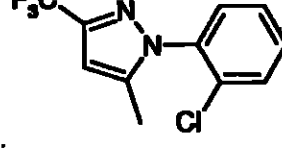
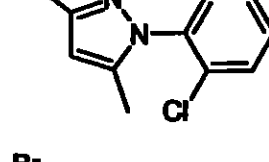
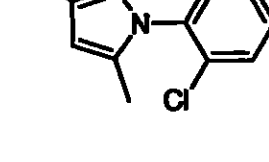
157
167

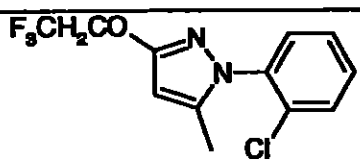
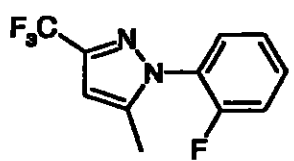
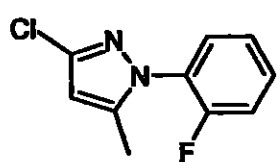
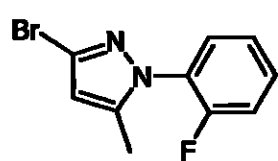
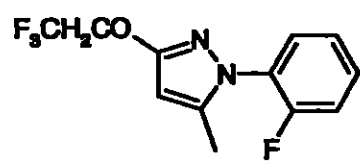
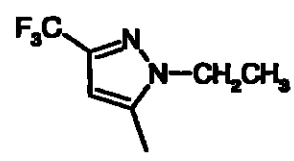
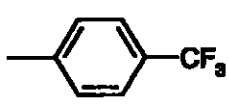
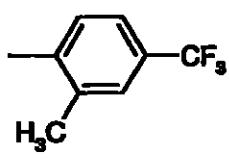
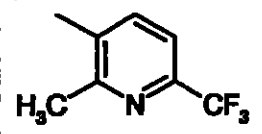
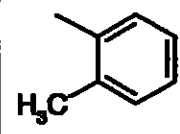
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.226	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.227	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.228	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.229	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.230	O	S		H	H	Cyclopropyl
A.231	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.232	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.233	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.234	S	O		H	H	Cyclopropyl

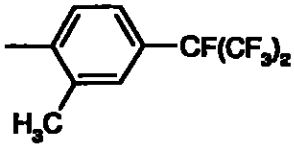
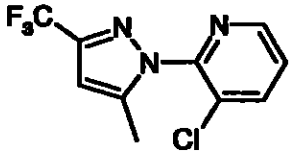
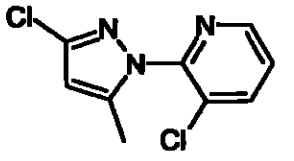
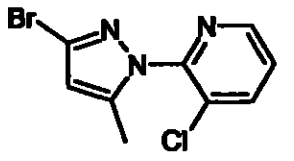
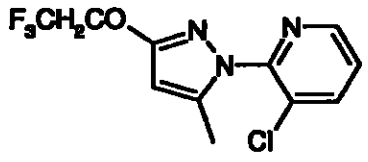
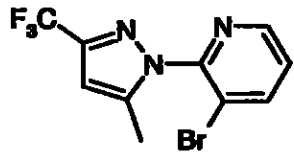
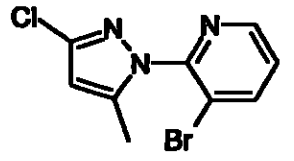
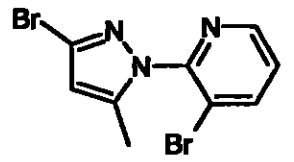
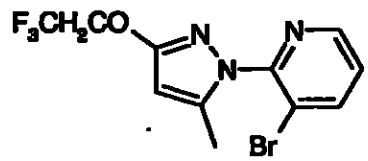
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.235	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.236	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.237	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.238	S	O		H	H	Cyclopropyl
A.239	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.240	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.241	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.242	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.243	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl

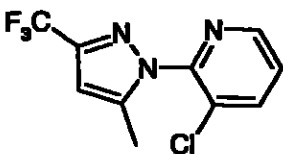
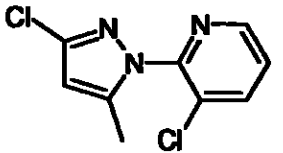
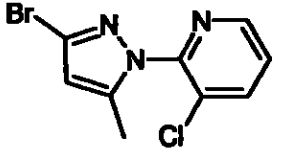
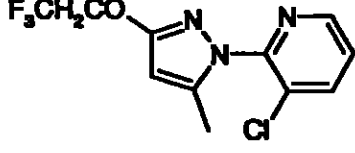
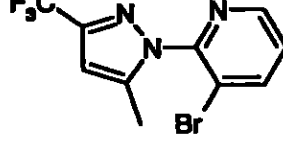
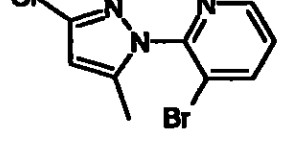
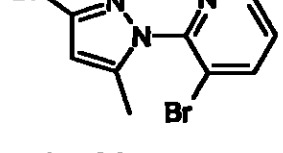
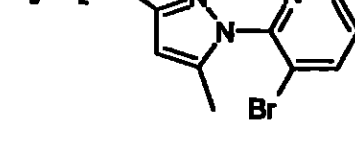
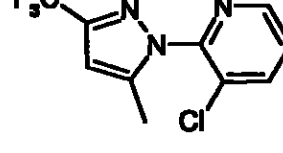
169
169

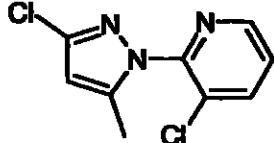
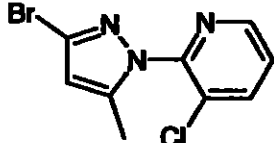
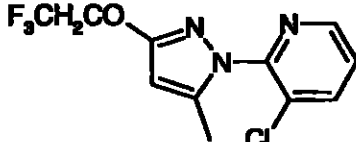
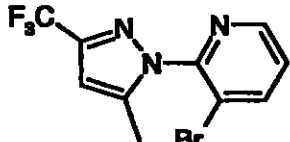
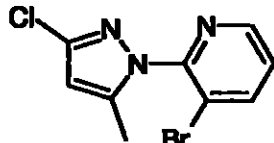
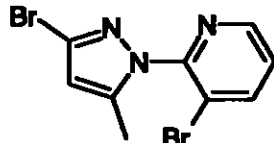
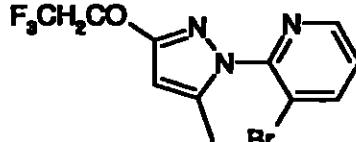
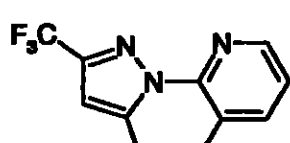
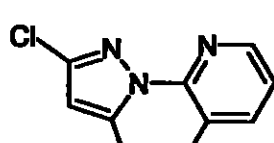
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.244	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.245	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.246	O	O		CH ₃	H	Cyclopropyl
A.247	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.248	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.249	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.250	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.251	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.252	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.253	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.254	O	O		H	CH ₃	Cyclopropyl
A.255	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.256	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.257	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.258	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.259	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.260	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.261	O	O		H	H	Cyclopropyl

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.262	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.263	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.264	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.265	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.266	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.267	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.268	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.269	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.270	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.271	O	O		H	H	Cyclopropyl

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.272	O	O		H	H	Cyclopropyl
A.273	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.274	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.275	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.276	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.277	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.278	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.279	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.280	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

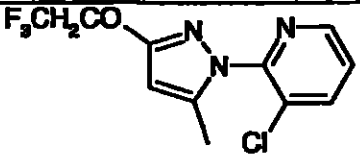
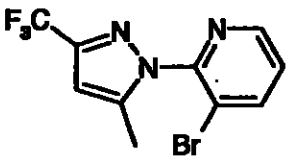
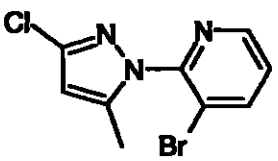
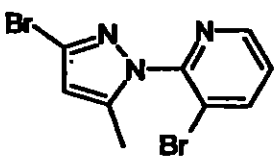
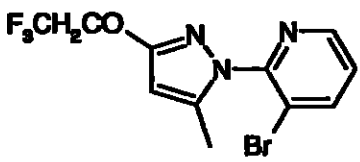
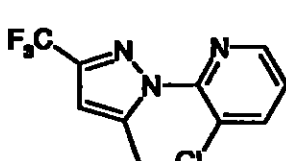
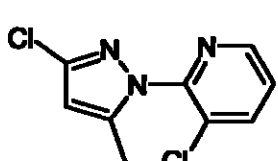
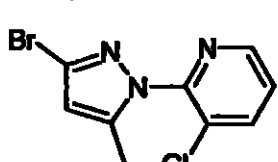
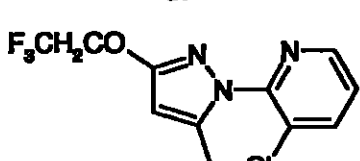
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.281	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.282	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.283	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.284	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.285	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.286	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.287	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.288	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.289	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.290	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.291	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.292	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.293	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.294	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.295	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.296	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.297	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.298	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

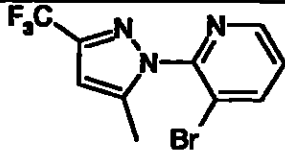
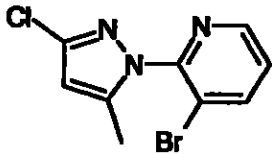
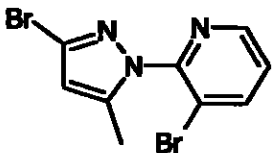
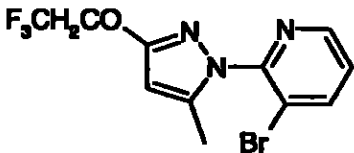
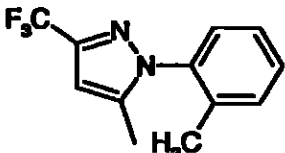
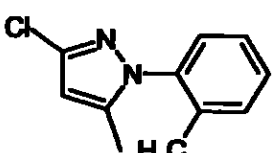
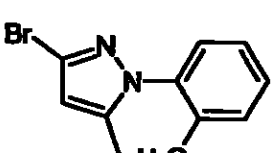
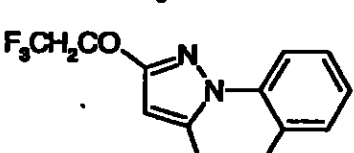
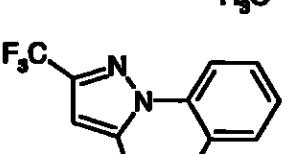
175
175

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.299	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.300	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.301	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.302	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.303	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.304	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.305	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.306	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.307	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

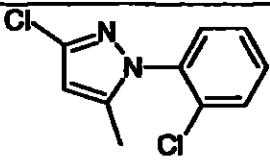
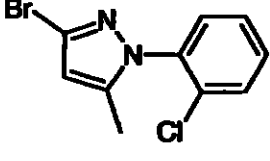
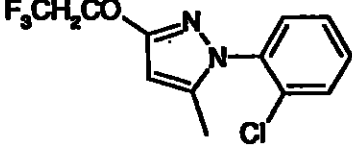
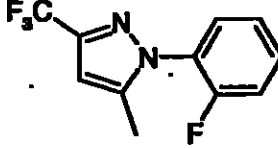
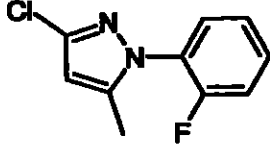
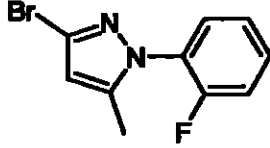
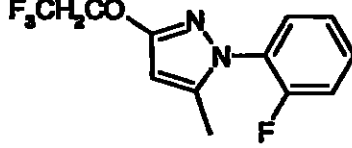
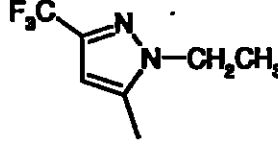
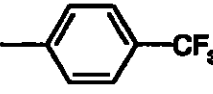
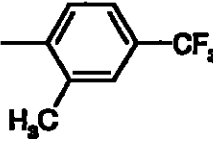
176
176

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.308	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.309	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.310	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.311	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.312	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.313	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.314	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.315	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.316	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

17.7.
127

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.317	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.318	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.319	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.320	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.321	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.322	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.323	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.324	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.325	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

178
178

Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.326	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.327	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.328	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.329	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.330	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.331	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.332	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.333	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.334	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.335	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

177
178

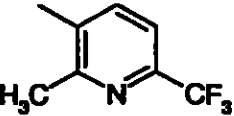
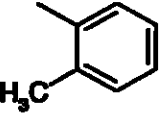
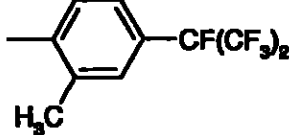
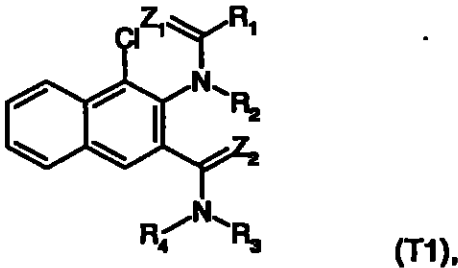
Line	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.336	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.337	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.338	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

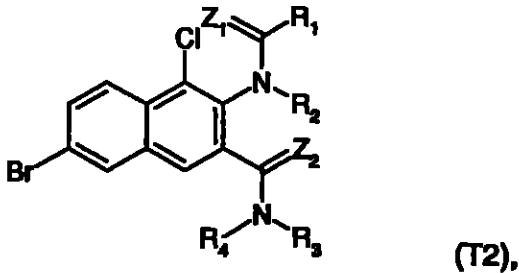
Table 1: This table discloses the 338 compounds T1.1 to T1.338 of the formula



In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

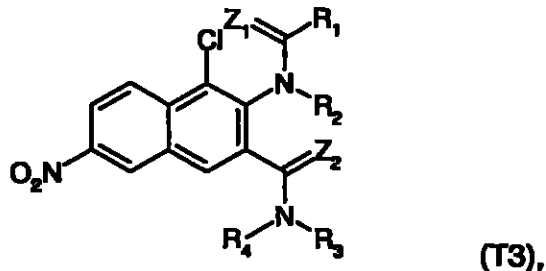
For example, the specific compound T1.23 is the compound of the formula T1, in which each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the line A.23 of the Table A. According to the same system, also all of the other 337 specific compounds disclosed in the Table 1 as well as all of the specific compounds disclosed in the Tables 2 to 85 are specified analogously.

Table 2: This table discloses the 338 compounds T2.1 to T2.338 of the formula



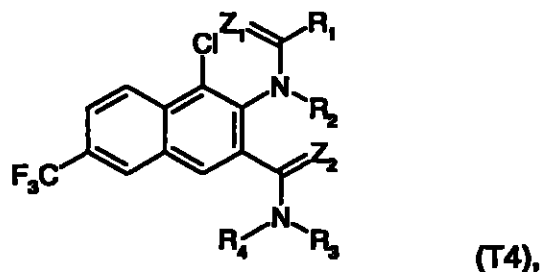
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 3: This table discloses the 338 compounds T3.1 to T3.338 of the formula



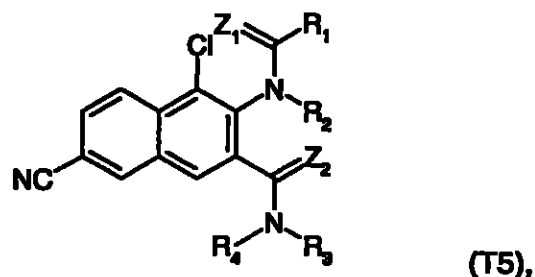
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 4: This table discloses the 338 compounds T4.1 to T4.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

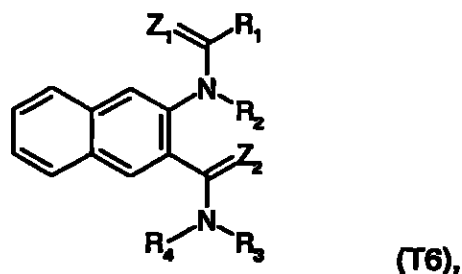
Table 5: This table discloses the 338 compounds T5.1 to T5.338 of the formula



In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

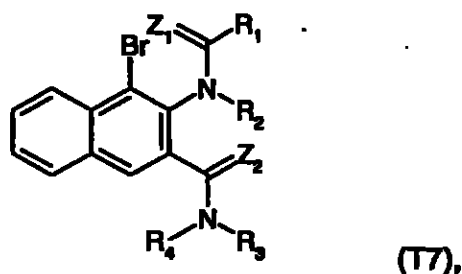
87
181

Table 6: This table discloses the 338 compounds T6.1 to T6.338 of the formula



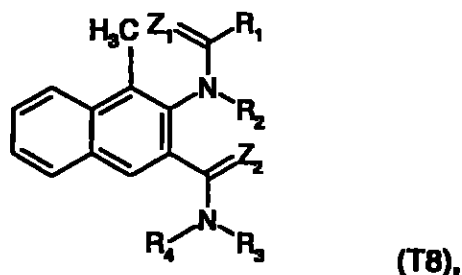
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 7: This table discloses the 338 compounds T7.1 to T7.338 of the formula



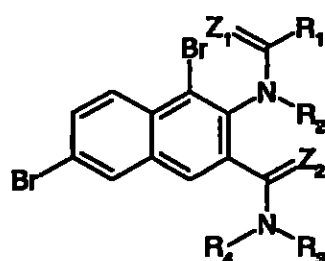
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 8: This table discloses the 338 compounds T8.1 to T8.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

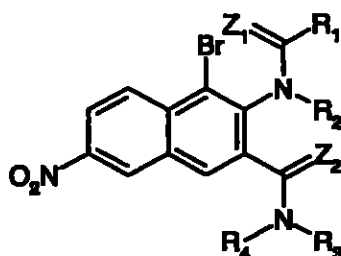
Table 9: This table discloses the 338 compounds T9.1 to T9.338 of the formula



(T9),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

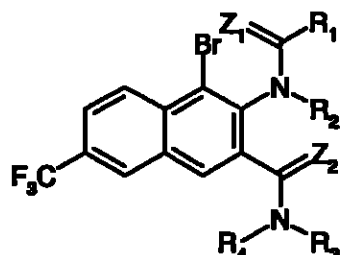
Table 10: This table discloses the 338 compounds T10.1 to T10.338 of the formula



(T10),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

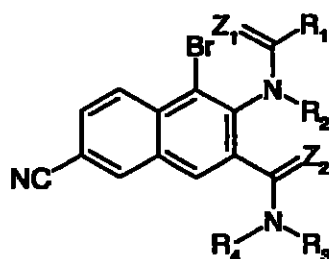
Table 11: This table discloses the 338 compounds T11.1 to T11.338 of the formula



(T11),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

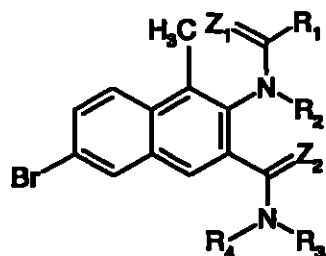
Table 12: This table discloses the 338 compounds T12.1 to T12.338 of the formula



(T12),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

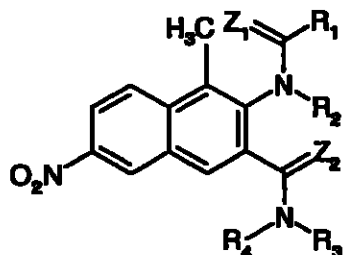
Table 13: This table discloses the 338 compounds T13.1 to T13.338 of the formula



(T13),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

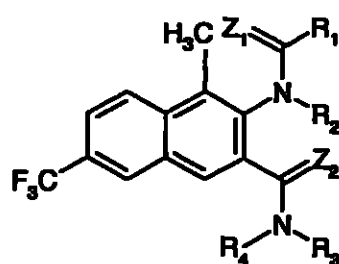
Table 14: This table discloses the 338 compounds T14.1 to T14.338 of the formula



(T14),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

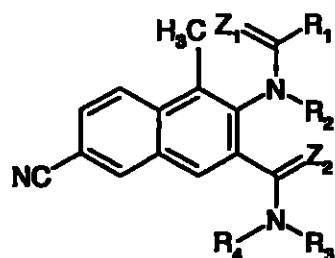
Table 15: This table discloses the 338 compounds T15.1 to T15.338 of the formula



(T15),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

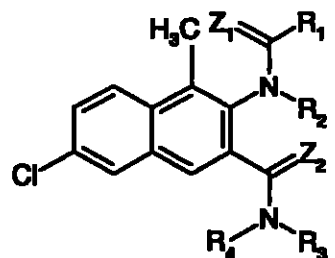
Table 16: This table discloses the 338 compounds T16.1 to T16.338 of the formula



(T16),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 17: This table discloses the 338 compounds T17.1 to T17.338 of the formula



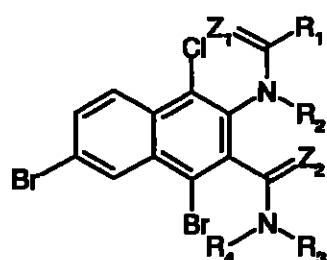
(T17),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 18: This table discloses the 338 compounds T18.1 to T18.338 of the formula

185
185

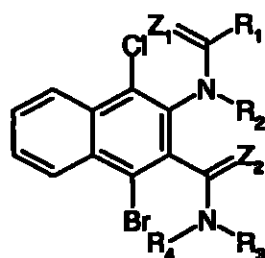
- 167 -



(T18),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

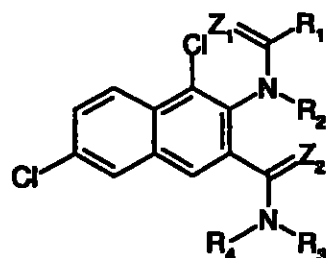
Table 19: This table discloses the 338 compounds T19.1 to T19.338 of the formula



(T19),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

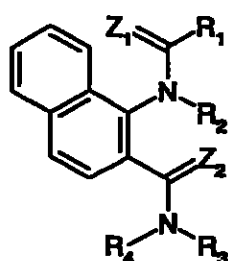
Table 20: This table discloses the 338 compounds T20.1 to T20.338 of the formula



(T20),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

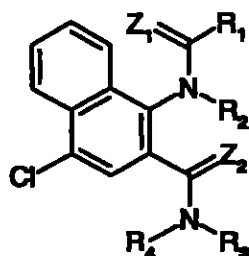
Table 21: This table discloses the 338 compounds T21.1 to T21.338 of the formula



(T21),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

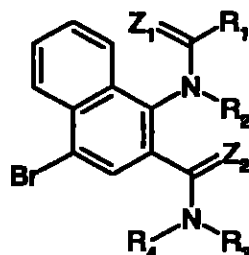
Table 22: This table discloses the 338 compounds T22.1 to T22.338 of the formula



(T22),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 23: This table discloses the 338 compounds T23.1 to T23.338 of the formula



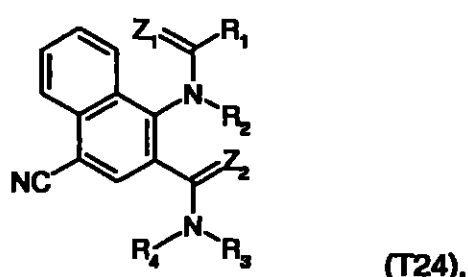
(T23),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 24: This table discloses the 338 compounds T24.1 to T24.338 of the formula

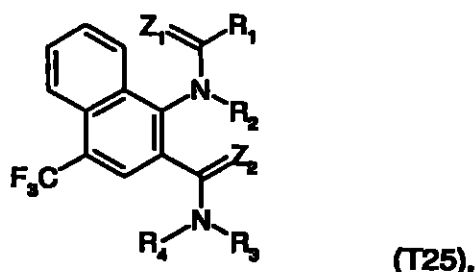
187
187

- 169 -



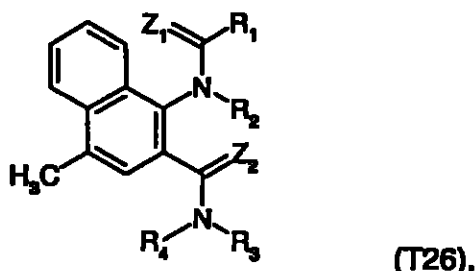
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 25: This table discloses the 338 compounds T25.1 to T25.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 26: This table discloses the 338 compounds T26.1 to T26.338 of the formula

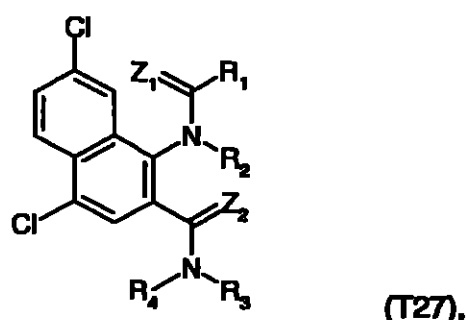


in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 27: This table discloses the 338 compounds T27.1 to T27.338 of the formula

188
198

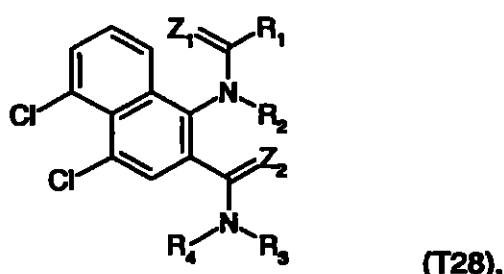
- 170 -



(T27),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

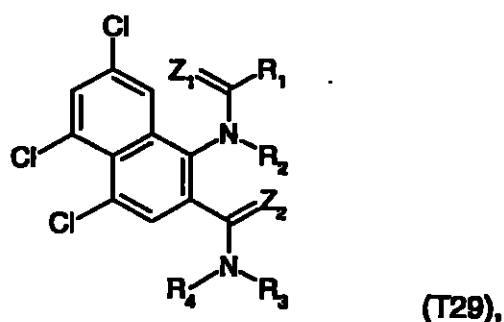
Table 28: This table discloses the 338 compounds T28.1 to T28.338 of the formula



(T28),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

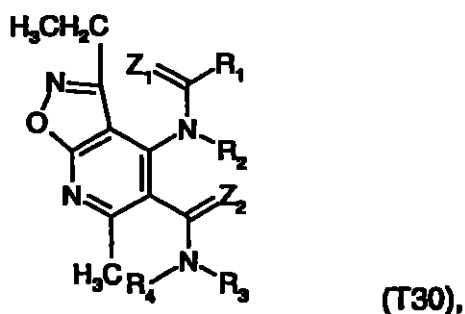
Table 29: This table discloses the 338 compounds T29.1 to T29.338 of the formula



(T29),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

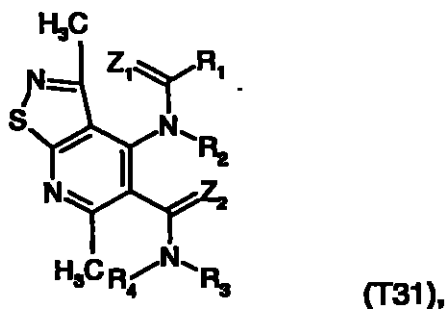
Table 30: This table discloses the 338 compounds T30.1 to T30.338 of the formula



(T30),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

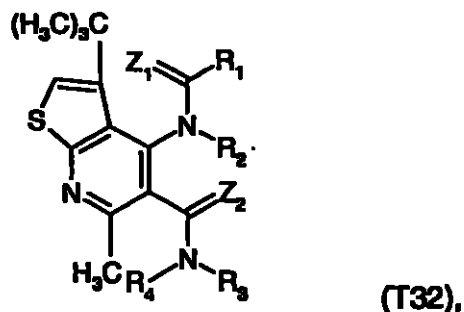
Table 31: This table discloses the 338 compounds T31.1 to T31.338 of the formula



(T31),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

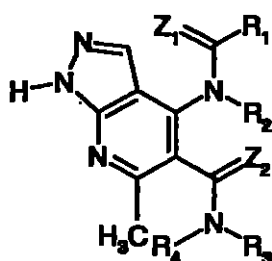
Table 32: This table discloses the 338 compounds T32.1 to T32.338 of the formula



(T32),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

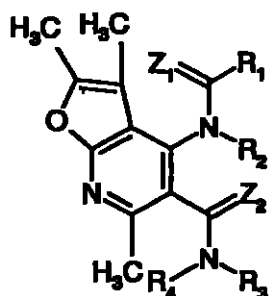
Table 33: This table discloses the 338 compounds T33.1 to T33.338 of the formula



(T33),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

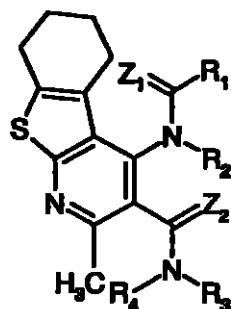
Table 34: This table discloses the 338 compounds T34.1 to T34.338 of the formula



(T34),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

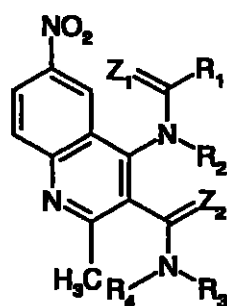
Table 35: This table discloses the 338 compounds T35.1 to T35.338 of the formula



(T35),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

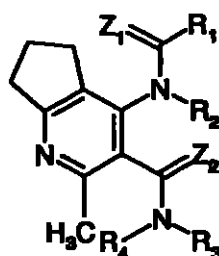
Table 36: This table discloses the 338 compounds T36.1 to T36.338 of the formula

181
1a1

(T36),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

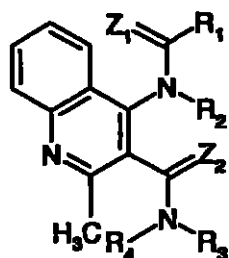
Table 37: This table discloses the 338 compounds T37.1 to T37.338 of the formula



(T37),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

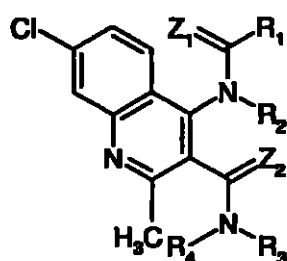
Table 38: This table discloses the 338 compounds T38.1 to T38.338 of the formula



(T38),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

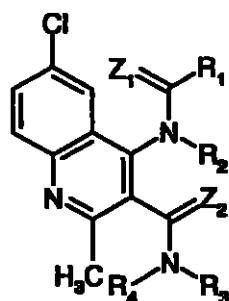
Table 39: This table discloses the 338 compounds T39.1 to T39.338 of the formula



(T39),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

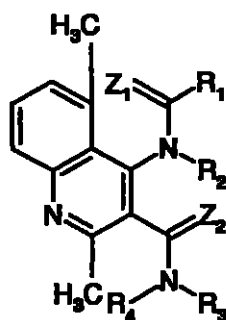
Table 40: This table discloses the 338 compounds T40.1 to T40.338 of the formula



(T40),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

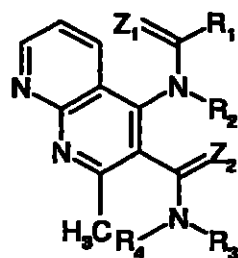
Table 41: This table discloses the 338 compounds T41.1 to T41.338 of the formula



(T41),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

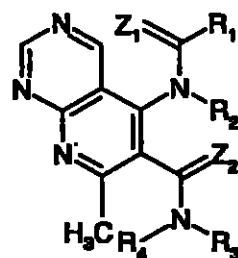
Table 42: This table discloses the 338 compounds T42.1 to T42.338 of the formula



(T42),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

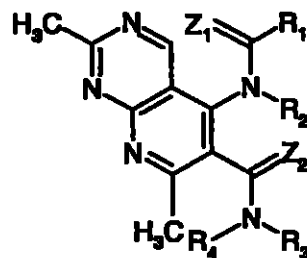
Table 43: This table discloses the 338 compounds T43.1 to T43.338 of the formula



(T43),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

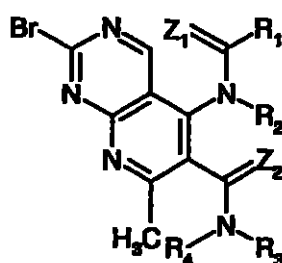
Table 44: This table discloses the 338 compounds T44.1 to T44.338 of the formula



(T44),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

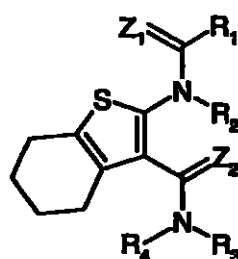
Table 45: This table discloses the 338 compounds T45.1 to T45.338 of the formula



(T45),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

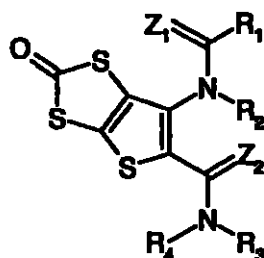
Table 46: This table discloses the 338 compounds T46.1 to T46.338 of the formula



(T46),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

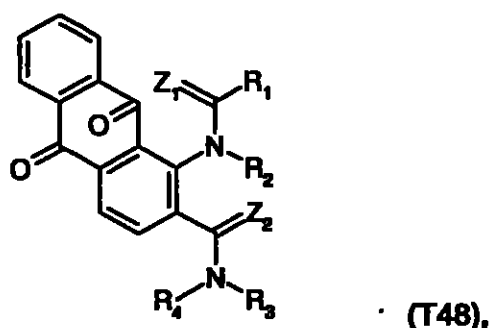
Table 47: This table discloses the 338 compounds T47.1 to T47.338 of the formula



(T47),

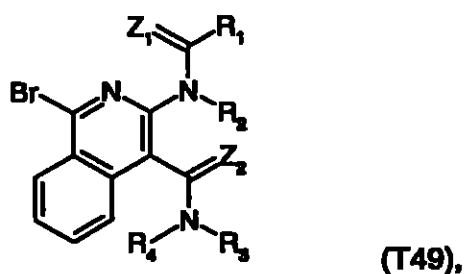
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 48: This table discloses the 338 compounds T48.1 to T48.338 of the formula



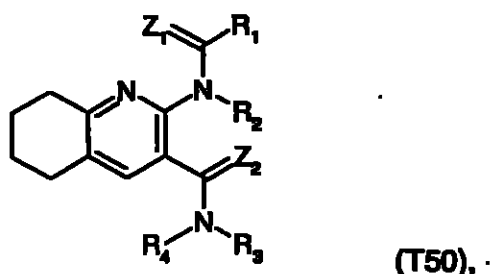
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 49: This table discloses the 338 compounds T49.1 to T49.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 50: This table discloses the 338 compounds T50.1 to T50.338 of the formula

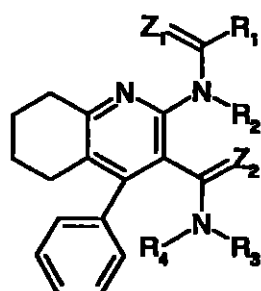


in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 51: This table discloses the 338 compounds T51.1 to T51.338 of the formula

195
196

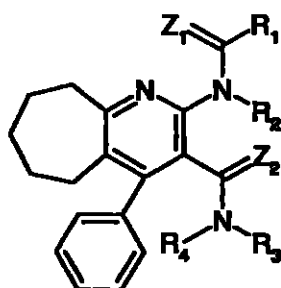
- 178 -



(T51),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

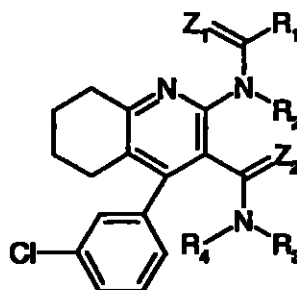
Table 52: This table discloses the 338 compounds T52.1 to T52.338 of the formula



(T52),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 53: This table discloses the 338 compounds T53.1 to T53.338 of the formula



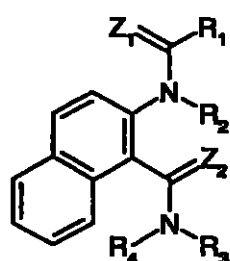
(T53),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 54: This table discloses the 338 compounds T54.1 to T54.338 of the formula

197
197

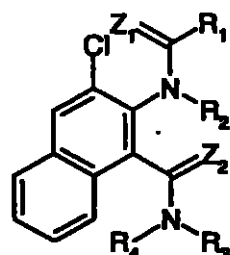
- 179 -



(T54),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

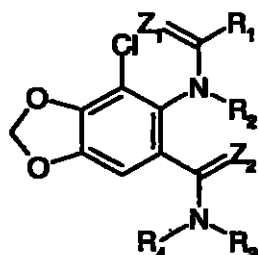
Table 55: This table discloses the 338 compounds T55.1 to T55.338 of the formula



(T55),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

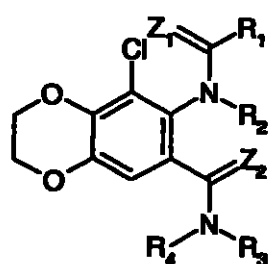
Table 56: This table discloses the 338 compounds T56.1 to T56.338 of the formula



(T56),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

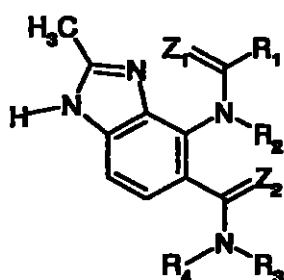
Table 57: This table discloses the 338 compounds T57.1 to T57.338 of the formula

198
198

(T57),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

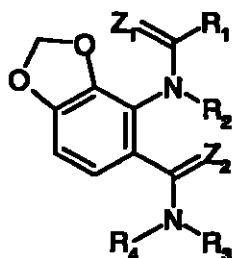
Table 58: This table discloses the 338 compounds T58.1 to T58.338 of the formula



(T58),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 59: This table discloses the 338 compounds T59.1 to T59.338 of the formula



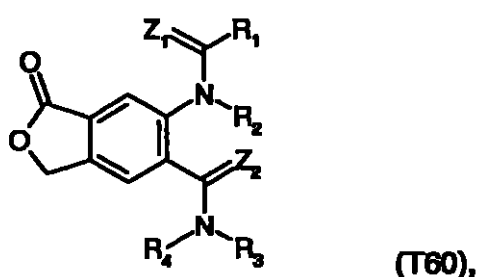
(T59),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 60: This table discloses the 338 compounds T60.1 to T60.338 of the formula

187
199

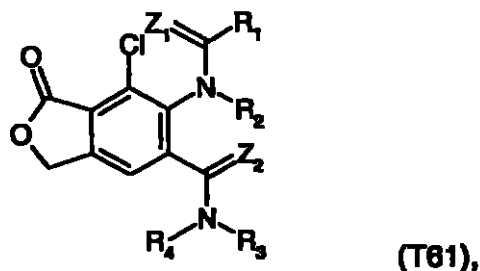
- 181 -



(T60),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

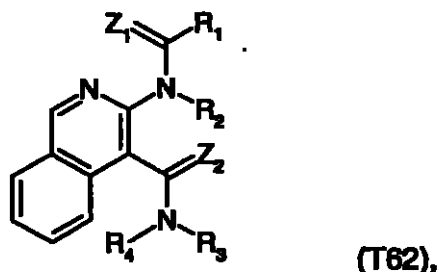
Table 61: This table discloses the 338 compounds T61.1 to T61.338 of the formula



(T61),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

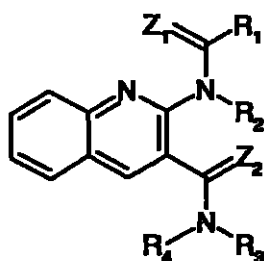
Table 62: This table discloses the 338 compounds T62.1 to T62.338 of the formula



(T62),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

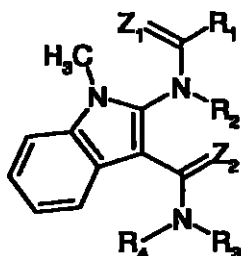
Table 63: This table discloses the 338 compounds T63.1 to T63.338 of the formula



(T63),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

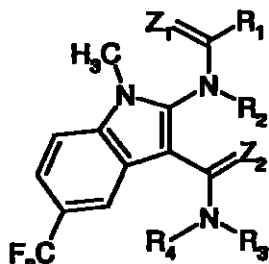
Table 64: This table discloses the 338 compounds T64.1 to T64.338 of the formula



(T64),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

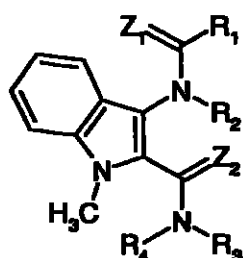
Table 65: This table discloses the 338 compounds T65.1 to T65.338 of the formula



(T65),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

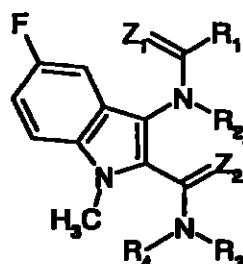
Table 66: This table discloses the 338 compounds T66.1 to T66.338 of the formula



(T66),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

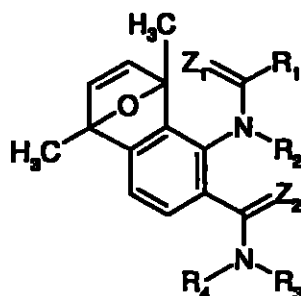
Table 67: This table discloses the 338 compounds T67.1 to T67.338 of the formula



(T67),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

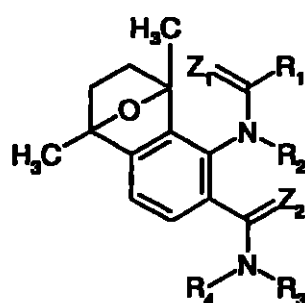
Table 68: This table discloses the 338 compounds T68.1 to T68.338 of the formula



(T68),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

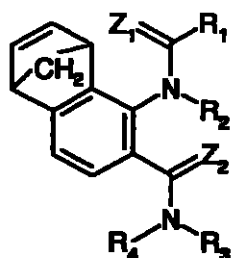
Table 69: This table discloses the 338 compounds T69.1 to T69.338 of the formula



(T69),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

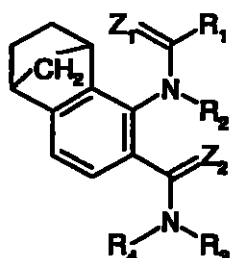
Table 70: This table discloses the 338 compounds T70.1 to T70.338 of the formula



(T70),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 71: This table discloses the 338 compounds T71.1 to T71.338 of the formula

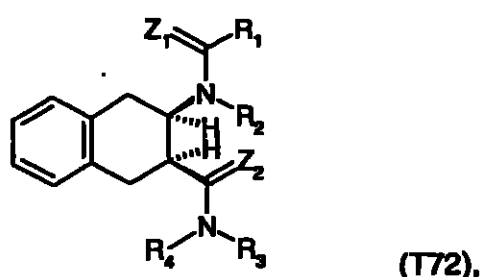


(T71),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 72: This table discloses the 338 compounds T72.1 to T72.338 of the formula

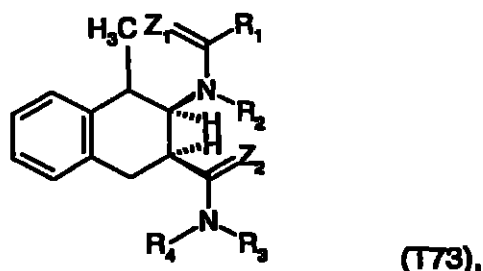
- 185 -



(T72),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

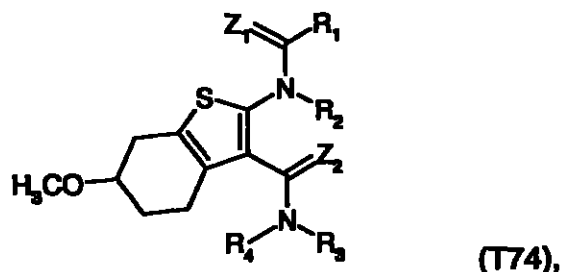
Table 73: This table discloses the 338 compounds T73.1 to T73.338 of the formula



(T73),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

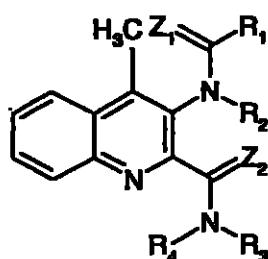
Table 74: This table discloses the 338 compounds T74.1 to T74.338 of the formula



(T74),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

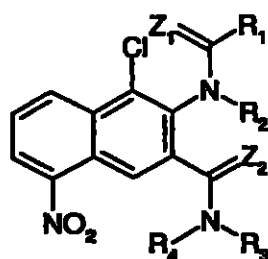
Table 75: This table discloses the 338 compounds T75.1 to T75.338 of the formula



(T75),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

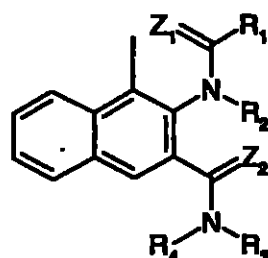
Table 76: This table discloses the 338 compounds T76.1 to T76.338 of the formula



(T76),

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 77: This table discloses the 338 compounds T77.1 to T77.338 of the formula



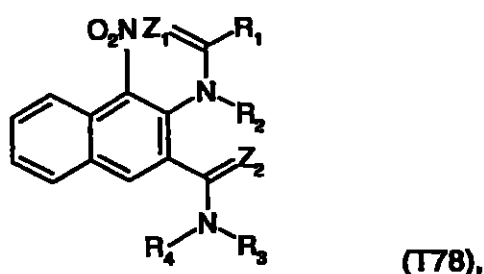
(T77),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 78: This table discloses the 338 compounds T78.1 to T78.338 of the formula

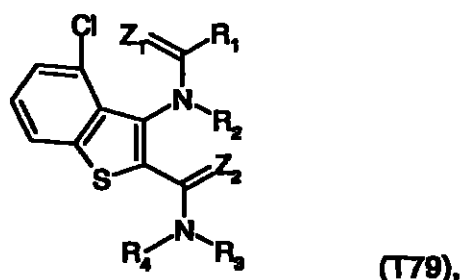
205
295

- 187 -



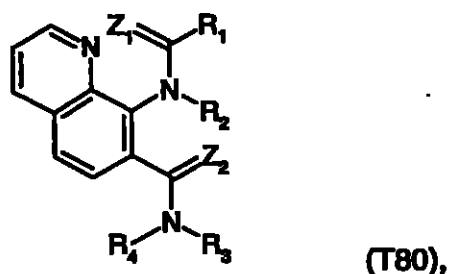
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 79: This table discloses the 338 compounds T79.1 to T79.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 80: This table discloses the 338 compounds T80.1 to T80.338 of the formula

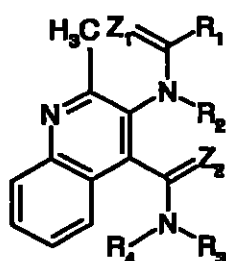


in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 81: This table discloses the 338 compounds T81.1 to T81.338 of the formula

206
206

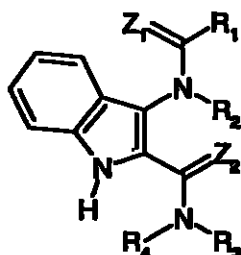
- 188 -



(T81).

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

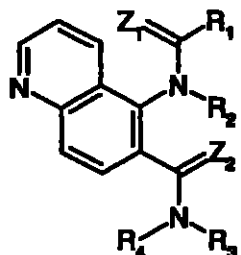
Table 82: This table discloses the 338 compounds T82.1 to T82.338 of the formula



(T82).

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 83: This table discloses the 338 compounds T83.1 to T83.338 of the formula



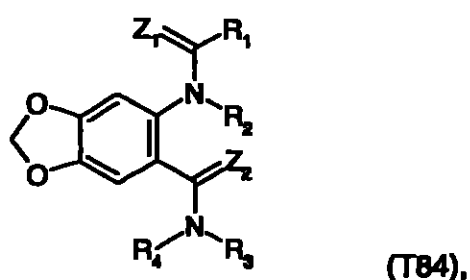
(T83).

In which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 84: This table discloses the 338 compounds T84.1 to T84.338 of the formula

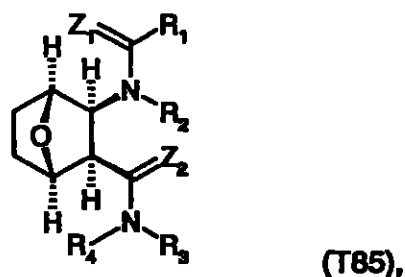
207
207

- 189 -



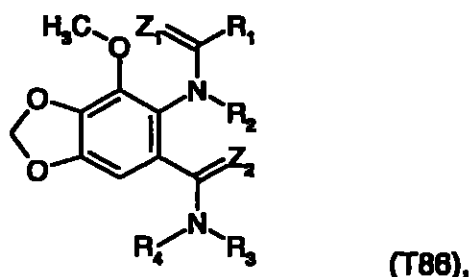
in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 85: This table discloses the 338 compounds T85.1 to T85.338 of the formula



in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 86: This table discloses the 338 compounds T86.1 to T86.338 of the formula

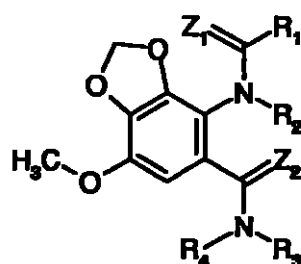


in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 87: This table discloses the 338 compounds T87.1 to T87.338 of the formula

208
298

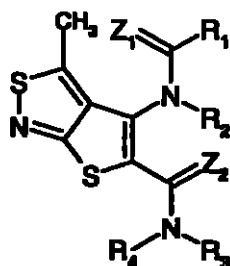
- 190 -



(T87),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

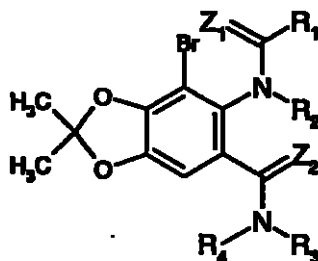
Table 88: This table discloses the 338 compounds T88.1 to T88.338 of the formula



(T88),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 89: This table discloses the 338 compounds T89.1 to T89.338 of the formula



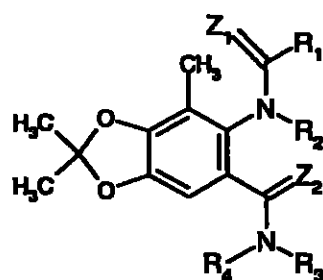
(T89),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 90: This table discloses the 338 compounds T90.1 to T90.338 of the formula

209
201

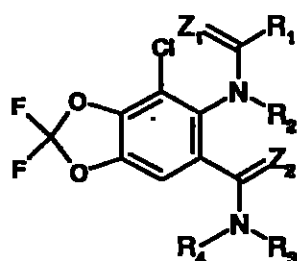
- 191 -



(T90),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Table 91: This table discloses the 338 compounds T91.1 to T91.338 of the formula



(T91),

in which, for each of these 338 specific compounds, each of the variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 has the specific meaning given in the corresponding line, appropriately selected from the 338 lines A.1 to A.338, of the Table A.

Formulation Examples (% = per cent by weight)

Example F1: Emulsion concentrates

	a)	b)	c)
Active Ingredient	25 %	40 %	50 %
Calcium dodecylbenzenesulfonate	5 %	8 %	6 %
Castor oil polyethylene glycol ether (36 mol of EO)	5 %	-	-
Tributylphenoxypolyethylene glycol ether (30 mol of EO)	-	12 %	4 %
Cyclohexanone	-	15 %	20 %
Xylene mixture	65 %	25 %	20 %

Emulsions of any desired concentration can be prepared from such concentrates by dilution with water.

Example F2: Solutions

	a)	b)	c)	d)
Active ingredient	80 %	10 %	5 %	95 %
Ethylene glycol monomethyl ether	20 %	-	-	-
Polyethylene glycol MW 400	-	70 %	-	-
N-Methylpyrrolid-2-one	-	20 %	-	-
Epoxidized coconut oil	-	-	1 %	5 %
Petroleum ether (boiling range: 160-190°)	-	-	94 %	-

The solutions are suitable for use in the form of microdrops.

Example F3: Granules

	a)	b)	c)	d)
Active ingredient	5 %	10 %	8 %	21 %
Kaolin	94 %	-	79 %	54 %
Highly disperse silica	1 %	-	13 %	7 %
Attapulgate	-	90 %	-	18 %

The active ingredient is dissolved in dichloromethane, the solution is sprayed onto the carrier(s), and the solvent is subsequently evaporated in vacuo.

Example F4: Dusts

	a)	b)
Active ingredient	2 %	5 %
Highly disperse silica	1 %	5 %
Talc	97 %	-
Kaolin	-	90 %

Ready-to-use dusts are obtained by intimately mixing the carriers and the active ingredient.

Example F5: Wettable powders

	a)	b)	c)
Active ingredient	25 %	50 %	75 %
Sodium lignosulfonate	5 %	5 %	-
Sodium lauryl sulfate	3 %	-	5 %
Sodium diisobutyl-naphthalenesulfonate	-	6 %	10 %
Octylphenoxy-polyethylene glycol ether (7-8 mol of EO)	-	2 %	-

Highly disperse silica	5 %	10 %	10 %
Kaolin	62 %	27 %	-

The active ingredient is mixed with the additives and the mixture is ground thoroughly in a suitable mill. This gives wettable powders, which can be diluted with water to give suspensions of any desired concentration.

Example F6: Extruder granules

Active ingredient	10 %
Sodium lignosulfonate	2 %
Carboxymethylcellulose	1 %
Kaolin	87 %

The active ingredient is mixed with the additives, and the mixture is ground, moistened with water, extruded, granulated and dried in a stream of air.

Example F7: Coated granules

Active ingredient	3 %
Polyethylene glycol (MW 200)	3 %
Kaolin	94 %

In a mixer, the finely ground active ingredient is applied uniformly to the kaolin, which has been moistened with the polyethylene glycol. This gives dust-free coated granules.

Example F8: Suspension concentrate

Active ingredient	40 %
Ethylene glycol	10 %
Nonylphenoxypolyethylene glycol ether (15 mol of EO)	6 %
Sodium lignosulfonate	10 %
Carboxymethylcellulose	1 %
37 % aqueous formaldehyde solution	0.2 %
Silicone oil (75 % aqueous emulsion)	0.8 %
Water	32 %

The finely ground active ingredient is mixed intimately with the additives. Suspensions of any desired concentration can be prepared from the thus resulting suspension concentrate by dilution with water.

Biological Examples (% = per cent by weight, unless otherwise specified)

Example B1: Activity against Aphis craccivora

Pea seedlings are infected with *Aphis craccivora*, subsequently sprayed with a spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and then incubated at 20°. 3 and 6 days later, the percentage reduction in the population (% activity) is determined by comparing the number of dead aphids between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity.

Example B2: Activity against Diabrotica balteata

Maize seedlings are sprayed with an aqueous emulsion spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and, after the spray coating has dried on, populated with 10 larvae (2nd instar) of *Diabrotica balteata* and introduced into a plastic container. 6 days later, the percentage reduction in the population (% activity) is determined by comparing the number of dead larvae between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1, T1.3, T7.1 and T7.3 have an activity of over 80 %.

Example B3: Activity against Heliothis virescens (foliar application)

Young soya plants are sprayed with an aqueous emulsion spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and, after the spray coating has dried on, populated with 10 caterpillars (1st instar) of *Heliothis virescens* and introduced into a plastic container. 6 days later, the percentage reduction in the population and in the feeding damage (% activity) are determined by comparing the number of dead caterpillars and the feeding damage between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T79.1, T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 and T9.2 have an activity of over 80 %.

Example B4: Activity against Heliothis virescens (application to eggs)

2/3
2/3

Heliothis virescens eggs, which have been deposited on cotton, are sprayed with an aqueous emulsion spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient. After 8 days, the percentage hatching rate of the eggs and the survival rate of the caterpillars (% activity) are evaluated in comparison with untreated control batches.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T79.1, T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 and T9.2 have an activity of over 80 %.

Example B5: Activity against *Myzus persicae* (foliar application)

Pea seedlings are infected with *Myzus persicae*, subsequently sprayed with a spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and then incubated at 20°. 3 and 6 days later, the percentage reduction in the population (% activity) is determined by comparing the number of dead aphids between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1 and T7.1 have an activity of over 80 %.

Example B6: Activity against *Myzus persicae* (systemic application)

Pea seedlings are infected with *Myzus persicae*, and their roots are subsequently placed into a spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient. The seedlings are then incubated at 20°. 3 and 6 days later, the percentage reduction in the population (% activity) is determined by comparing the number of dead aphids between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity.

Example B7: Activity against *Plutella xylostella*

Young cabbage plants are sprayed with an aqueous emulsion spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and, after the spray coating has dried on, populated with 10 caterpillars (3rd instar) of *Plutella xylostella* and introduced into a plastic container. 3 days later, the percentage reduction in the population and in the feeding damage (% activity) are determined by comparing the number of dead caterpillars and the feeding damage between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T22.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T78.1, T79.1,

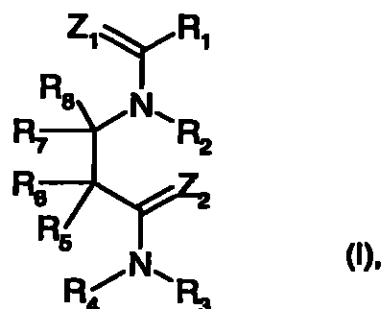
314
214

T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 and T9.2 have an activity of over 80 %.

Example B8: Activity against *Spodoptera littoralis*

Young soya plants are sprayed with an aqueous emulsion spray mixture comprising 400 ppm of active ingredient and, after the spray coating has dried on, populated with 10 caterpillars (1st instar) of *Spodoptera littoralis* and introduced into a plastic container. 3 days later, the percentage reduction in the population and in the feeding damage (% activity) are determined by comparing the number of dead caterpillars and the feeding damage between the treated and untreated plants.

In this test, compounds listed in the Tables 1 to 85 show good activity. In particular, the compounds T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 and T9.2 have an activity of over 80 %.

What is claimed is:**1. A compound of the formula**

in which

Z₁ is an oxygen atom; or a sulfur atom;

Z₂ is an oxygen atom; or a sulfur atom;

R₁ is an aryl or heteroaryl group, which is unsubstituted or substituted;

R₂ is hydrogen; or an organic substituent;

R₃ is hydrogen; or an organic substituent;

R₄ is hydrogen; or an organic substituent;

or R₃ and R₄, taken together, form, together with the nitrogen atom, to which they are attached, a ring, which is unsubstituted or substituted;

R₅ is hydrogen; or an unsubstituted or substituted alkyl group; or forms, taken together with R₆ or with a monovalent substituent attached to that atom of R₆, via which atom R₆ is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R₅, one additional bond;

R₆ and R₇, taken together, form, together with the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms they are attached, a bicyclic ring system, which ring system is carbocyclic or heterocyclic, which ring system is substituted, in the manner shown in the formula I, by the four substituents -N(R₂)-C(=Z₁)-R₁, -C(=Z₂)-N(R₃)-R₄, R₅ and R₈, and which ring system is optionally further substituted;

and R₈ is hydrogen; or an unsubstituted or substituted alkyl group; or forms, taken together with R₅ or with a monovalent substituent attached to that atom of R₇, via which atom R₇ is directly connected with the carbon atom, shown in the formula I, which carries R₈, one additional bond,

or, where appropriate, a tautomer thereof, in each case in free form or in salt form.

216

2. A compound according to claim 1 of the formula I, in which Z₁ is an oxygen atom, or, where appropriate, a tautomer thereof.
3. A compound according to claim 1 of the formula I, in which Z₂ is an oxygen atom, or, where appropriate, a tautomer thereof.
4. A compound according to claim 1 of the formula I, in which R₁ is a phenyl, pyridyl or pyrazolyl group, which is unsubstituted or substituted, or, where appropriate, a tautomer thereof.
5. A compound according to claim 4 of the formula I, in which R₁ is a pyrazol-5-yl group, which is substituted in the 3-position by halogen, halo-C₁-C₆alkyl or halo-C₁-C₆alkoxy and in the 1-position by a pyrid-2-yl group, which group is substituted in the 3-position by chlorine or bromine, or, where appropriate, a tautomer thereof.
6. A compound according to claim 1 of the formula I, in which R₂ is hydrogen or C₁-C₆alkyl, or, where appropriate, a tautomer thereof.
7. A compound according to claim 1 of the formula I, in which R₃ is hydrogen or C₁-C₆alkyl, or, where appropriate, a tautomer thereof.
8. A compound according to claim 1 of the formula I, in which R₄ is C₁-C₆alkyl, or, where appropriate, a tautomer thereof.
9. A compound according to claim 1 of the formula I, in which R₅ and R₆, taken together, are a bond, or, where appropriate, a tautomer thereof.
10. A compound according to claim 1 of the formula I, in which the two carbon atoms, shown in the formula I, to which atoms R₆ and R₇ are attached, are two ring members of an aromatic ring, or, where appropriate, a tautomer thereof.
11. A pesticidal composition, which comprises at least one compound according to claim 1 of the formula I or, where appropriate, a tautomer thereof, in each case in free form or in agrochemically utilizable salt form, as active ingredient and at least one auxiliary.

2/7
27

12. A composition according to claim 11 for controlling insects or representatives of the order Acarina.

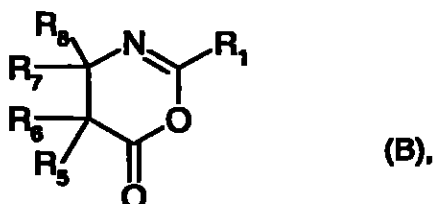
13. A method for controlling pests, which comprises applying a composition according to claim 11 to the pests or their environment.

14. A method according to claim 13 for controlling insects or representatives of the order Acarina.

15. A method according to claim 13 for the protection of plant propagation material from the attack by pests, which comprises treating the propagation material or the site, where the propagation material is planted.

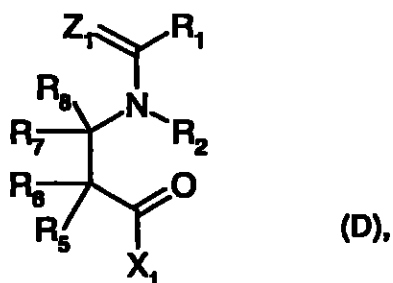
16. Plant propagation material treated in accordance with the method described in claim 15.

17. A compound of the formula B



in which R_1 , R_5 , R_6 , R_7 and R_8 have the meanings given in claim 1 for the formula I, or, where appropriate, a tautomer thereof, in each case in free form or in salt form.

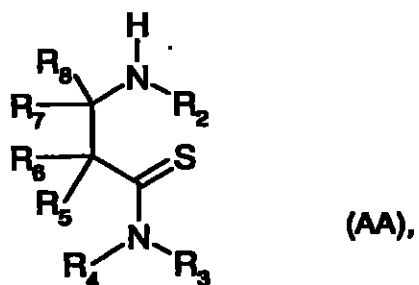
18. A compound of the formula D



In which Z_1 , R_1 , R_2 , R_5 , R_6 , R_7 and R_8 have the meanings given in claim 1 for the formula I; and R is OH, C_1 - C_4 alkoxy or Cl, or, where appropriate, a tautomer thereof, in each case in free form or in salt form.

218
219

19. A compound of the formula AA



in which R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇ and R₈ have the meanings given in claim 1 for the formula I, or, where appropriate, a tautomer thereof, in each case in free form or in salt form.

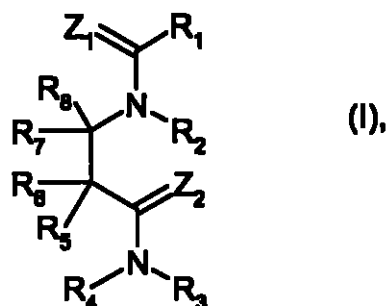
Insecticidas Nuevos

La presente invención se refiere a derivados bicíclicos de bisamida, a los procesos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos, y a su uso para controlar insectos o representantes del orden Acarina.

Los derivados de bisamida que tienen acción insecticida son conocidos y descritos, por ejemplo, en US 2003/0229050.

Se han encontrado ahora derivados bicíclicos de bisamida nuevos que poseen propiedades pesticidas.

La presente invención, consecuentemente, se relaciona con compuestos de la fórmula I



en la cual,

Z₁ es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

Z₂ es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

R₁ es un grupo arílico o heteroarílico, el cual es no sustituido o sustituido;

R₂ es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

R₃ es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

R₄ es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

o R₃ y R₄, tomados juntos, forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo, el cual está no sustituido o sustituido;

R₅ es hidrógeno; o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, tomado de manera conjunta con R₈ o con un sustituyente monovalente unido a

ese átomo de R_6 , a través del cual el átomo R_6 está directamente conectado con el átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, el que porta R_5 , un enlace adicional;

R_6 y R_7 , tomados de manera conjunta, forman, junto con los dos átomos de carbono, como se muestra en la fórmula I, a los cuales están unidos, un sistema de anillos bicíclicos, dicho sistema de anillos es carbocíclico o heterocíclico, sistema de anillos el cual está sustituido, de la manera en que se describe en la fórmula I, con los cuatro sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$, $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$, R_5 y R_6 , y dicho sistema de anillos está además opcionalmente sustituido;

y R_8 es hidrógeno; o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, tomado de manera conjunta con R_5 o con un sustituyente monovalente ligado a ese átomo de R_7 , a través del cual R_7 está directamente conectado al átomo de carbono, señalado en la fórmula I, el cual porta a R_6 , un enlace adicional, en forma libre o en forma de sal, donde es apropiado a los tautómeros, en forma libre o en forma de sal, de estos compuestos, a un proceso para la preparación y al uso de estos compuestos y tautómeros, a las composiciones pesticidas cuyo ingrediente activo se selecciona entre estos compuestos y tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, a un proceso para la preparación y al uso de estas composiciones, a material de propagación vegetal tratado con estas composiciones, a un método para controlar plagas con estos ingredientes activos y composiciones, a intermediarios, en forma libre o en forma de sal, para la preparación de estos compuestos, donde sea apropiado a los tautómeros, en forma libre o en forma de sal, de estos intermediarios, y a un proceso de preparación y al uso de estos intermediarios.

En algunos casos, los compuestos de fórmula I pueden existir en forma de tautómeros. Por ejemplo, si en los compuestos de fórmula I el sustituyente -

221
221

$N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ es $-N(R_2)-C(=O)-R_1$ y R_2 es hidrógeno, los compuestos correspondientes de fórmula I, es decir, aquellos en los cuales $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ es $-N(H)-C(=O)-R_1$, pueden estar en equilibrio con los respectivos tautómeros, en los cuales el sustituyente respectivo tiene la estructura tautomérica $-N=C(OH)-R_1$. Consecuentemente, los compuestos de la fórmula I arriba mencionados y abajo mencionados deben entenderse como incluyendo tales tautómeros, donde sea apropiado, aunque los últimos no sean mencionados específicamente en cada caso individual.

Los compuestos de fórmula I que tienen por lo menos un centro básico pueden formar, por mencionar uno, sales con adición de ácido, por ejemplo con ácidos fuertes inorgánicos tales como los ácidos minerales, por ejemplo ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido nitroso, un ácido fosfórico o un ácido hidrohálico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como los ácidos alcanocarboxílicos C_1-C_4 que están no sustituidos o sustituidos, por ejemplo con halógeno, por ejemplo ácido acético, tales como ácidos dicarboxílicos saturados o no saturados, por ejemplo ácido oxálico, ácido malónico, ácido succínico, ácido maleico, ácido fumárico o ácido ftálico, tales como los ácidos hidroxicarboxílicos, por ejemplo el ácido ascórbico, el ácido láctico, el ácido málico, el ácido tartárico o el ácido cítrico, o tales como el ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos alcan C_1-C_4 - o arilsulfónicos que están no sustituidos o sustituidos, por ejemplo con halógeno, por ejemplo ácido metan- o p-toluensulfónico. Los compuestos de la fórmula I que tengan al menos un grupo ácido pueden formar, por ejemplo, sales con bases, por ejemplo sales minerales tales como sales de metal alcalino o alcalinotérreo, por ejemplo las sales de sodio, de potasio y de magnesio, o sales con amoníaco o una amina orgánica, tales como la morfolina, piperidina, pirrolidina, una mono-, di- o trialkilamina inferior, por ejemplo etil-, dietil-, trietil- o dimetilpropilamina, o una mono-, di-, o

trihidroxi-alquilamina inferior, por ejemplo mono-, di- o trietanolamina. Donde sea apropiado, las sales internas correspondientes pueden además formarse. Las sales agroquímicamente favorables son las preferidas dentro del alcance de la invención. Sin embargo, la invención también abarca sales que presentan desventajas para el uso agroquímico, por ejemplo sales que son tóxicas para las abejas o para los peces, y que son utilizadas, por ejemplo, para el aislamiento o la purificación de los compuestos libres de la fórmula I o sales agroquímicamente utilizables de los mismos. Debido a la relación íntima entre los compuestos de la fórmula I en forma libre y en forma de sus sales, para los propósitos de la invención los compuestos de fórmula I libres o sus sales arriba mencionados y abajo mencionados deben ser entendidos respectivamente como incluyendo, donde sea apropiado, las sales correspondientes o los compuestos libres de la fórmula I. Lo mismo sucede, de manera análoga, con los tautómeros de los compuestos de la fórmula I y de las sales consecuentemente. En general, la forma libre es preferible en cada caso.

Preferentemente la invención se relaciona (2) a un compuesto conforme con (1) de fórmula I, en la cual

Z_1 es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

Z_2 es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

R_1 es un grupo fenilo o naftilo, el cual está sustituido independientemente con 1 o 2 sustituyentes R_a y de manera opcional luego sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes R_b .

R_a es ciano, nítro, halógeno, alquilo C_1-C_6 ; halo-alquilo C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 ; alquenilo C_1-C_6 ; haloalquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; haloalquinilo C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_6 ; halo-cicloalquilo C_3-C_6 ; hidroxí; alcoxi C_1-C_6 ; haloalcoxi C_1-C_6 ; cicloalcoxi C_3-C_6 ; mercapto; alquiltio C_1-C_6 ; halo-alquiltio C_1-C_6 ; alquilsulfinilo C_1-C_6 ; haloalquilsulfinilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; halo-

alquilsulfoniloC₁-C₆; amino; alquilamino C₁-C₆; haloalquilamino C₁-C₆; di-alquilamino C₁-C₆, en los cuales los dos grupos alquilo son lo mismo o diferente o, tomados de manera conjunta, forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y de 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y de manera opcional un heteroátomo más en el anillo, el cual luego reemplaza a un átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno. Dicho anillo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; di-(haloalquilC₁-C₆)-amino, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; cicloalquilamino C₃-C₆; N-(alquilC₁-C₆)-N-(cicloalquilC₃-C₆)-amino; carboxi; alcoxycarboniloC₁-C₆; haloalcoxycarboniloC₁-C₆; aminocarbonilo; alquilaminocarbonilo C₁-C₆; haloalquilaminocarbonilo C₁-C₆; di-alquilaminocarbonilo C₁-C₆, en el cual los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta, forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene un átomo de nitrógeno en el anillo y de 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y, de manera opcional, un heteroátomo más en el anillo, el que luego reemplaza a un átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno. Dicho anillo está no sustituido o sustituido de forma independiente con 1 a 4 sustituyentes, que son seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; di-(haloalquilC₁-C₆)-aminocarbonilo, en el que los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; alquilcarbonilo C₁-C₆; haloalquilcarbonilo C₁-C₆; o tri-alquilsililoC₁-C₆, en el cual los tres grupos alquilo son iguales o diferentes; o 2 sustituyentes R_a, que están ligados a átomos de carbono adyacentes, tomados de manera conjunta, son

$-(CH_2)_3$; $-(CH_2)_4$; $-(CH_2)_5$; $-(CH=CH)_2$; $-OCH_2O-$; $-O-(CH_2)_2O-$; $-OCF_2O-$; $-(CF_2)_2O-$; $-O-(CF_2)_2$; o $-O-(CF_2)_2O-$;

R_b es halógeno; alquilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; o un grupo fenilo, bencilo, fenoxi o heteroarilo monocíclico o bicíclico. Dicho grupo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, que son seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_a ;

o R_1 es un grupo heteroarilo monocíclico o bicíclico, que está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes R_c ;

R_c es un sustituyente R_a ; o un grupo fenilo, bencilo, benzilo, fenoxi o un grupo heteroarilo monocíclico o bicíclico, dicho grupo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, que son seleccionados del grupo, y que consisten en los sustituyentes R_a ;

R_2 es hidrógeno; un grupo alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 , dicho grupo está no sustituido o sustituido de forma independiente con uno o más sustituyentes, seleccionados del grupo, que consisten en los sustituyentes R_a ; un grupo $C(=O)R_d$; o un grupo $C(=S)R_d$;

R_d es un sustituyente R_1 ; alquilo C_1-C_6 ; haloalquilo C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; alquilo C_1-C_6 ; un grupo CH_2R_1 ; un grupo CH_2OR_1 ; un grupo CH_2SR_1 ; un grupo CH_2NHR_1 , dicho grupo es, de manera opcional, luego sustituido en el átomo de nitrógeno con alquilo C_1-C_6 o halo-alquilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 ; halo-alquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; halo-alquinilo C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_6 ; halo-cicloalquilo C_3-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; halo-alcoxi C_1-C_6 ; cicloalcoxi C_3-C_6 ; un grupo OR_1 ; alquiltio C_1-C_6 ; halo-alquiltio C_1-C_6 ; un grupo SR_1 ; alquilamino C_1-C_6 ; halo-alquilamino C_1-C_6 ; di-alquilamino C_1-C_6 , en el que los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 12

átomos de carbono en el anillo y, de manera opcional, un heteroátomo más en el anillo, el que luego reemplaza un átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno, dicho anillo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consisten en ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; di-(haloalquil C₁-C₆)amino, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; cicloalquilamino C₃-C₆; N-(alquil-C₁-C₆)-N-(cicloalquil-C₃-C₆)-amino; o un grupo NHR₁, dicho grupo está opcionalmente luego sustituido en el átomo de nitrógeno con alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

R₃ es hidrógeno; un grupo alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆, grupo que está no sustituido o sustituido independientemente con uno o más sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R₂; alcoxi C₁-C₆; halo-alcoxi C₁-C₆; cicloalcoxi C₃-C₆; alquiltio C₁-C₆; halo-alquiltio C₁-C₆; alquilamino C₁-C₆; halo-alquilamino C₁-C₆; di-alquilamino C₁-C₆, en el que los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta, forman, junto al átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y de forma opcional, 1 heteroátomo en el anillo adicional, el cual luego reemplaza 1 átomo de carbono en el anillo y se selecciona del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno, anillo el cual está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consisten en ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄; di-(haloalquil-C₁-C₆)amino, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; cicloalquilamino C₃-C₆; N-(alquilo-C₁-C₆)-N-(cicloalquilo C₃-C₆)-amino; alcoxycarbonilo C₁-C₆; halo-alcoxycarbonilo C₁-C₆; alquilcarbonilo C₁-C₆ o halo-alquilcarbonilo C₁-C₆;

226
226

R_4 es hidrógeno; un sustituyente R_1 ; un sustituyente R_6 ; un grupo alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 . Dicho grupo está no sustituido o sustituido de forma independiente con uno o más sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_6 , los sustituyentes R_6 y un grupo fenilo, benzilo, fenoxi o heteroarilo monocíclico o bicíclico. Dicho grupo está no sustituido o sustituido independientemente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_6 ; un grupo CH_2OR_1 ; un grupo CH_2SR_1 ; un grupo CH_2NHR_1 , dicho grupo es luego opcionalmente sustituido en el átomo de nitrógeno con alquilo C_1-C_6 o halo-alquilo C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; halo-alcoxi C_1-C_6 ; cicloalcoxi C_3-C_6 ; un grupo OR_1 ; alquiltio C_1-C_6 ; halo-alquiltio C_1-C_6 ; un grupo SR_1 ; alquilsulfinilo C_1-C_6 ; haloalquilsulfinilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; halo-alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alquilamino C_1-C_6 ; halo-alquilamino C_1-C_6 ; di-alquilamino C_1-C_6 , en el cual los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta forman, junto al átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y opcionalmente 1 heteroátomo más en el anillo, el cual luego reemplaza a 1 átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno. Dicho anillo está no sustituido o sustituido de forma independiente con 1 o 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consisten en ciano, nitro, halógeno alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 ; di-(haloalquil- C_1-C_6)amino, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; cicloalquilamino C_3-C_6 ; N-(alquil- C_1-C_6)-N-(cicloalquil- C_3-C_6)-amino; un grupo NHR_1 . Dicho grupo es, de manera opcional, luego sustituido en el átomo de nitrógeno con alquilo C_1-C_6 o halo-alquilo C_1-C_6 ; un grupo $C(=O)R_4$; un grupo $C(=O)R_6$; un grupo $C(=S)R_4$; o un grupo $C(=S)R_6$;

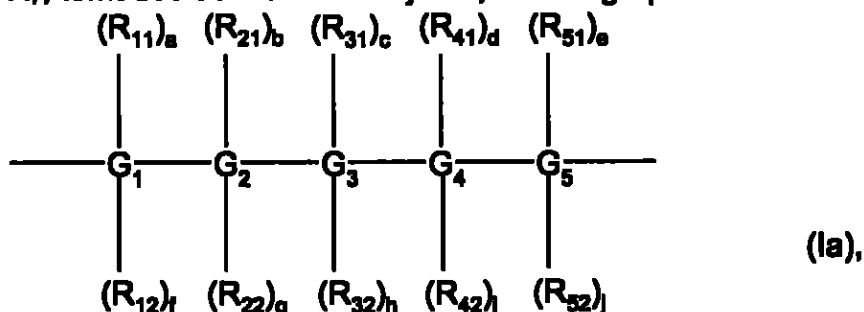
227
227

R_6 es un grupo carbocíclico o heterocíclico, dicho grupo es monocíclico o bicíclico y es no aromático. En dicho grupo 1 o 2 de los miembros del anillo son opcionalmente seleccionados del grupo, que consisten en los grupos $C(=O)$, $S(=O)$ and $S(=O)_2$, y dicho grupo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 o 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 ;

o R_3 y R_4 , tomados de manera conjunta, forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual se encuentran ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 6 átomos de carbono en el anillo y de manera opcional 1 heteroátomo más en el anillo, el que luego reemplaza a 1 átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno. Dicho anillo está no sustituido o sustituido de forma independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 ;

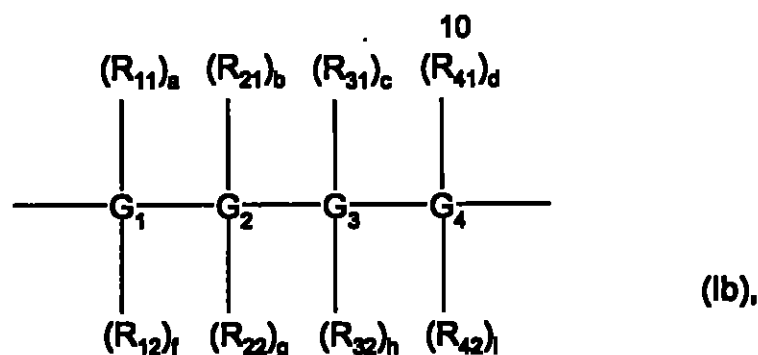
R_5 es hidrógeno; alquilo C_1-C_6 ; o halo-alquilo C_1-C_6 ; o tiene uno de los significados definidos a continuación;

R_6 y R_7 , tomados de manera conjunta, son un grupo de la fórmula

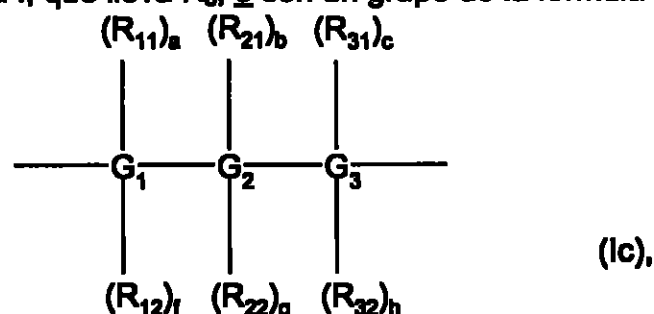


en la cual G_1 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_5 ; y en la cual G_5 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_6 ; o son un grupo de la fórmula

228
229



en la cual G_1 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_5 ; y en la cual G_4 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_6 ; $\underline{a}$ son un grupo de la fórmula



en la cual G_1 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_5 ; y en la cual G_3 está ligado al átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_6 ;

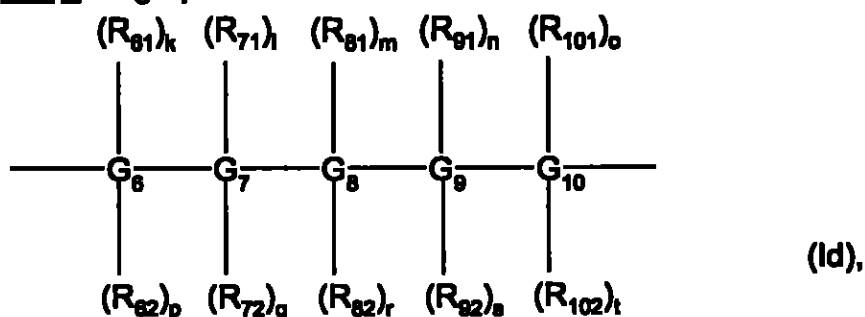
en dichas fórmulas 1a, 1b y 1c, a es 0; f es 0; y G_1 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; $\underline{a}$ es 0; f es 1; y G_1 es un átomo de nitrógeno; $\underline{a}$ es 1; f es 1; y G_1 es un átomo de carbono; b es 0; g es 0; y G_2 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; $\underline{a}$ b es 0; g es 1; y G_2 es un átomo de nitrógeno; $\underline{a}$ b es 1; g es 1; y G_2 es un átomo de carbono; y c es 0; h es 0; y G_3 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; $\underline{a}$ c es 0; h es 1; y G_3 es un átomo de nitrógeno; $\underline{a}$ c es 1; h es 1; y G_3 es un átomo de carbono;

en dichas fórmulas 1a y 1b, d es 0; i es 0; y G_4 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; $\underline{a}$ d es 0; i es 1; y G_4 es un átomo de nitrógeno; $\underline{a}$ d es 1; i es 1; y G_4 es un átomo de carbono;

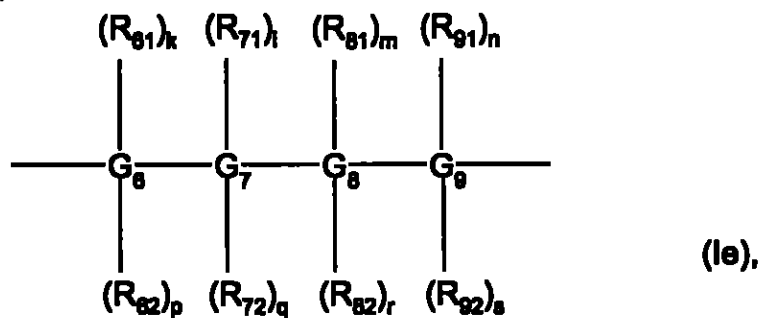
229
229

en dicha fórmula la, e es 0; j es 0; y G_5 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; $\underline{o}$ e es 0; j es 1; y G_5 es un átomo de nitrógeno; $\underline{o}$ e es 1; j es 1; y G_5 es un átomo de carbono;

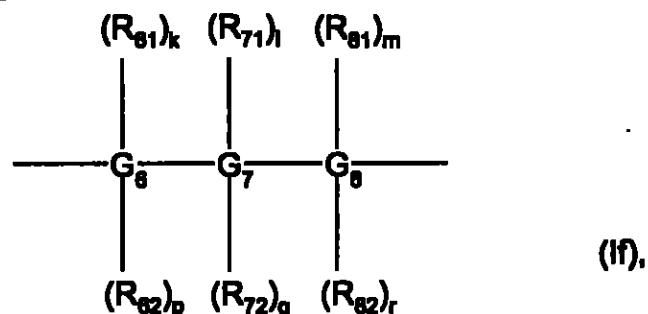
en dicha fórmula la, f es 1; g es 1; y R_{12} y R_{22} , tomados de manera conjunta, son $\underline{o}$ un grupo de la fórmula



en la cual G_6 está ligado a G_1 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_2 ; $\underline{o}$ son un grupo de la fórmula



en la cual G_6 está ligado a G_1 ; y en la cual G_9 está ligado a G_2 ; $\underline{o}$ son un grupo de la fórmula



en la cual G_6 está ligado a G_1 ; y en la cual G_8 está ligado a G_2 ;

$\underline{o}$ g es 1; h es 1; y R_{22} y R_{32} , tomados de manera conjunta, son $\underline{o}$ un grupo de la fórmula Id, en la cual G_6 está ligado a G_2 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_3 ; $\underline{o}$ son un grupo de la fórmula Ie, en la cual G_6 está ligado a G_2 ; y en la cual G_9 está

ligado a G_3 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_8 está ligado a G_3 ;

o h es 1; l es 1; y R_{32} y R_{42} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula I_d , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_4 ; o son un grupo de la fórmula I_e , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_9 está ligado a G_4 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_8 está ligado a G_4 ;

o i es 1; j es 1; y R_{42} y R_{52} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula I_d , en la cual G_8 está ligado a G_4 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_5 ; o son un grupo de la fórmula I_e , en la cual G_8 está ligado a G_4 ; y en la cual G_9 está ligado a G_5 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_4 ; y en la cual G_8 está ligado a G_5 ;

en la cual la fórmula I_b o f es 1; g es 1; y R_{12} y R_{22} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula I_d , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_2 ; o son un grupo de la fórmula I_e , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_9 está ligado a G_2 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_8 está ligado a G_2 ;

o g es 1; h es 1; y R_{22} y R_{32} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula I_d , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_3 ; o son un grupo de la fórmula I_e , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_9 está ligado a G_3 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_8 está ligado a G_3 ;

o h es 1; l es 1; y R_{32} y R_{42} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula I_d , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_4 ; o son un grupo de la fórmula I_e , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_9 está ligado a G_4 ; o son un grupo de la fórmula I_f , en la cual G_8 está ligado a G_3 ; y en la cual G_8 está ligado a G_4 ;

en la cual la fórmula lc o f es 1; g es 1; y R_{12} y R_{22} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula ld , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_2 ; o son un grupo de la fórmula le , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_9 está ligado a G_2 ; o son un grupo de la fórmula lf , en la cual G_8 está ligado a G_1 ; y en la cual G_8 está ligado a G_2 ;

o g es 1; h es 1; y R_{22} y R_{32} , tomados de manera conjunta, son o un grupo de la fórmula ld , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_{10} está ligado a G_3 ; o son un grupo de la fórmula le , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_9 está ligado a G_3 ; o son un grupo de la fórmula lf , en la cual G_8 está ligado a G_2 ; y en la cual G_8 está ligado a G_3 ;

en dichas fórmulas la , lb y lc los átomos G_1 y G_2 pueden conectarse a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{12} , si G_1 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{11} o R_{12} , si G_1 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{22} , si G_2 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{21} o R_{22} , si G_2 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dichas fórmulas la , lb y lc los átomos G_2 y G_3 pueden conectarse a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{22} , si G_2 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{21} o R_{22} , si G_2 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dichas fórmulas la y lb los átomos G_3 y G_4 pueden conectarse a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{42} , si G_4

es un átomo de nitrógeno, y que es R_{41} o R_{42} , si G_4 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula la los átomos G_4 y G_5 pueden conectarse a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{42} , si G_4 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{41} o R_{42} , si G_4 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{52} , si G_5 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{51} o R_{52} , si G_5 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula la, lb y lc el átomo G_1 puede conectarse con el átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que porta R_5 , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{12} , si G_1 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{11} o R_{12} , si G_1 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_5 , tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula la el átomo G_5 puede conectarse con el átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_8 , a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{52} , si G_5 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{51} o R_{52} , si G_5 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_8 , tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula lb el átomo G_4 puede conectarse con el átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_8 , a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{42} , si G_4 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{41} o R_{42} , si G_4 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_8 , tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula lc el átomo G_3 puede conectarse con el átomo de carbono, como se muestra en la fórmula I, que lleva R_8 , a través de un enlace

adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_8 , tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula la cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consisten en los sustituyentes R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} , R_{32} , R_{41} , R_{42} , R_{51} y R_{52} , los cuales son distintos de los dos sustituyentes, los que, tomados de manera conjunta, forman el grupo de la fórmula ld, le o lf, y diferentes de cualquier primer sustituyente, si está presente, como se definió anteriormente para la fórmula la, y de cualquier segundo sustituyente, si está presente, como se definió anteriormente para la fórmula la, es seleccionado de manera independiente del grupo, que consiste en los sustituyentes R_i ;

en dicha fórmula lb cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} , R_{32} , R_{41} y R_{42} , que son distintos de los dos sustituyentes, que, tomados de manera conjunta, forman el grupo de la fórmula ld, le o lf, y distintos de cualquier primer sustituyente, si está presente, según se definió anteriormente para la fórmula lb, y de cualquier segundo sustituyente, si está presente, según fue definido anteriormente para la fórmula lb, se selecciona de manera independiente del grupo, que consiste en los sustituyentes R_i ;

en dicha fórmula lc cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{11} , R_{12} , R_{21} , R_{22} , R_{31} y R_{32} , que son distintos de los dos sustituyentes, los cuales, tomados de manera conjunta, forman el grupo de la fórmula ld, le o lf, y distintos de cualquier primer sustituyente, si está presente, según fue definido anteriormente para la fórmula lc, y de cualquier segundo sustituyente, si está presente, como fue definido

231
234

anteriormente para la fórmula Ic, es seleccionado de manera independiente del grupo, que consiste en los sustituyentes R_i ;

R_i es hidrógeno; o un sustituyente R_g ; el número total de los sustituyentes R_g , si están presentes, teniendo un límite superior de 5 para un grupo de la fórmula Ia; de 4 para un grupo de la fórmula Ib; y de 3 para un grupo de la fórmula Ic; dicho número total puede, sin embargo, ser limitado para un grupo específico de la fórmula Ia, Ib o Ic a un valor inferior que el límite superior mencionado anteriormente, dicho valor es así igual al número de posiciones disponibles para la sustitución con un sustituyente R_g en este grupo específico;

R_g está o ligado a un átomo de carbono y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{g-c} ; o ligado a un átomo de nitrógeno y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{g-n} ;

R_{g-c} es un sustituyente R_c ;

R_{g-n} es ciano; nitro; alquilo C_1-C_6 ; halo-alquilo C_1-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 alquilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 ; halo-alquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; halo-alquinilo C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_6 ; halo-cicloalquilo C_3-C_6 ; alcoxi C_1-C_6 ; halo-alcoxi C_1-C_6 ; cicloalcoxi C_3-C_6 ; alquiltio C_1-C_6 ; halo-alquiltio C_1-C_6 ; alquilsulfinilo C_1-C_6 ; halo-alquilsulfinilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; halo-alquilsulfonilo C_1-C_6 ; amino; alquilamino C_1-C_6 ; halo-alquilamino C_1-C_6 ; dialquilamino C_1-C_6 , en el cual los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta, forman, junto al átomo de nitrógeno, al cual se encuentran ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y de manera opcional 1 heteroátomo más en el anillo, el que luego reemplaza 1 átomo de carbono en el anillo y se selecciona del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno, dicho anillo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 ; di-

235
235

(haloalquilC₁-C₆)-amino, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; cicloalquilaminoC₃-C₆; N-(alquilC₁-C₆)-N-(cicloalquilC₃-C₆)-amino; alcóxicarboniloC₁-C₆; halo-alcóxicarboniloC₁-C₆; aminocarbonilo; alquilaminocarboniloC₁-C₆; halo-alquilaminocarbonilo-C₁-C₆; dialquilaminocarboniloC₁-C₆, en el cual los dos grupos alquilo son iguales o diferentes o, tomados de manera conjunta, forman, junto al átomo de nitrógeno, al cual están ligados, un anillo que contiene 1 átomo de nitrógeno en el anillo y 2 a 12 átomos de carbono en el anillo y de manera opcional 1 heteroátomo adicional en el anillo, el cual luego reemplaza 1 átomo de carbono en el anillo y es seleccionado del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, uno de azufre y uno de nitrógeno, dicho anillo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en ciano, nitro, halógeno, alquiloC₁-C₄ y alcóxiC₁-C₄; di-(halo-alquilC₁-C₆)-aminocarbonilo, en el cual los dos grupos haloalquilo son iguales o diferentes; alquilcarboniloC₁-C₆; haloalquilcarboniloC₁-C₆; tri-alquilsilliloC₁-C₆, en el cual los tres grupos alquilo son iguales o diferentes; o un grupo heteroarilo monocíclico o bicíclico o fenilo, bencilo, benzollo, o fenoxi, dicho grupo está no sustituido o sustituido de manera independiente con 1 a 4 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R₆;

en dichas fórmulas Id, le y lf o bien k es 0; p es 0; y G₆ es un grupo C(=O); un grupo C(=S); un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo S(=O); o un grupo S(=O)₂; o bien k es 0; p es 1; y G₆ es un átomo de nitrógeno; o bien k es 1; p es 1; y G₆ es un átomo de carbono; o bien l es 0; q es 0; y G₇ es un grupo C(=O); un grupo C(=S); un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo S(=O); o un grupo S(=O)₂; o bien l es 0; q es 1; y G₇ es un átomo de nitrógeno; o bien l es 1; q es 1; y G₇ es un átomo de carbono; y o bien m es 0; r es 0; y G₈ es un grupo C(=O); un grupo C(=S); un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo

230
236

$S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; o m es 0; r es 1; y G_8 es un átomo de nitrógeno; o m es 1; r es 1; y G_8 es un átomo de carbono;

en dichas fórmulas ld y le o bien n es 0; s es 0; y G_9 es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; o n es 0; s es 1; y G_9 es un átomo de nitrógeno; o n es 1; s es 1; y G_9 es un átomo de carbono;

en dicha fórmula ld o bien o es 0; t es 0; y G_{10} es un grupo $C(=O)$; un grupo $C(=S)$; un átomo de oxígeno; un átomo de azufre; un grupo $S(=O)$; o un grupo $S(=O)_2$; o o es 0; t es 1; y G_{10} es un átomo de nitrógeno; o o es 1; t es 1; y G_{10} es un átomo de carbono;

en dichas fórmulas ld, le y lf los átomos G_8 y G_7 pueden estar conectados por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{72} , si G_7 es un átomo de nitrógeno, y el cual es R_{71} o R_{72} , si G_7 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dichas fórmulas ld, le y lf los átomos G_7 y G_8 pueden conectarse a través de un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{72} , si G_7 es un átomo de nitrógeno, y el cual es R_{71} o R_{72} , si G_7 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dichas fórmulas ld y le los átomos G_8 y G_9 pueden estar conectados por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{92} , si G_9

237
237

es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula Id los átomos G_9 y G_{10} pueden estar conectados por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{102} , si G_{10} es un átomo de nitrógeno, y que es R_{101} o R_{102} , si G_{10} es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dichas fórmulas Id , Ie y If el átomo G_6 puede estar conectado o bien con el átomo G_1 , según se muestra en las fórmulas Ia , Ib y Ic , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representada por un primer sustituyente, que es R_{62} , si G_6 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{61} o R_{62} , si G_6 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{12} , si G_1 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{11} o R_{12} , si G_1 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_2 , según se muestra en las fórmulas Ia , Ib y Ic , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{62} , si G_6 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{61} o R_{62} , si G_6 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{22} , si G_2 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{21} o R_{22} , si G_2 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_3 , según se muestra en las fórmulas Ia y Ib , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{62} , si G_6 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{61} o R_{62} , si G_6 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

278
230

o con el átomo G₄, según se muestra en la fórmula Ia, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R₆₂, si G₆ es un átomo de nitrógeno, y que es R₆₁ o R₆₂, si G₆ es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R₄₂, si G₄ es un átomo de nitrógeno, y que es R₄₁ o R₄₂, si G₄ es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula Id el átomo G₁₀ puede estar conectado o bien con el átomo G₂, como se muestra en las fórmulas Ia, Ib y Ic, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de nitrógeno, y que es R₁₀₁ o R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R₂₂, si G₂ es un átomo de nitrógeno, y que es R₂₁ o R₂₂, si G₂ es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G₃, según se muestra en las fórmulas Ia, Ib y Ic, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de nitrógeno, y que es R₁₀₁ o R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R₃₂, si G₃ es un átomo de nitrógeno, y que es R₃₁ o R₃₂, si G₃ es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G₄, como se muestra en las fórmulas Ia y Ib, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de nitrógeno, y que es R₁₀₁ o R₁₀₂, si G₁₀ es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R₄₂, si G₄ es un átomo de nitrógeno, y que es R₄₁ o R₄₂, si G₄ es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G₅, como se muestra en la fórmula Ia, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer

sustituyente, que es R_{102} , si G_{10} es un átomo de nitrógeno, y que es R_{101} o R_{102} , si G_{10} es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{52} , si G_5 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{51} o R_{52} , si G_5 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula le el átomo G_9 puede estar conectado o bien con el átomo G_2 , como se muestra en las fórmulas Ia, Ib y Ic, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{22} , si G_2 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{21} o R_{22} , si G_2 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_3 , como se muestra en las fórmulas Ia, Ib y Ic, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_4 , como se muestra en las fórmulas Ia y Ib, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{42} , si G_4 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{41} o R_{42} , si G_4 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_5 , como se muestra en la fórmula Ia, por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{52} , si G_5 es un

átomo de nitrógeno, y que es R_{51} o R_{52} , si G_5 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula I_f el átomo G_8 puede estar conectado o bien con el átomo G_2 , como se muestra en las fórmulas I_a , I_b y I_c , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{22} , si G_2 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{21} o R_{22} , si G_2 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_3 , como se muestra en las fórmulas I_a , I_b y I_c , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{32} , si G_3 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{31} o R_{32} , si G_3 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_4 , según se muestra en las fórmulas I_a y I_b , por un enlace adicional, dicho enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{42} , si G_4 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{41} o R_{42} , si G_4 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

o con el átomo G_5 , como se muestra en la fórmula I_a , por un enlace adicional, tal enlace, si está presente, está representado por un primer sustituyente, que es R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y un segundo sustituyente, que es R_{52} , si G_5 es un átomo de nitrógeno, y que es R_{51} o R_{52} , si G_5 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta;

en dicha fórmula Id cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{81} , R_{82} , R_{71} , R_{72} , R_{81} , R_{82} , R_{91} , R_{92} , R_{101} y R_{102} , los cuales son diferentes de cualquier primer sustituyente, si están presentes, según fue definido anteriormente para la fórmula Id, y de cualquier segundo sustituyente, si están presentes, como fue definido anteriormente para la fórmula Id, es seleccionado del grupo de manera independiente, que consiste en los sustituyentes R_h ;

en dicha fórmula Ie cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{81} , R_{82} , R_{71} , R_{72} , R_{81} , R_{82} , R_{91} y R_{92} , los cuales son diferentes de cualquier primer sustituyente, si están presentes, como se definió anteriormente para la fórmula Ie, y de cualquier segundo sustituyente, si está presente, como se definió anteriormente para la fórmula Ie, es seleccionado en forma independiente del grupo, que consiste en los sustituyentes R_i ;

en dicha fórmula If cada uno de esos sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{81} , R_{82} , R_{71} , R_{72} , R_{81} y R_{82} , los cuales son diferentes de cualquier primer sustituyente, si están presentes, según se definió anteriormente para la fórmula If, y de cualquier segundo sustituyente, si está presente, como fue definido anteriormente para la fórmula If, es seleccionado de manera independiente del grupo, que consiste en los sustituyentes R_h ;

R_h es hidrógeno; o un sustituyente R_j ; el número total de los sustituyentes R_j , si están presentes, teniendo un límite superior de 6 para un grupo de la fórmula Id; y de 4 para un grupo de la fórmula If; dicho número total puede, sin embargo, estar limitado para un grupo específico de la fórmula Id o If a un valor inferior al límite superior mencionado anteriormente, tal valor es entonces igual al número de las posiciones disponibles para la sustitución por un sustituyente R_j en este grupo específico;

R_i es hidrógeno; o un sustituyente R_k ; el número total de los sustituyentes R_k , si están presentes, teniendo un límite superior de 5; dicho número total puede, sin embargo, estar limitado para un grupo específico de la fórmula le a un valor inferior que el límite superior mencionado anteriormente, dicho valor es entonces igual al número de posiciones disponibles para la sustitución por un sustituyente R_k en este grupo específico;

R_j está o ligado a un átomo de carbono y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{j-c} ; o ligado a un átomo de nitrógeno y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{j-n} ;

R_{j-c} es un sustituyente R_c ;

R_{j-n} es un sustituyente R_{n-n} ;

R_k está o bien ligado a un átomo de carbono y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{k-c} ; o ligado a un átomo de nitrógeno y luego seleccionado del grupo, que consiste en los sustituyentes R_{k-n} ;

o 2 sustituyentes R_k , el primero de los cuales está ligado al átomo G_8 y está representado por R_{82} , si G_8 es un átomo de nitrógeno, y por R_{81} o R_{82} , si G_8 es un átomo de carbono, y el segundo de los cuales está ligado al átomo G_9 y está representado por R_{92} , si G_9 es un átomo de nitrógeno, y por R_{91} o R_{92} , si G_9 es un átomo de carbono, tomados de manera conjunta, son $-CH_2-$; o $-O-$;

R_{k-c} es un sustituyente R_c ;

R_{k-n} es un sustituyente R_{n-n} ;

R_8 es hidrógeno; alquilo C_1-C_6 ; o haloalquilo C_1-C_6 ; o tiene uno de los significados definidos anteriormente o más adelante;

o R_5 y R_8 , tomados de manera conjunta, son un enlace;

con la condición que,

(i) un átomo de oxígeno en el anillo, si está presente, no esté directamente conectado a un átomo de oxígeno ulterior en el anillo, si existe

alguno;

(ii) un átomo de carbono en el anillo, seleccionado del grupo, que consiste en $G_1, G_2, G_3, G_4, G_5, G_6, G_7, G_8, G_9$ y G_{10} , esté, si está presente, no directamente conectado con ningún otro átomo por un triple enlace o con ningún otros 2 átomos diferentes por 2 dobles enlaces;

(iii) no más de 6 de las variables $G_1, G_2, G_3, G_4, G_5, G_6, G_7, G_8, G_9$ y G_{10} puedan, si están presentes, ser seleccionadas del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo $S(=O)$, un grupo $S(=O)_2$ y un átomo de nitrógeno, cada una de las restantes de estas variables, si hay alguna, siendo seleccionada del grupo, que consiste en un átomo de carbono, un grupo $C(=O)$ y un grupo $C(=S)$, y no más de 3 de las 6 variables mencionadas puedan ser seleccionadas del grupo, que consiste en un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo $S(=O)$ y un grupo $S(=O)_2$; y

(iv) a menos que se defina lo contrario a lo anteriormente mencionado, el significado de una variable en un cierto caso pueda ser seleccionado de manera independiente del significado de la misma variable en cualquier otro caso, si es que existe.

A menos que se defina lo contrario, los términos generales utilizados anteriormente y de aquí en adelante tienen los significados que se detallan a continuación.

Halógeno – como grupo per se y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalquilo - es, por ejemplo, flúor, cloro, bromo o yodo, en particular flúor, cloro o bromo, pero especialmente cloro o bromo.

A menos que se defina lo contrario, los grupos y compuestos que contienen carbono comprenden por ejemplo en cada caso 1 hasta e incluyendo 15, preferentemente 1 hasta e incluyendo 10, especialmente 1 hasta e

incluyendo 8, en particular 1 hasta e incluyendo 5, especialmente 1 o 2, átomo(s) de carbono.

Cicloalquilo – como grupo per se y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como halocicloalquilo - es, en cada caso con la debida consideración del número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto relevante, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo or ciclohexilo.

Alquilo – como grupo per se y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalquilo - es, en cada caso con la debida consideración del número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto relevante, o bien cadena recta, por ejemplo metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo o hexilo, o ramificada, por ejemplo isopropilo, isobutilo, sec-butilo, ter-butilo, isopentilo, neopentilo o isohexilo.

Alquenilo – como grupo per se y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalquenilo - es, en cada caso con la debida consideración del número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto relevante, o bien cadena recta o ramificada y comprende en cada caso 2 o más de 2 o preferentemente 1 doble enlace(s) carbono-carbono, los dobles enlaces de estos sustituyentes están separados de la porción restante del compuesto l por preferentemente al menos 1 átomo de carbono saturado, y es, por ejemplo, alilo, propen-2-ilo, metalilo, but-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo o pent-4-en-1-ilo.

Alquinilo – como grupo per se y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalquinilo - es, en cada caso con la debida consideración del número de átomos de carbono contenidos en cada caso en el grupo o compuesto relevante, o bien cadena recta o ramificada y comprende en cada caso 2 o más de 2 o preferentemente 1 triple enlace(s) carbono-carbono, los

triples enlaces de estos sustituyentes están separados de la porción restante del compuesto I por preferentemente al menos un átomo de carbono saturado, y es, por ejemplo, propargilo, but-2-inoilo o but-3-en-2-ilo.

Arilo es, por ejemplo, naftilo o, preferentemente, fenilo.

Heteroarilo tiene, por ejemplo, un esqueleto de anillos aromáticos compuesto por un anillo que tiene 5 o 6 miembros del anillo o por una combinación de al menos dos anillos que tienen en cada caso de manera independiente uno del otro 5 o 6 miembros del anillo, donde por ejemplo 1 hasta e inclusive 4 de los miembros de anillos es (son) (un) heteroátomo(s) seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, y es, por ejemplo, piridilo, tienilo, pirazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, furilo, oxadiazolilo, indolizinoilo, pirimidilo, quinolino o pteridinilo.

El heterociclilo no aromático tiene, por ejemplo, un esqueleto de anillos no aromáticos compuesto por un anillo que tiene 5 o 6 miembros del anillo o por una combinación de al menos dos anillos que tienen en cada caso de manera independiente uno del otro 5 o 6 miembros del anillo, donde por ejemplo 1 hasta e incluyendo 4 de los miembros del anillo es (son) (un) heteroátomo(s) seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, y es, por ejemplo, piperidilo, pirrolinilo, tetrahidrofurilo o cromanilo.

Los grupos y compuestos que contienen carbono sustituido con halógeno, tales como haloalquilo, pueden estar parcialmente halogenados o perhalogenados, donde, en el caso de polihalogenación, los sustituyentes de halógeno pueden ser idénticos o diferentes.

Las siguientes son realizaciones preferidas adicionales dentro del alcance de la invención:

(3) Un compuesto conforme a (1) o (2) de la fórmula I, en el cual Z₁ es un átomo de oxígeno;

(4) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (3) de la fórmula I, en la cual Z_2 es un átomo de oxígeno;

(5) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (4) de la fórmula I, en la cual R_1 es un grupo fenilo, piridilo o pirazolilo, el cual está no sustituido o preferentemente sustituido;

especialmente un grupo fenilo, piridilo o pirazolilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi- C_1-C_6 y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está no sustituido o preferentemente sustituido;

más especialmente un grupo fenilo, piridilo o pirazolilo, el que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, consistente en halógeno y alquilo C_1-C_6 ;

preferentemente un grupo fenilo o piridilo, que está sustituido de manera independiente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_6 ; o un grupo pirazolilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, consistente en halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo- C_1-C_6 , halo-alcoxi C_1-C_6 y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_6 ;

más preferentemente un grupo pirazolilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi- C_1-C_6 y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno y alquilo C_1-C_6 ;

especialmente un grupo pirazol-3-ilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆ y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno y alquiloC₁-C₆;

más especialmente un grupo pirazol-3-ilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, haloalquiloC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆ y un grupo fenilo o piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno y alquiloC₁-C₆;

preferentemente un grupo pirazol-3-ilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, haloalquiloC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆ y un grupo piridilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno;

más preferentemente un grupo pirazol-3-ilo, que está sustituido independientemente con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno, haloalquiloC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆ y un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 o 2 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno;

especialmente un grupo pirazol-5-ilo, que está sustituido en la posición 3 con halógeno, haloalquiloC₁-C₆ o haloalcoxiC₁-C₆ y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido independientemente con 1 o 2 sustituyentes, seleccionados del grupo, que consiste en halógeno;

más especialmente un grupo pirazol-5-ilo, que está sustituido en la posición 3 con halógeno, haloalquiloC₁-C₆ o haloalcoxiC₁-C₆ y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido en la posición 3 con halógeno;

248
248

preferentemente un grupo pirazol-5-ilo, que está sustituido en la posición 3 con halógeno, halo-alquiloC₁-C₆ o haloalcoxilC₁-C₆ y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido en la posición 3 con cloro o bromo;

más preferentemente un grupo pirazol-5-ilo, que está sustituido en la posición 3 con haloalquiloC₁-C₆ y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido en la posición 3 con cloro o bromo;

con suma preferencia un grupo pirazol-5-ilo, el que está sustituido en la posición 3 con trifluorometilo y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, dicho grupo está sustituido en la posición 3 con cloro o bromo;

(6) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (5) de la fórmula I, en la cual R₂ es hidrógeno o alquiloC₁-C₆;

preferentemente hidrógeno;

(7) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (6) de la fórmula I, en la cual R₃ es hidrógeno o alquiloC₁-C₆;

preferentemente hidrógeno;

(8) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (7) de la fórmula I, en la cual R₄ es alquiloC₁-C₆;

preferentemente metilo o isopropilo;

(9) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (8) de la fórmula I, en la cual R₅ y R₆, tomados de manera conjunta, son un enlace;

(10) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (9) de la fórmula I, en la cual R₆ y R₇, tomados de manera conjunta, son un grupo de la fórmula Ib o un grupo de la fórmula Ic;

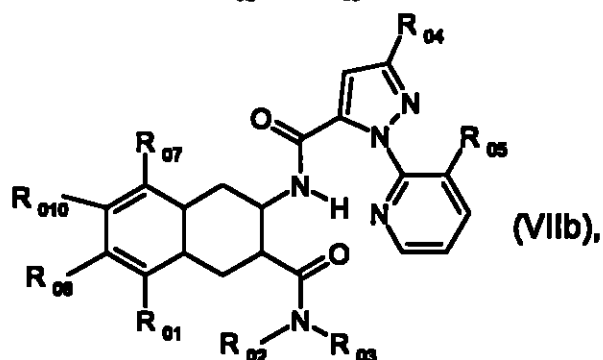
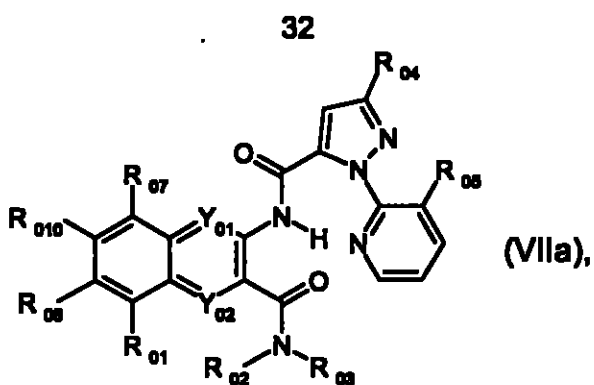
(11) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (10) de la fórmula I, en la cual los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a la cual los átomos R₆ y R₇ están ligados, son dos miembros del anillo de un anillo aromático;

(12) Un compuesto conforme a cualquiera de (1) a (11) de la fórmula I, en la cual R_6 y R_7 , tomados de manera conjunta, forman, junto a los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a los cuales están ligados, y junto a R_5 y a R_8 , uno de los sistemas bicíclicos de anillos mostrados en las fórmulas T1 a T85, o mostrados en las fórmulas T1 a T71, cada uno de los sistemas de anillos está sustituido con los dos sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ y $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$;

preferentemente tomados de manera conjunta, forman, junto a los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a los cuales se encuentran ligados, y junto con R_5 y con R_8 , uno de los sistemas de anillos bicíclicos señalados en las fórmulas T1, T6, T7, T21, T37 y T38, cada uno de los sistemas de anillos está sustituido con los dos sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ y $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$;

más preferentemente tomados de manera conjunta, forman, junto a los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a los cuales se encuentran ligados, y junto con R_5 y con R_8 , uno de los sistemas de anillos bicíclicos señalados en las fórmulas T1 y T7, o señalados en las fórmulas T2, T22, T75, T76, T78, T79 y T81, cada uno de los sistemas de anillos está sustituido con los dos sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$ y $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$.

Un ulterior subgrupo preferido de los compuestos de la fórmula I está representado por los compuestos de las fórmulas VIIa y VIIb



en donde

R_{01} es hidrogeno; amino o nitro;

R_{02} es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R_{03} es alquilo C_1-C_4 , alquilo C_1-C_4 mono- o disustituido con ciano, $COOH$, nitro, alcoxi C_1-C_4 o ciclopropilo;

alquenilo C_2-C_8 , alquenilo C_2-C sustituido con halógeno;

alcoxi C_1-C_4 , alquinilo- C_3-C_8 , ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilo sustituido con alquilo C_1-C_4 , piridilo, fenil-alquenilo C_2-C_8 o ciclopropilo;

ciclobutilo sustituido con alquilo C_1-C_4 ;

ciclopentiltioalquilo- C_1-C_4 , benciloxi, benciloxi sustituido con halógeno;

benciltioalquilo- C_1-C_4 , en donde el grupo bencilo podría estar él mismo sustituido con alquilo C_1-C_4 ;

tiofenilo sustituido con halofenilo;

fenoxialquilo-C₁-C₄, en donde el grupo fenilo podría estar mono o disustituido con halógeno;

fenilalquilo-C₁-C₄, en donde el grupo fenilo podría estar él mismo mono o disustituido con sustituyentes seleccionados de halógeno, nitro, benzotiazol-2-iloxi, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄ y alquiloC₁-C₄;

3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioxepinilo, 1,2,3,4-tetrahidro-naftalenilo sustituidos con alcoxiC₁-C₄;

alqueniloxiC₂-C₆, isoxazolilo sustituido con alquiloC₁-C₄;

tiazolilo, alcóxicarbonilC₁-C₄alquilo-C₁-C₄, fenilo sustituido con hidroxí, halofeniloxi, alquilC₁-C₄-sill(alquiloC₁-C₄)₃ o alquiniloC₂-C₆;

piridilo sustituido con alcoxiC₁-C₄;

alquiltioC₁-C₆alquilo-C₁-C₄, alqueniltioC₂-C₆alquilo-C₁-C₄, alquiniltioC₃-C₆alquilo-C₁-C₄, dioxolan-2-il-alquilo-C₁-C₄, (alquil C₁-C₄-dioxolan-2-il)-alquiloC₁-C₄, triazolil-alquilo-C₁-C₄, tienil-alquiloC₁-C₄, morfolinil-alquiloC₁-C₄, alquiltioC₁-C₄alquilo-C₁-C₄, 2,3-dihidro-1H-isoindolilo, tiazolil-alquiloC₁-C₄ halo-sustituido, alquilsulfonilC₁-C₄-alquiloC₁-C₄ o quinoliltio-alquiloC₁-C₄, en donde el grupo quinolino podría estar sustituido con haloalquiloC₁-C₄;

R₀₄ es haloalquiloC₁-C₄;

R₀₅ es halógeno;

Cada uno de R₀₆ y R₀₁₀, los cuales pueden ser iguales o diferentes, representa hidrógeno, alquiloC₁-C₆, alcóxicarboniloxiC₁-C₆, alquilcarbonilaminoC₁-C₆, hidroxí, ciano, halógeno o alcoxiC₁-C₆;

R₀₇ es hidrógeno, nitro o halógeno;

Y₀₁ es C(R₀₈), azufre, nitrógeno o un enlace químico;

R₀₈ es hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₄ o nitro;

Y₀₂ es C(R₀₉), un enlace químico, o es nitrógeno o azufre; y R₀₉ es hidrógeno, fenilo, fenilo sustituido con halógeno, o halógeno.

Los compuestos preferidos de la fórmula VIIa son aquellos, en donde

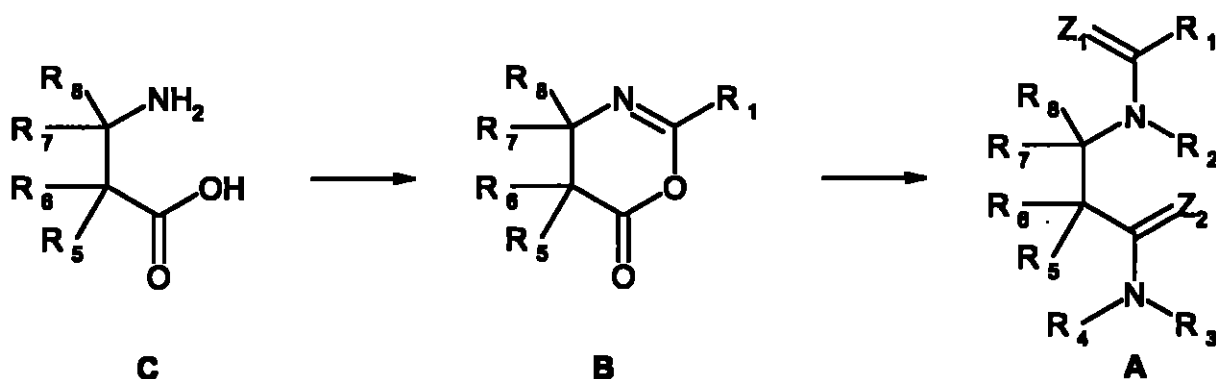
R_{01} es hidrógeno; R_{02} es hidrógeno; R_{03} es alquilo C_1-C_4 , preferiblemente metilo; R_{04} es fluoralquilo C_1-C_4 , preferiblemente trifluometilo; R_{05} es cloro; R_{06} es halógeno, preferiblemente cloro; R_{07} es hidrógeno; R_{010} es hidrógeno; Y_{01} es $C(R_{08})$; R_{08} es halógeno, preferiblemente cloro; Y_{02} es $C(R_{09})$, y R_{09} es hidrógeno.

Especialmente preferidos dentro del alcance de la invención son los compuestos de la fórmula I mencionados en los Ejemplos P3, P6 y P9 a P11.

Individualmente preferidos dentro del alcance de la invención son cada uno de los compuestos T1.1, T1.3, T6.1, T6.3, T7.1, T7.3, T21.3, T37.3 y T38.3.

También individualmente preferidos dentro del alcance de la invención son cada uno de los compuestos T2.1, T22.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T78.1, T79.1 y T81.1.

El proceso conforme a la invención para preparar compuestos de la fórmula I se lleva a cabo de manera análoga a los procesos conocidos. En la sección que sigue, los sustituyentes R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , Z_1 y Z_2 son como se define bajo la fórmula I en la reivindicación 1 a menos que se defina lo contrario.

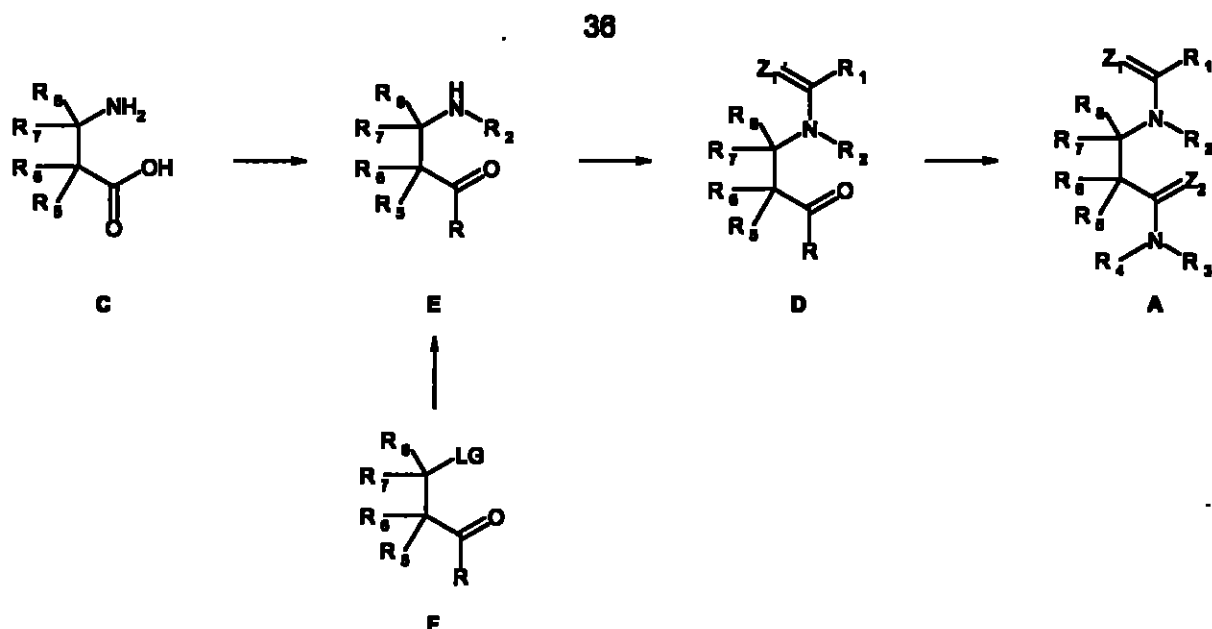


Los compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 y Z_2 son oxígeno y R_1 es hidrógeno, pueden estar hechos de la abertura del anillo de una benzoxazinona de la fórmula B con una amina de la fórmula NHR_3R_4 . Tales aminas son o bien

283
253

conocidas o bien pueden ser hechas de manera análoga a procesos conocidos. Las benzoxazinonas de la fórmula B podrían estar hechas de aminoácidos de la fórmula C a través de un tratamiento con un ácido carboxílico de la fórmula $R_1\text{-COOH}$ y un reactivo deshidratante como por ejemplo el cloruro metansulfonilo (opcionalmente en presencia de una base tal como piridina o trietilamina). Alternativamente las benzoxazinonas de la fórmula B podrían obtenerse a través del tratamiento de aminoácidos de la fórmula C con un cloruro ácido de la fórmula $R_1\text{-COCl}$ bajo condiciones básicas (por ejemplo en piridina), seguido en caso de ser necesario por una segunda etapa de ciclación (la cual puede alcanzarse usando un agente deshidratante por ejemplo anhídrido acético). Los cloruros ácidos de la fórmula $R_1\text{-COCl}$ podrían estar hechos de ácidos carboxílicos de la fórmula $R_1\text{-COOH}$ bajo condiciones estándar (por ejemplo a través del tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo). Los ácidos carboxílicos de la fórmula $R_1\text{-COOH}$ o bien son compuestos conocidos o podrían estar hechos de manera análoga a procesos conocidos.

Los compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 y Z_2 son azufre, podrían estar hechos de compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 y Z_2 son oxígeno, a través de un tratamiento con un reactivo de transferencia de tio tal como el reactivo de Lawesson o pentasulfuro de fósforo.



Alternativamente, los compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 y Z_2 son oxígeno, podrían estar hechos a través de un tratamiento de compuestos de la fórmula D, en donde Z_1 es oxígeno y R es OH, alcoxi C_1-C_4 o Cl, con un amina de la fórmula NHR_3R_4 . Las condiciones estándar para tales reacciones de acilación son como se describe a continuación: cuando R es OH tales reacciones son generalmente llevadas a cabo en presencia de un reactivo de acoplamiento tal como DCC (N,N'-díciclohexilcarbodiimida) o EDC clorhidrato de (1-Etil-3-[3-dimetilamino-propil]carbodiimida) opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo tal como hidroxibenzotriazol o 4-(dimetilamino)-piridina. Cuando R es Cl, tales reacciones son generalmente llevadas a cabo bajo condiciones básicas (por ejemplo en presencia de piridina o trietilamina), otra vez de manera opcional en presencia de un catalizador nucleófilo. Sería posible convertir ésteres (en donde R es alcoxi C_1-C_4) directamente en amidas calentando éster y amina juntos en un proceso térmico.

Los cloruros ácidos de la fórmula D, en donde Z_1 es oxígeno y R es Cl, podrían estar hechos de ácidos carboxílicos de la fórmula D, en donde Z_1 es

255
255

oxígeno y R es OH, bajo condiciones estándar (tales como el tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo). Los ácidos carboxílicos de la fórmula D, en donde Z₁ es oxígeno y R es OH, podrían estar formados de ésteres de la fórmula D, en donde Z₁ es oxígeno y R es alcoxiC₁-C₄. Es bien sabido para alguien que está en el tema que existen muchos métodos para la hidrólisis de tales ésteres dependiendo de la naturaleza del grupo alcoxi. Un método ampliamente utilizado para lograr dicha transformación es el tratamiento del éster con un álcali como por ejemplo el hidróxido de sodio en un solvente como el etanol.

Los ésteres de la fórmula D, en donde Z₁ es oxígeno y R es alcoxiC₁-C₄, pueden estar hechos a través del tratamiento de compuestos de la fórmula E, en donde R es alcoxiC₁-C₄, por acilación con compuestos de la fórmula

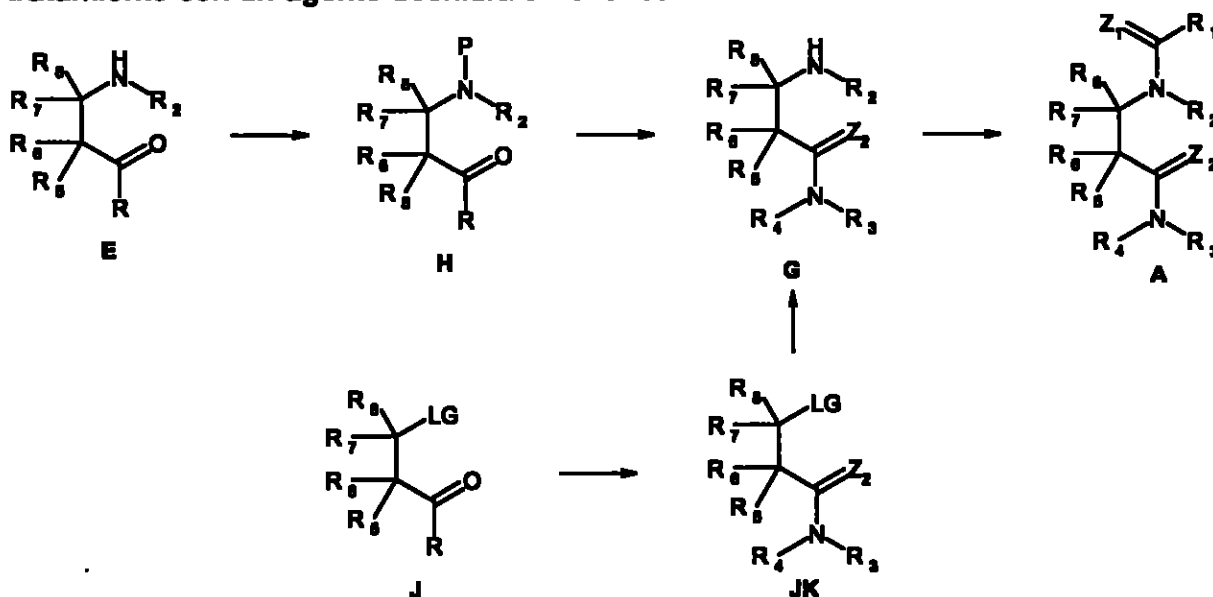
R₁-COOH o R₁-COCl bajo condiciones estándar según fue descrito anteriormente. Los compuestos de la fórmula E, en donde R es alcoxiC₁-C₄, podrían estar hechos de compuestos de la fórmula C a través de un tratamiento secuencial con un alcohol bajo condiciones ácidas y luego formación del enlace N-R₂. Es bien sabido por cualquier experto que existen muchos métodos conocidos para la formación de este enlace dependiendo de la naturaleza del sustituyente R₂. Por ejemplo, la aminación reductiva podría lograrse con el tratamiento de la amina con un aldehído o cetona y un agente reductor como el cianoborohidruro de sodio. De manera alternativa la alquilación podría lograrse tratando la amina con un agente alquilante como un haluro de alquilo, opcionalmente en presencia de una base. Alternativamente la arilación podría lograrse con un tratamiento de la amina con un haluro de arilo o sulfonato en presencia de un sistema catalizador/ligando adecuado, frecuentemente un complejo de paladio (0).

Alternativamente, los compuestos de la fórmula E, en donde R es alcoxiC₁-C₄a, podrían estar hechos de un compuesto de la fórmula F, en donde R es

alcoxiC₁-C₄ y LG es un grupo saliente tal como fluor, cloro o sulfonato, via desplazamiento nucleófilo del grupo saliente por una amina de la fórmula R₂-NH₂. Tales compuestos de la fórmula F y aminas de la fórmula R₂-NH₂ son o bien compuestos conocidos o pueden estar hechos por métodos conocidos y obvios para alguien experto en el tema.

Los compuestos de la fórmula A, en donde Z₁ es azufre y Z₂ es oxígeno, pueden estar hechos de compuestos de la fórmula D, en donde Z₁ es oxígeno y R es OH o alcoxiC₁-C₄, a través de un tratamiento con un reactivo de transferencia de tio tal como el reactivo de Lawesson o pentasulfuro de fósforo antes del acoplamiento con la amina de la fórmula NHR₃R₄.

Alternativamente, los compuestos de la fórmula D, en donde R es OH y Z₁ es oxígeno, podrían deshidratarse a benzoxazinonas de la fórmula B a través del tratamiento con un agente deshidratante tal como el anhídrido acético.



Alternativamente, los compuestos de la fórmula A, en donde Z₁ y Z₂ son oxígeno, podrían ser hechos por el tratamiento de compuestos de la fórmula G, en donde Z₂ es oxígeno, con un ácido carboxílico de la fórmula R₁-COOH o un cloruro ácido de la fórmula R₁-COCl según fue descrito anteriormente. Los compuestos de la fórmula G, en donde Z₂ es oxígeno, podrían formarse de

257-
257

compuestos de la fórmula H, en donde P es un grupo protector adecuado y R es OH, Cl o alcoxiC₁-C₄, por una formación de enlace de amidas con una amina de la fórmula NHR₂R₃ según fue descrito anteriormente para los compuestos de la fórmula D, seguido por la remoción del grupo protector P bajo condiciones estándar. Los compuestos de la fórmula H, en donde R es OH o alcoxiC₁-C₄, podrían estar hechos por la protección de la funcionalidad de la amina en los compuestos de la fórmula E, en donde R es OH o alcoxiC₁-C₄. Los grupos protectores adecuados incluyen carbamatos (tales como t-butiloxycarbonilo, aliloxycarbonilo y benciloxycarbonilo), grupos trialkilsililo (tales como t-butyldimethylsililo) y grupos acilo (tales como acetilo). La formación y remoción de tales grupos está ampliamente divulgada en la literatura y es bien conocida por un experto.

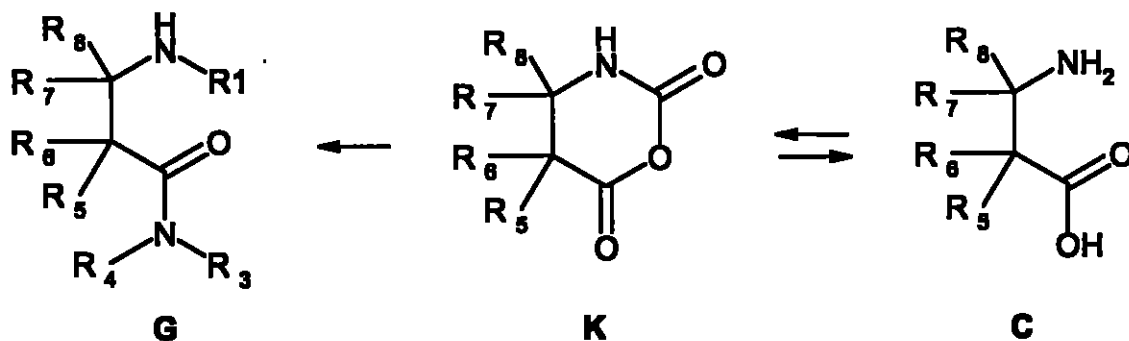
Para los compuestos de la fórmula H y los compuestos de la fórmula E, los ésteres (en donde R es alcoxiC₁-C₄) podrían hidrolizarse en los ácidos (en donde R es OH) a través de un tratamiento con un álcali tal como hidróxido de sodio en un solvente como el etanol. Los ácidos (en donde R es OH) podrían convertirse en cloruros ácidos (en donde R es Cl) a través de un tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo como fue anteriormente descrito para los compuestos de la fórmula D.

Alternativamente, podría ser posible convertir los compuestos de la fórmula E, en donde R es OH, Cl o alcoxiC₁-C₄, directamente en compuestos de la fórmula G a través de una formación de enlaces de amidas con una amina de la fórmula NHR₃R₄ bajo condiciones estándares (como fue descrito anteriormente para los compuestos de la fórmula D).

Alternativamente, los compuestos de la fórmula G, en donde Z₂ es oxígeno, podrían estar hechos de compuestos de la fórmula JK, en donde Z₂ es oxígeno y

LG es un grupo saliente como fluor, cloro o sulfonato, por desplazamiento del grupo saliente con un compuesto de la fórmula R_2NH_2 . Tales reacciones se desarrollan generalmente bajo condiciones básicas. Tales compuestos de la fórmula JK podrían estar hechos de compuestos de la fórmula J, en donde R es Cl o OH y LG es un grupo saliente según fue descrito anteriormente, vía formación de enlaces de amidas bajo condiciones estándar según fue descrito anteriormente. Tales compuestos de la fórmula J y la fórmula E son o bien compuestos conocidos o podrían estar hechos a través de métodos conocidos por los expertos.

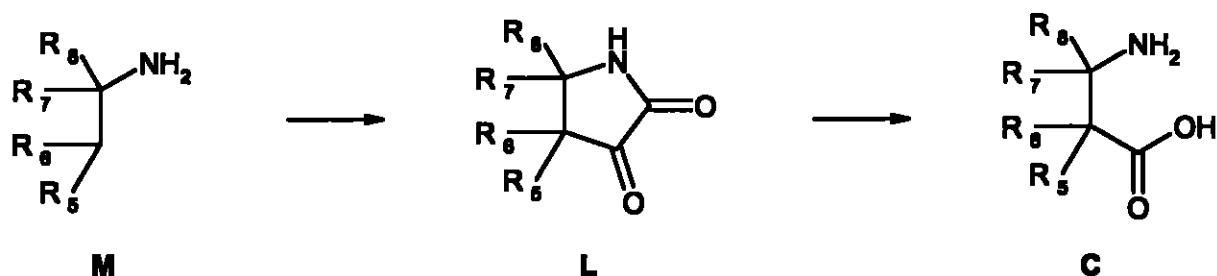
Los compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 es oxígeno y Z_2 es azufre, podrían estar hechos a través de un tratamiento de compuestos de la fórmula JK, en donde Z_2 es oxígeno y LG es un grupo saliente, o compuestos de la fórmula G, en donde Z_2 es oxígeno, con un reactivo de transferencia de tio como por ejemplo el reactivo Lawesson o pentasulfuro de fósforo antes de elaborar compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 es oxígeno y Z_2 es azufre, como fue descrito anteriormente para los compuestos de la fórmula A, en donde Z_1 es oxígeno y Z_2 es oxígeno).



Los compuestos de la fórmula C son o bien conocidos o podrían estar hechos a través de métodos conocidos por los expertos. Por ejemplo, los aminoácidos de la fórmula C podrían formarse por hidrólisis de anhídridos isatoicos de la fórmula K. Alternativamente, los anhídridos isatoicos de fórmula K

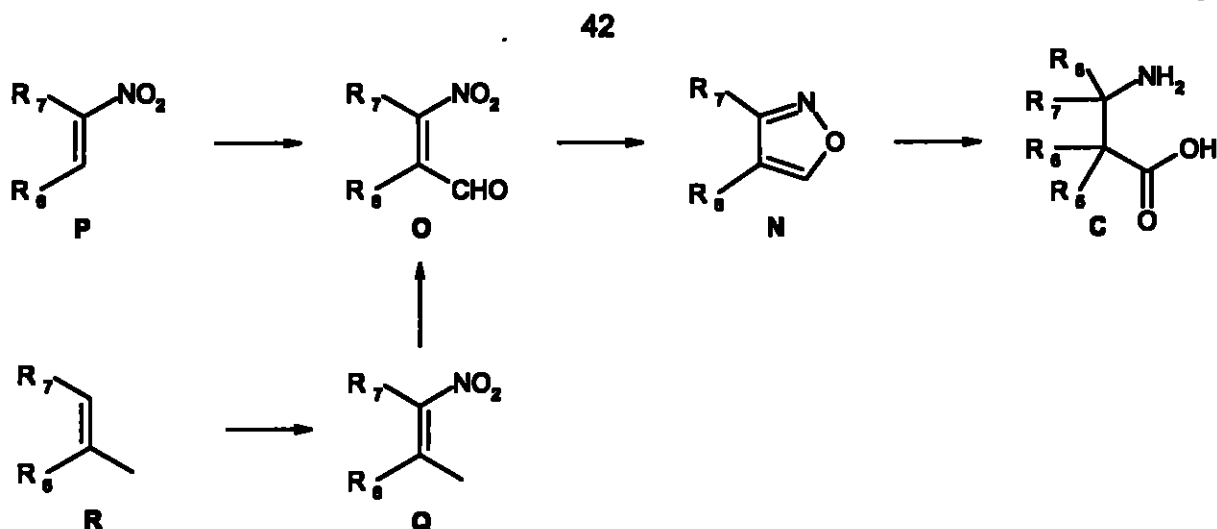
287
259

podrían reaccionarse con aminas de la fórmula NHR_3R_4 para dar compuestos de la fórmula G, en donde R_1 es H, directamente. Los anhídridos isatoicos de la fórmula K son o bien compuestos conocidos o podrían hacerse a través de métodos que son obvios para los expertos en la técnica, por ejemplo podrían derivarse de tratamiento de aminoácidos de la fórmula C con fosgeno o un equivalente sintético de fosgeno (por ejemplo carbonildimidazol).



Alternativamente, los compuestos de la fórmula C pueden derivarse del tratamiento de una isatina de la fórmula L con peróxido de hidrógeno bajo condiciones básicas. Las isatinas de la fórmula L son o bien conocidas o pueden hacerse a través de métodos conocidos por los expertos en la técnica, por ejemplo pueden derivarse de compuestos amino de la fórmula M, en donde R_5 y R_8 tomados de manera conjunta forman un enlace adicional entre los átomos de carbono que portan sustituyentes R_6 y R_7 , a través de un tratamiento por ejemplo con cloruro de oxalil (opcionalmente en presencia de un catalizador de ácido de Lewis) o hidrato cloral bajo condiciones varias. Los compuestos amino de la fórmula M son o bien compuestos conocidos o pueden estar hechos a través de métodos conocidos que los expertos encuentran obvios.

260
269



Alternativamente, los compuestos de la fórmula C, en donde R_5 y R_8 tomados de manera conjunta forman un enlace adicional entre los átomos de carbono que portan sustituyentes R_6 y R_7 , pueden derivarse del tratamiento de un isoxazol de la fórmula N con base acuosa. Los isoxazoles de la fórmula N pueden derivarse de nitroaldehídos de la fórmula O mediante un tratamiento con un agente reductor como zinc en ácido acético. Los nitroaldehídos de la fórmula O o bien son conocidos o pueden prepararse por métodos conocidos por los expertos en la técnica, por ejemplo pueden derivarse de compuestos nitro de la fórmula P mediante un tratamiento con cloroformo bajo condiciones básicas seguidas de un tratamiento con ácido acuoso fuerte. Alternativamente, los nitroaldehídos de la fórmula O pueden derivarse de la oxidación de compuestos aromáticos 1-nitro-2-metilo de la fórmula Q. Un método particularmente conveniente para alcanzar tal oxidación implica tratar al compuesto Q con dimetilformamida dimetilacetal bajo condiciones básicas seguido de un tratamiento con peryodato de sodio. Los compuestos de la fórmula P y Q son o bien conocidos o pueden prepararse mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica, por ejemplo los compuestos de la fórmula Q pueden sintetizarse a partir de compuestos de la fórmula R por nitración (por ejemplo, con una mezcla de ácido nítrico y ácido sulfúrico).

de los compuestos deseados. Un experto también reconocerá que podría ser posible lograr la síntesis de los compuestos deseados mediante el desarrollo de algunos de los pasos en estas rutas sintéticas aunque en un orden diferente al descrito.

Un experto en la técnica también reconoce que puede ser posible desarrollar interconversiones de grupos funcionales estándar o reacciones de sustitución en los compuestos descritos en este punto con el objeto de introducir o modificar sustituyentes ya existentes.

Los reactivos pueden preferentemente reaccionar en presencia de una base. Ejemplos de bases adecuadas son hidróxidos de metales alcalinos o alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos o alcalinotérreos, amidas de metal alcalino o de metal alcalinotérreo, alcóxidos de metales alcalinos o alcalinotérreos, acetatos de metales alcalinos o alcalinotérreos, carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos, dialquilamidas de metales alcalinos o alcalinotérreos o alquilsililamidas de metales alcalinos o alcalinotérreos, alquilaminas, alquilendiaminas, cicloalquilaminas saturadas o insaturadas libres o N-alquiladas, heterociclos básicos, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Ejemplos que pueden mencionarse son hidróxido de sodio, hidruro de sodio, amida de sodio, metóxido de sodio, acetato de sodio, carbonato de sodio, ter-butoxido de potasio, hidróxido de potasio, carbonato de potasio, hidruro de potasio, diisopropilamida de litio, bis(trimetilsilil)amida de potasio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletilamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, N-ciclohexil-N,N-dimetilamina, N,N-di-etilanilina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, quinuclidina, N-metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

Las reacciones se llevan a cabo de manera favorable en temperaturas que van desde los -80°C aproximadamente a los +140°C aproximadamente,

preferentemente desde unos -30°C hasta alrededor de $+100^{\circ}\text{C}$, en muchos casos entre temperatura ambiente y unos $+80^{\circ}\text{C}$.

Los compuestos de la fórmula B, D y de la fórmula A, en donde Z_2 es azufre (compuestos de la fórmula AA) y, donde es apropiado, los tautómeros de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, son novedosos y también son objetos de la invención.

Las sales de los compuestos de la fórmula I pueden prepararse de un modo conocido per se. Así, por ejemplo, las sales de adición de ácido de los compuestos de la fórmula I se obtienen mediante un tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo intercambiador de iones adecuado y las sales con bases se obtienen mediante tratamiento con una base adecuada o con un reactivo intercambiador de iones adecuado.

Las sales de los compuestos de la fórmula I pueden convertirse de manera habitual en los compuestos libres de la fórmula I, sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento con un compuesto básico adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado y sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado.

Las sales de los compuestos de la fórmula I pueden convertirse de un modo conocido per se en otras sales de compuestos de la fórmula I, sales de adición de ácido, por ejemplo, en otras sales de adición de ácido, por ejemplo mediante el tratamiento de una sal de ácido inorgánico como el clorhidrato con una sal metálica, tal como una sal de sodio, de bario o de plata, de un ácido, por ejemplo con acetato de plata, en un solvente adecuado en el cual una sal inorgánica que forma, por ejemplo cloruro de plata, es insoluble y por eso se precipita de la mezcla reactiva.

Dependiendo del procedimiento o de las condiciones reactivas, los compuestos de la fórmula I, que tienen propiedades de formación de sales pueden obtenerse en forma libre o en forma de sales.

Los compuestos de la fórmula I y, donde es apropiado, los tautómeros de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden estar presentes en la forma de uno de los isómeros posibles o como una mezcla de ellos, por ejemplo en forma de isómeros puros, tales como antípodas y/o diastereómeros, o como mezclas isómeras, tales como mezclas enantiómeras, por ejemplo racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo del número, configuraciones absolutas y relativas de átomos de carbono asimétricos que ocurren en la molécula y/o dependiendo de la configuración de enlaces dobles no aromáticos que ocurren en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros posibles y debe entenderse en cada caso en el sentido anteriormente mencionado y mencionado a continuación, incluso cuando los detalles estereoquímicos no se mencionen específicamente en cada caso.

Las mezclas de diastereómeros o las mezclas de racematos de los compuestos de la fórmula I, en forma libre o en forma de sal, que pueden obtenerse dependiendo de qué materiales de partida y qué procedimientos se han elegido pueden separarse de un modo conocido en los diastereómeros o racematos puros en base a diferencias físico-químicas de los componentes, por ejemplo por cristalización fraccional, destilación y/o cromatografía.

Las mezclas de enantiómeros, tales como racematos, que pueden obtenerse de manera similar pueden resolverse en las antípodas ópticas mediante métodos conocidos, por ejemplo mediante recristalización de un solvente ópticamente activo, mediante cromatografía en adsorbentes quirales, por

265
263

ejemplo cromatografía líquida de alto rendimiento (HPLC) sobre acetilcelulosa, con la ayuda de microorganismos adecuados, por disociación con enzimas específicas, inmovilizadas, vía la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo usando éteres corona quirales, donde sólo un enantiómero es complejoado, o por conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo por reacción de un racemato básico de producto final con un ácido ópticamente activo, como el ácido carboxílico, por ejemplo ácido canfórico, tartárico o málico, o ácido sulfónico, por ejemplo ácido canforsulfónico, y separando la mezcla diastereomérica que puede obtenerse de este modo, por ejemplo mediante cristalización fraccional basada en sus distintas solubilidades, para dar los diastereómeros, de los cuales el enantiómero deseado puede liberarse por la acción de agentes adecuados, por ejemplo agentes básicos.

Los diastereómeros o enantiómeros puros pueden obtenerse de acuerdo con la invención no sólo mediante la separación de mezclas de isómeros adecuados, sino también mediante métodos usualmente conocidos de síntesis diastereoselectiva o enantioselectiva, por ejemplo llevando a cabo el proceso de acuerdo con la invención con materiales de partida de una estereoquímica adecuada.

Tiene sus ventajas el hecho de aislar o sintetizar en cada caso el isómero biológicamente más efectivo, por ejemplo enantiómero o diastereómero, o la mezcla isomérica, por ejemplo mezcla enantiomérica o mezcla diastereomérica, si los componentes individuales tienen una actividad biológica diferente.

Los compuestos de la fórmula I y, donde sea apropiado, los tautómeros de los mismos, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden, si es apropiado, también obtenerse en forma de hidratos y/o incluir otros solventes, por ejemplo aquellos que pueden haberse usado para la cristalización de compuestos que están presentes en forma sólida.

26E
266

La invención se refiere a todas esas realizaciones del proceso a través de las cuales, comenzando de un compuesto obtenible en cualquier nivel del proceso como material de partida o intermediario, todos o algunos de los pasos que faltan se llevan a cabo o un material de partida se usa en la forma de un derivado y/o de una sal y/o de racematos o antípodas de ellos mismos o, en particular, se forma bajo las condiciones de reacción.

Aquellos materiales de partida e intermediarios, en cada caso en forma libre o en forma de sal, que conducen a los compuestos de la fórmula I o las sales de ellos mismos que se han descrito al comienzo como particularmente apreciables son preferentemente usados en el proceso de la presente invención.

En particular, la invención se refiere a los procesos de preparación descritos en los Ejemplos P1 a P11.

Los materiales de partida e intermediarios, en cada caso en forma libre o en forma de sal, que se usan de acuerdo con la invención para la preparación de los compuestos de la fórmula I o las sales de ellos mismos y que son novedosos, un proceso para su preparación, y su uso como materiales de partida e intermediarios para la preparación de los compuestos de la fórmula I también son un objeto de la invención; en particular, esto se refiere a los compuestos de la fórmula II, IV y V.

Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención son ingredientes activos valiosos para la prevención y/o para la curación en el terreno del control de plagas, incluso en índices bajos de aplicación, que tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por especies de sangre caliente, peces y plantas. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención actúan en contra de todas las etapas de desarrollo o de las etapas de desarrollo individuales de las plagas animales que son habitualmente sensibles pero al

mismo tiempo resistentes, tales como insectos o representantes del orden *Acarina*. La actividad insecticida o acaricida de los ingredientes activos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir destruyendo a las plagas, que tiene lugar o bien inmediatamente o sólo después de transcurrido cierto tiempo, por ejemplo durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo durante una etapa reducida en la que ponen los huevos, una buena actividad que se corresponde con un índice de destrucción (mortalidad) de por lo menos 50 al 60%.

Ejemplos de las plagas animales anteriormente mencionadas son:

Del orden *Acarina*, por ejemplo,

Acarus siro, *Aceria sheldoni*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Calipitimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus carpini*, *Eriophyes* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Olygonychus pratensis*, *Omlithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp. y *Tetranychus* spp.;

del orden de los *Anópluros*, por ejemplo,

Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. y *Phylloxera* spp.;

del orden *Coleópteros*, por ejemplo,

Agriotes spp., *Anthonomus* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cosmopolites* spp., *Curculio* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Melolontha* spp., *Orycaephilus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhizopertha* spp., *Scarabaeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. y *Trogoderma* spp.;

del orden *Dipteros*, por ejemplo,

Aedes spp., *Antherigona* *soccata*, *Bibio* *hortulanus*, *Calliphora* *erythrocephala*, *Ceratitis* spp., *Chrysomyia* spp., *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus* spp., *Drosophila* *melanogaster*, *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Glossina* spp., *Hypoderma* spp., *Hyppobosca* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Melanagromyza* spp., *Musca* spp., *Oestrus* spp., *Orseolia* spp., *Oscinella* *frit*, *Pegomyia* *hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Rhagoletis* *pomonella*, *Sclara* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp. y *Tipula* spp.;

del orden *Heterópteros*, por ejemplo,

Cimex spp., *Distantiella* *theobroma*, *Dysdercus* spp., *Euchistus* spp., *Eurygaster* spp., *Leptocorisa* spp., *Nezara* spp., *Piesma* spp., *Rhodnius* spp., *Sahlbergella* *singularis*, *Scotinophara* spp. y *Triatoma* spp.;

del orden *Homópteros*, por ejemplo,

Aleurothrixus *floccosus*, *Aleyrodes* *brassicae*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Bemisia* *tabaci*, *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus* *aonidium*, *Chrysomphalus* *dictyospermi*, *Coccus* *hesperidum*, *Empoasca* spp., *Eriosoma* *largerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Laodelphax* spp., *Lecanium* *corni*, *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphus* spp., *Myzus* spp., *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pulvinaria* *aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Trialeurodes* *vaporariorum*, *Trioza* *erytrae* y *Unaspis* *citri*;

del orden *Himenópteros*, por ejemplo,

Acromyrmex, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia* *polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium* *pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Solenopsis* spp. y *Vespa* spp.;

del orden *Isópteros*, por ejemplo,

Reticulitermes spp.;

del orden *Lepidópteros*, por ejemplo,

Acleris spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylols* spp., *Anticarsia gemmatalis*, *Archips* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydia* spp., *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Earlas* spp., *Ephestia* spp., *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp., *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Operophtera* spp., *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni* y *Yponomeuta* spp.;

del orden *Mallofaga*, por ejemplo,

Damallinea spp. y *Trichodectes* spp.;

del orden *Ortópteros*, por ejemplo,

Blatta spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Periplaneta* spp. y *Schistocerca* spp.;

del orden *Psocópteros*, por ejemplo,

Liposcelis spp.;

del orden *Sifonápteros*, por ejemplo,

Ceratophyllus spp., *Ctenocephalides* spp. y *Xenopsylla cheopis*;

del orden *Tisanópteros*, por ejemplo,

Frankliniella spp., *Hercinothrips* spp., *Scirtothrips aurantii*, *Taeniothrips* spp., *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*; y

del orden *Tisánuros*, por ejemplo,

Lepisma saccharina.

Los ingredientes activos de acuerdo con la invención pueden usarse para control, es decir conteniendo o destruyendo plagas del tipo mencionado anteriormente que ocurren particularmente en plantas, especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, horticultura y en bosques, o en órganos tales como frutas, flores, hojas, tallos, tubérculos o raíces de tales plantas, y en algunos casos incluso órganos que se forman más tarde permanecen protegidos de estas plagas.

Los cultivos objetivos adecuados son, en particular, cereales, como el trigo, la cebada, el centeno, la avena, el arroz, el maíz o el sorgo; remolacha azucarera o remolacha utilizada como alimento para animales; fruta, por ejemplo, frutas pomáceas, frutas con carozo o sin carozo, como manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas o bayas, por ejemplo frutillas, frambuesas o moras; cultivos leguminosos, tales como porotos, lentejas, arvejas o soja; cultivos oleosos, tales como colza de semilla oleaginosa, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, coco, ricino, cacao o maní; cucurbitas, como por ejemplo calabazas, pepinos o melones; plantas fibrosas, como algodón, lino, cáñamo o yute; frutas cítricas, como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; verduras, como espinaca, lechuga, espárragos, repollo, zanahoria, cebolla, tomate, papa o pimientos; lauráceas, como la palta, canela o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjena, caña de azúcar, té, pimienta, vid, lúpulo, la familia de los plátanos, plantas de látex y ornamentales.

Los ingredientes activos de acuerdo con la invención son especialmente adecuados para el control de *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* y *Spodoptera littoralis* en cultivos de algodón, verduras, maíz, arroz y soja.

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también de cultivos que se han prestado como tolerantes a los herbicidas como bromoxnillo o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enol-pirovil-shikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina sintetasa) como resultado de métodos convencionales de reproducción o de Ingeniería genética. Un ejemplo de cultivo que se ha prestado como tolerante a imidazolinonas, por ejemplo imazamox, mediante métodos convencionales de reproducción (mutagénesis) es la colza Clearfield® (Canola). Ejemplos de cultivos que se han mostrado tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas por métodos de Ingeniería genética incluyen variedades de maíz resistentes al glifosato y al glufosinato, que están disponibles comercialmente bajo las marcas RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también de plantas de cultivo que han sido así transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar una o más toxinas selectivamente activas, tal como se conocen, por ejemplo, de bacterias productoras de toxina, especialmente aquellas del género *Bacillus*.

Las toxinas que pueden expresarse mediante tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas, por ejemplo proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tales como δ -endotoxinas, por ej. CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas insecticidas

vegetativas (VIP), ej. VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; o proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nemátodos, por ejemplo *Photobhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photobhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales, tales como las toxinas del escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas y otras neurotoxinas insectoespecíficas; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas estreptomicetes, lectinas de plantas, tales como lectina de arvejas, lectina de cebada o lectina de la campanilla blanca; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de papaína, cisteína y patatina; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como la ricina, maíz-RIP, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas esteroides del metabolismo, tales como 3-hidroxisteroidoxidasas, ecdisterolde-UDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasas, inhibidores de ecdisona, reductasa HMG-COA, bloqueadores de canales de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio o calcio, hormona juvenil esterasa, receptores de hormonas diuréticos, estilbena sintasa, bibencil sintasa, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención debe entenderse por δ -endotoxinas, por ejemplo CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas vegetativas insecticidas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen por recombinación por una nueva combinación de dominios diferentes de esas proteínas (remitirse a, por ejemplo, WO 02/15701). En el caso de las toxinas modificadas, uno o más aminoácidos de la toxina que surge naturalmente se reemplazan. En tales reemplazos de aminoácidos, preferentemente secuencias de reconocimiento de proteasas presentes de manera no natural se insertan dentro de la toxina, como

por ejemplo, en el caso de CryIIIA055, una secuencia de reconocimiento de cathepsina-D se inserta en una toxina CryIIIA (remitirse a WO 03/018810).

Ejemplos de tales toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas se dan a conocer, por ejemplo, en EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

Los procesos para la preparación de tales plantas transgénicas son usualmente conocidos por los expertos en la técnica y están descritos, por ejemplo, en las publicaciones anteriormente mencionadas. Los ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación se conocen, por ejemplo, de WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas imparte a las plantas tolerancia frente a insectos dañinos. Tales insectos pueden estar en cualquier grupo taxonómico de insectos, aunque se encuentran especialmente de manera habitual en los escarabajos (Coleópteros), en los insectos de doble ala (Dípteros) y en las mariposas (Lepidópteros).

Las plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican para una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son conocidas y algunas de ellas están disponibles comercialmente. Ejemplos de tales plantas son: YieldGard® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIA(b) y una CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c) y

una CryIIA(b)); VIPCOT® (variedad de algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de papa que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard y Protecta®.

Ejemplos ulteriores de tales cultivos transgénicos son:

1. **Maíz Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* genéticamente modificado que se ha mostrado resistente al ataque del gorgojo del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por expresión transgénica de una toxina CryIA(b) truncada. El maíz Bt11 también expresa en forma transgénica la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

2. **Maíz Bt176** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* genéticamente modificado que se ha mostrado resistente al ataque del gorgojo del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por expresión transgénica de una toxina CryIA(b).

3. **Maíz MIR604** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Maíz que se ha mostrado resistente a los insectos por expresión transgénica de una toxina CryIIIA modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada por inserción de una secuencia de reconocimiento de cathepsina-D-proteasa. La preparación de dichas plantas de maíz transgénicas se describe en WO 03/018810.

4. **Maíz MON 863** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina CryIIIB(b1) y tiene resistencia a ciertos insectos Coleópteros.

5. **Algodón IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

6. **Maíz 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Maíz genéticamente modificado para la expresión de la proteína Cry1F para lograr resistencia a ciertos Insectos Lepidópteros y de la proteína PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

7. **Maíz NK603 × MON 810** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en variedades de maíz híbrido cultivadas convencionalmente cruzando las variedades genéticamente modificadas NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa de manera transgénica la proteína CP4 EPSPS, obtenida de *Agrobacterium sp.* cepa CP4, que imparte tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también una toxina CryIA(b) obtenida de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* que genera tolerancia a ciertos Lepidópteros, incluye el gorgojo del maíz europeo.

Los cultivos transgénicos de plantas que poseen resistencia a insectos se describen también en BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Suiza) Informe 2003, (<http://bats.ch>).

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también de plantas de cultivo que han sido así transformadas mediante la utilización de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas teniendo una acción selectiva, tal como, por ejemplo, las así llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRPs, remitirse al ej. EP-A-0 392 225). Ejemplo de tales sustancias antipatógenas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar tales sustancias antipatógenas se conocen, por ejemplo, de EP-A-0 392 225, WO 95/33818, y EP-A-0 353 191. Los métodos para producir tales plantas transgénicas son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones anteriormente mencionadas.

Las sustancias antipatógenas que pueden expresarse por dichas plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, bloqueadores de canales de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio y de calcio, por ejemplo las toxinas virales KP1, KP4 o KP6; estilbeno sintasas; bibencil sintasas; quitinasas; glucanasas; las así llamadas "proteínas relacionadas con patogénesis" (PRPs; véase por ej. EP-A-0 392 225); sustancias antipatógenas producidas por microorganismos, por ejemplo antibióticos péptidos o antibióticos heterocíclicos (remitirse por ej. WO 95/33818) o factores proteicos o polipéptidos implicados en la protección contra agentes patógenos de las plantas (así llamados "genes de resistencia a las enfermedades de las plantas", según se describen en WO 03/000906).

Otras áreas de aplicación de los ingredientes activos de acuerdo con la invención son la protección de productos almacenados y lugares de almacenamiento y la protección de material, como por ejemplo madera, textiles, revestimientos de pisos o edificios, y, en el sector de higiene, en particular la protección de seres humanos, animales domésticos y de ganado productivo en contra de plagas del tipo anteriormente mencionado.

La invención, por consiguiente, también se refiere a composiciones pesticidas tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, soluciones directamente pulverizables o diluibles, pastas diseminables, emulsiones para diluir, polvos solubles, polvos diseminables, polvos humedecibles, polvillos, gránulos o encapsulaciones en sustancias poliméricas, los cuales comprenden – al menos – uno de los ingredientes activos de acuerdo con la invención y que deben seleccionarse con el objetivo de satisfacer los objetivos deseados y las circunstancias predominantes.

En estas composiciones, el ingrediente activo se emplea de forma pura, un ingrediente activo sólido por ejemplo en un tamaño de partícula específico, o, preferentemente, de manera conjunta con – al menos – uno de los auxiliares

utilizados convencionalmente en la técnica de la formulación, tales como cargas, por ejemplo solventes o portadores sólidos, o tales como compuestos tensoactivos (surfactantes).

Ejemplos de solventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferentemente las fracciones C_8 a C_{12} de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexano, alcoholes como el etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres tales como propilenglicol, dipropilenglicoléter, etilenglicoléter o monometiléter de etilenglicol o monoetiléter de etilenglicol, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona o alcohol diacetona, solventes fuertemente polares, tales como N-metilpirrolid-2-ona, sulfóxido dimetilico o N,N-dimetilformamida, agua, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados, tales como aceite de colza epoxidado o no epoxidado, aceite de ricino, aceite de coco o aceite de soja, y aceites de silicona.

Los portadores sólidos que se usan por ejemplo para polvillos y polvos diseminables son, como regla, minerales naturales molidos tales como calcita, talco, caolín, montmorillonita o attapulguita. Con el objetivo de mejorar las propiedades físicas, también se puede agregar sílices altamente dispersas o polímeros absorbentes altamente dispersos. Portadores en partículas adsorbentes adecuados para gránulos son de tipos porosos, tales como piedra pómez, arenisca de ladrillo, sepiolita o bentonita, y materiales portadores no adsorbentes adecuados son calcita o arena. Además, pueden utilizarse un gran número de materiales granulados de naturaleza orgánica o inorgánica, en particular dolomita o residuos de plantas molidos.

Compuestos tensoactivos adecuados son, dependiendo del tipo de ingrediente activo a ser formulado, surfactantes no iónicos, catiónicos y/o

aniónicos o mezclas de surfactantes que tienen buenas propiedades emulsionantes, dispersantes y humidificantes. Los surfactantes mencionados a continuación deben sólo considerarse como ejemplos; un gran número de surfactantes ulteriores que son convencionalmente utilizados en la técnica de la formulación y que son adecuados de acuerdo con la invención se describen en la literatura relevante.

Los surfactantes no iónicos adecuados son, en particular, derivados del éter poliglicol de alcoholes alifáticos o cicloalifáticos, de ácidos grasos saturados o insaturados o de alquilfenoles que pueden contener entre alrededor de 3 y alrededor de 30 grupos glicoléter y entre alrededor de 8 y alrededor de 20 átomos de carbono en el radical hidrocarburo (ciclo) alifático o entre alrededor de 6 y alrededor de 18 átomos de carbono en la porción alquilo de los alquilfenoles. También son adecuados los aductos de óxido de polietileno solubles en agua con polipropilenglicol, etilendiaminopolipropilenglicol o alquilpolipropilenglicol que tengan entre 1 y alrededor de 10 átomos de carbono en la cadena alquilica y entre alrededor de 20 y alrededor de 250 grupos etilenglicoléter y entre alrededor de 10 y alrededor de 100 grupos propilenglicoléter. Normalmente, los compuestos anteriormente mencionados contienen de 1 a alrededor de 5 unidades etilenglicol por unidad de propilenglicol. Ejemplos que podrían mencionarse son nonilfenoxipolietoxietanol, poliglicoléter de aceite de ricino, aductos de óxido de polipropilenglicol/ polietileno, tributilfenoxipolietoxietanol, polietilenglicol u octilfenoxipolietoxietanol. También son adecuados los ésteres de ácidos grasos de polioxietilensorbitán, tal como trioleato de polioxietilensorbitán.

Los surfactantes catiónicos son, especialmente, sales de amonio cuaternarias que tienen generalmente por lo menos un radical alquilo de entre alrededor de 8 a alrededor de 22 átomos de carbono como sustituyentes y como sustituyentes ulteriores (no halogenados o halogenados) radicales de alquilos

inferior o radicales hidroxialquilo o bencilo. Las sales están preferentemente en forma de haluros, metilsulfatos o etilsulfatos. Ejemplos son cloruro de esteariltrimetilamonio y bromuro de bencilbis(2-cloroetil)etilamonio.

Ejemplos de surfactantes aniónicos adecuados son jabones solubles en agua o compuestos tensoactivos sintéticos solubles en agua. Ejemplos de jabones adecuados son las sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio (no sustituido o sustituido) de ácidos grasos que tienen alrededor de 10 a alrededor de 22 átomos de carbono, tales como las sales de sodio o potasio del ácido oleico o esteárico, o de mezclas naturales de ácidos grasos que se obtienen por ejemplo del aceite de coco o del aceite de sebo; también deben mencionarse los metiltauratos de ácido graso. Sin embargo, los surfactantes sintéticos se utilizan con mayor frecuencia, en particular sulfonatos grasos, sulfatos grasos, derivados de bencimidazol sulfonado o alquilarilsulfonatos. Como regla, los sulfonatos grasos y los sulfatos grasos están presentes como las sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio (no sustituido o sustituido) y generalmente tienen un radical alquilo de entre alrededor de 8 y alrededor de 22 átomos de carbono, alquilo también debe entenderse como que incluye la porción alquilo de radicales acilo; ejemplos que pueden mencionarse son las sales de sodio o de calcio de ácido lignosulfónico, del éster dodecilsulfúrico o de una mezcla de sulfato de alcohol graso preparada de ácidos grasos naturales. Este grupo también incluye las sales de los ésteres sulfúricos y ácidos sulfónicos de aductos de óxido de etilo / alcoholes grasos. Los derivados de bencimidazol sulfonados contienen preferentemente 2 grupos sulfonilo y un radical de ácido graso de aproximadamente 8 a 22 átomos de carbono. Ejemplos de alquilarilsulfonatos son las sales de sodio, calcio o trietanolamonio, de ácido decilbencensulfónico, de ácido dibutilnaftalensulfónico o de un condensado de ácido naftalensulfónico / formaldehído. También son posibles, además, fosfatos adecuados, tales como

sales del éster fosfórico de un aducto de óxido de p-nonilfenol/(4-14)etileno, o fosfolípidos.

Como regla, las composiciones que abarcan de 0,0001 a 99,9999 %, en particular 0,1 a 95%, de ingrediente activo, y 0,0001 a 99,9999%, en particular 5 a 99,9%, de – al menos – un auxiliar sólido o líquido, siendo esto posible, como regla, para 0 a 25%, en particular 0,1 a 20%, de las composiciones a ser surfactantes (% en cada caso es por ciento en peso). Mientras que las composiciones concentradas son más preferidas como productos comercialmente disponibles, el usuario final usa, como regla, composiciones diluidas que poseen concentraciones considerablemente menores de ingrediente activo.

La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede ampliarse de manera considerable, y adaptarse a circunstancias predominantes, mediante el agregado de otros ingredientes activos desde el punto de vista insecticida o acaricida. Las adiciones adecuadas para ingredientes activos aquí son, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de ingredientes activos: compuestos organofosforados, derivados de nitrofenol, tioureas, hormonas juveniles, formamidinas, derivados de benzofenona, ureas, derivados de pirrol, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados, acilureas, derivados del piridilmetilenamino, macrólidos, neonicotinoides y preparaciones de *Bacillus thuringiensis*.

Ejemplos de socios del mezclado especialmente adecuados incluyen compuestos seleccionados del siguiente grupo M:

Grupo M: socios del mezclado especialmente adecuados para los compuestos de la fórmula I:

azametifos; clorfenvinfos; cipermetrina, cipermetrina high-cis; ciromazina; diafentiurón; diazinón; diclorvós; dicrotofós; diciclanil; fenoxicarb; fluazurón; furatiocarb; isazofós; iodfenfós; quinopreno; lufenurón; metacrifós; metidatió;

monocrotofós; fosfamidón; profenofós; diofenolan; un compuesto obtenible de la cepa de *Bacillus thuringiensis* GC91 o de la cepa NCTC11821; pimetrozina; bromopropilato; metopreno; disulfotón; quinalfós; tau-fluvalinato; tiociclam; tiometón; aldicarb; azinfós-metilo; benfuracarb; bifentrina; buprofecin; carbofuran; dibutilaminotio; cartap; clorfluazurón; clorpirifós; ciflutrina; lambda-cihalotrina; alfa-cipermetrina; zeta-cipermetrina; deltametrina; diflubenzurón; endosulfan; etiofencarb; fenitrotión; fenobucarb; fenvalerato; formotión; metiocarb; heptenofós; imidacloprid; tiametoxam; clotianidin; isoprocarb; metamidofós; metomil; mevinfós; paratión; paration-metilo; fosalona; pirimicarb; propoxur; teflubenzurón; terbufós; triazamato; fenobucarb; tebufenozida; fipronil; beta-ciflutrina; silafluofen; fenpiroximato; piridaben; fenazaquin; pirproxifen; pirimidifen; nitenpiram; acetamiprid; emamectina; emamectina-benzoato; spinosad; un extracto de planta que funciona activamente contra los insectos; una preparación que incluye nemátodos y es activa contra los insectos; una preparación obtenible del *Bacillus subtilis*; una preparación que incluye hongos y es activa contra los insectos; una preparación que incluye virus y es activa contra los insectos; clorfenapir; acefato; acrinatrin; alanicarb; alfametrina; amitraz; AZ 60541; azinfós A; azinfós M; azociclotín; bendlocarb; bensultap; beta-ciflutrina; BPMC; brofenprox; bromofós A; bufencarb; butocarboxin; butilpiridaben; cadusafós; carbarilo; carbofenotión; cloetocarb; cloretoxifós; clormefós; cis-resmetrina; clocitrina; clofentezina; cianofós; cicloprotrina; cihexatina; demetón M; demetón S; demetón-S-metilo; diclofentión; diclifós; dietión; dimetoato; dimetilvinfós; dioxatión; edifenfós; esfenvalerato; etión; etofenprox; etoprofós; etrimfós; fenamifós; óxido de fenbutatina; fenotiocarb; fenpropatrina; fenpirad; fentión; fluacinam; fluciclofurón; flucitrinato; flufenoxurón; flufenprox; fonofós; fostiazato; fubfenprox; HCH; hexaflumurón; hexitiazox; IKI-220; iprobenfós; isofenfós; isoxation; ivermectina; malation; mecarbam; mesulfenfos; metaldehído; metolcarb; milbemectina;

moxidectina; naled; NC 184; ometoato; oxamilo; oxidemetón M; oxideprofós; permetrina; fentoato; forato; fosmet; foxim; pirimifós M; pirimifós E; promecarb; propafós; protiofós; protoato; piraclofós; piradafentlon; piresmetrina; piretrum; tebufenozida; salitión; sebufós; sulfotep; sulprofós; tebufenpirad; tebupirimfós; teflutrina; temefós; terbam; tetraclorvinfós; tiaclopid; tiafenox; tiodicarb; tiofanox; tionazin; turingiensina; tralometrina; triaratenó; triazofós; triazurón; triclofón; triflumurón; trimetacarb; vamidotión; xililcarb; YI 5301/5302; cetametrina; DPX-MP062 — indoxacarb; metoxifenoza; bifenazato; XMC (3,5-xililmetilcarbamato); o los hongos patógenos *Metarhizium anisopliae*.

Las siguientes mezclas de compuestos de la fórmula I con un miembro del grupo M son preferidas (en el siguiente listado, "M" significa un miembro seleccionado del grupo M.)

T1.1 + M; T38.3 + M; T37.3 + M; T20.1 + M; T1.3 + M; T1.121 + M; T2.1 + M; T2.3 + M; T6.1 + M; T6.3 + M; T7.1 + M; T7.3 + M; T21.3 + M; T22.3 + M; T46.1 + M; T46.3 + M; T50.1 + M; T50.3 + M; T51.1 + M; T51.3 + M; T52.1 + M; T52.3 + M; T53.1 + M; T53.3 + M; T72.1 + M; T72.3 + M; T72.207 + M; T72.273 + M; T73.1 + M; T73.3 + M; T73.207 + M; T73.273 + M; T74.1 + M; T74.3 + M; T75.1 + M; T75.3 + M; T76.1 + M; T76.3 + M; T77.1 + M; T77.3 + M; T78.1 + M; T78.3 + M; T79.1 + M; T80.3 + M; T81.1 + M; T81.3 + M; T82.1 + M; T83.3 + M; T84.3 + M and T85.3 + M; P2.001 + M; P2.002 + M; P2.003 + M; P2.004 + M; P2.005 + M; P2.006 + M; P2.007 + M; P2.008 + M; P2.009 + M; P2.010 + M; P2.011 + M; P2.012 + M; P2.013 + M; P2.014 + M; P2.015 + M; P2.016 + M; P2.017 + M; P2.018 + M; P2.019 + M; P2.020 + M; P2.021 + M; P2.022 + M; P2.023 + M; P2.024 + M; P2.025 + M; P2.026 + M; P2.027 + M; P2.028 + M; P2.029 + M; P2.030 + M; P2.031 + M; P2.032 + M; P2.033 + M; P2.034 + M; P2.035 + M; P2.036 + M; P2.037 + M; P2.038 + M; P2.039 + M; P2.040 + M; P2.041 + M; P2.042 + M; P2.043 + M; P2.044 + M; P2.045 + M; P2.046 + M;

P2.047 + M; P2.048 + M; P2.049 + M; P2.050 + M; P2.051 + M; P2.052 + M;
 P2.053 + M; P2.054 + M; P2.055 + M; P2.056 + M; P2.057 + M; P2.058 + M;
 P2.059 + M; P2.060 + M; P2.061 + M; P2.062 + M; P2.063 + M; P2.064 + M;
 P2.065 + M; P2.066 + M; P2.067 + M; P2.068 + M; P2.069 + M; P2.070 + M;
 P2.071 + M; P2.072 + M; P2.073 + M; P2.074 + M; P2.075 + M; P2.076 + M;
 P2.077 + M; P2.078 + M; P2.079 + M; P2.080 + M; P2.081 + M; P2.082 + M;
 P2.083 + M; P2.084 + M; P2.085 + M; P2.086 + M; P2.087 + M; P2.088 + M;
 P2.089 + M; P2.090 + M; P2.091 + M; P2.092 + M; P2.093 + M; P2.094 + M;
 P2.095 + M; P2.096 + M; P2.097 + M; P2.098 + M; P2.099 + M; P2.100 + M;
 P2.101 + M; P2.102 + M; P2.103 + M; P2.104 + M; P2.105 + M; P2.106 + M;
 P2.107 + M; P2.108 + M; P2.109 + M; P2.110 + M; P2.111 + M; P2.112 + M;
 P2.113 + M; P2.114 + M; P2.115 + M; P2.116 + M; P2.117 + M; P2.118 + M;
 P2.119 + M; P2.120 + M; P2.121 + M; P2.122 + M; P2.123 + M; P2.124 + M;
 P2.125 + M; P2.126 + M; P2.127 + M; P2.128 + M; P2.129 + M; P2.130 + M;
 P2.131 + M; P2.132 + M; P2.133 + M; P2.134 + M; P2.135 + M; P2.136 + M;
 P2.137 + M; P2.138 + M; P2.139 + M; P2.140 + M; P2.141 + M; P2.142 + M;
 P2.143 + M; P2.144 + M; P2.145 + M; P2.146 + M; P2.147 + M; P2.148 + M;
 P2.149 + M; P2.150 + M; P2.151 + M; P2.152 + M; P2.153 + M; P2.154 + M;
 P2.155 + M; P2.156 + M; P2.157 + M; P2.158 + M; P2.159 + M; P2.160 + M;
 P2.161 + M; P2.162 + M; P2.163 + M; P2.164 + M y P2.165 + M.

Las composiciones también pueden incluir auxiliares sólidos o líquidos
 ulteriores, tales como estabilizantes, por ejemplo aceites vegetales no epoxidados
 o epoxidados (por ejemplo aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja
 epoxidado), antiespumantes, por ejemplo aceite de silicona, conservantes,
 reguladores de viscosidad, aglutinantes y agentes de la pegajosidad, fertilizantes
 u otros ingredientes activos para lograr efectos específicos, por ejemplo

bactericidas, funguicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas or herbicidas.

Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de un modo conocido per se, en ausencia de auxiliares por ejemplo moliendo, filtrando y/o comprimiendo un ingrediente sólido activo y en presencia de por lo menos un auxiliar por ejemplo mezclando bien y/o moliendo el ingrediente activo con el auxiliar (auxiliares). Estos procesos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos de la fórmula I para el preparado de estas composiciones son también un objeto de la invención.

Los métodos de aplicación para las composiciones, esto es los métodos para el control de plagas del tipo anteriormente mencionado, tales como rociar, atomizar, espolvorear, cepillar, recubrir, esparcir o verter – que deben seleccionarse para alcanzar los objetivos deseados de las circunstancias predominantes – y la utilización de las composiciones para el control de plagas del tipo anteriormente mencionado son otros objetivos de la invención. Los índices típicos de concentración están entre 0,1 y 1000 ppm, preferentemente entre 0,1 y 500 ppm, de ingrediente activo. El índice de aplicación por hectárea es generalmente 1 a 2000 g de ingrediente activo por hectárea, en particular 10 a 1000 g/ha, preferentemente 10 a 600 g/ha.

Un método preferido de aplicación en el área de la protección de cultivos es aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), esto es posible para seleccionar frecuencia e índice de aplicación para que coincidan el riesgo de infestación con la peste en cuestión. Alternativamente, el ingrediente activo puede alcanzar las plantas a través del sistema de raíces (acción sistémica), empapando el emplazamiento de las plantas con una composición líquida o incorporando el ingrediente activo en forma sólida dentro del emplazamiento de las plantas, por ejemplo en la tierra, por ejemplo en forma de gránulos (aplicación en la tierra). En

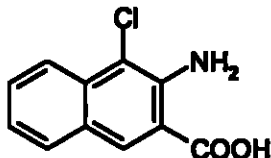
el caso de cultivos de arroz, tales gránulos pueden medirse dentro del arrozal inundado.

Las composiciones de acuerdo con la invención son también adecuadas para proteger el material de propagación de plantas, por ejemplo semillas, tales como frutales, tubérculos o granos, o plantas de vivero, contra las plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación puede tratarse con las composiciones antes de plantar, por ejemplo la semilla puede tratarse antes de sembrar. De manera alternativa, las composiciones pueden aplicarse a granos (revestimiento), o bien empapando los granos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo en el surco de las semillas durante la siembra. Estos métodos de tratamiento para el material de propagación de plantas y el material de propagación de plantas así tratado son objetivos adicionales de la invención.

Los ejemplos que siguen intentan ilustrar la invención. Sin embargo, no limitan la invención. Las temperaturas se muestran en grados Celsius. La abreviatura "P. F." significa "punto de fusión".

Ejemplos de preparación

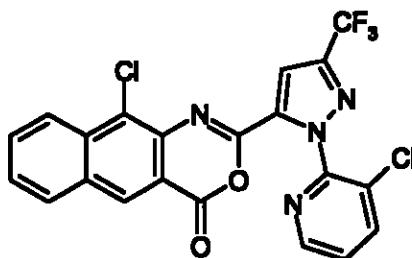
Ejemplo P1



1,9 g (14,7 mmol) de N-clorosuccinimida y 10 mg de nitrilo 2,2'-azoisobutírico se agregan a la suspensión de 2,5 g (13,3 mmol) de 2-amino-3-carboxi-naftaleno en 100 ml de tetraclorometano. La mezcla reactiva se revuelve durante 18 horas a temperatura ambiente, se trata con 250 ml de solución de cloruro de sodio acuoso y se remueve con acetato etílico (3 x 250 ml). Las capas

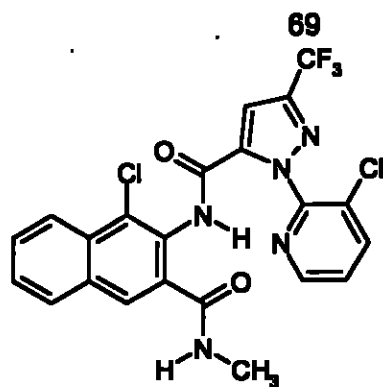
orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se filtran, y el filtrado se concentra en vacío. Esto proporciona el compuesto del título en la forma de un sólido marrón [^1H -RMN (CDCl_3): 8,53 (s, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,25 (t, 1H)].

Ejemplo P2



En una atmósfera de nitrógeno se agregan 0,5 ml (5,75 mmol) de cloruro de oxalilo en forma de gotas a temperatura ambiente revolviendo hasta una suspensión de 295 mg (1,0 mmol) de 5-carboxi-1-(3-cloropirid-2-il)-3-trifluormetil-pirazol en 2 ml de diclorometano. La mezcla reactiva se revuelve durante 1 hora y luego se agrega en forma de gotas a una solución de 0,25 g (1 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P1 en una mezcla de 20 ml de diclorometano y 0,38 ml de trietilamina. La mezcla reactiva se revuelve posteriormente durante 3 horas. Se agregan otros 0,7 ml de trietilamina, seguidos por el agregado de una porción simple de 0,22 ml (2,8 mmol) de cloruro de ácido metansulfónico. La mezcla reactiva se revuelve luego durante 18 horas y se concentra en vacío, y el residuo se purifica mediante cromatografía en columna [gel de sílice; hexano/acetato de etilo (3:1)], lo cual proporciona el compuesto del título [^1H -RMN (CDCl_3): 8,78 (s, 1H), 8,61 (m, 1H), 8,30 (m, 2H), 8,03 (dd, 1H), 7,78 (m, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,56 (m, 2H); EM (electropulverización): 477, 479, 481 ((M+H) $^+$)].

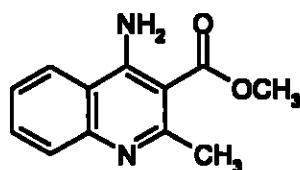
Ejemplo P3



(T1.1)

En una atmósfera de nitrógeno se agrega 1 ml de una solución (2,0 M) de metilamina en tetrahidrofurano anhidro con agitación hasta una solución de 0,07 g (0,15 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P2 en 5 ml of tetrahidrofurano anhidro. La mezcla reactiva se calienta a 50° durante 1 hora, se deja enfriar a temperatura ambiente y se concentra en vacío, y el residuo se purifica por cromatografía en columna [gel de sílice; hexano, seguido de hexano/acetato de etilo (3:1)], que da el compuesto del título T1.1 [¹H-RMN (DMSO-d₆): 10,80 (s, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,45 (br s, 1H), 8,21 (m, 2H), 8,08 (m, 2H), 7,87 (s, 1H), 7,78 (t, 1H), 7,70 (t, 1H), 7,64 (dd, 1H), 2,70 (d, 3H); EM (electropulverización): 508, 510, 512 ((M+H)⁺)].

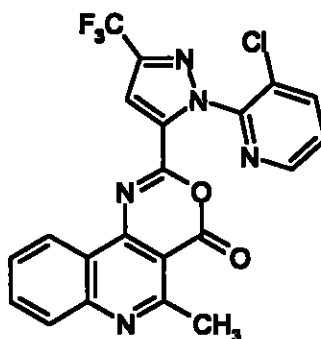
Ejemplo P4



0,91 ml (8,46 mmol de acetoacetato de metilo y 1,98 ml (16,9 mmol) de tetracloruro de estaño se agregan a una solución de 1 g (8,46 mmol) de 1-amino-2-ciano-benceno en 20 ml de tolueno. La mezcla reactiva se calienta hasta reflujo durante 2 horas, se deja enfriar hasta temperatura ambiente y se concentra en vacío. El residuo se suspende en 250 ml de solución de carbonato de sodio acuoso, y la suspensión se agita durante 30 minutos, se la deja reposar durante toda la noche y luego se extrae con acetato etílico (3 x 250 ml). Las capas

orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se filtran, el filtrado se concentra en vacío, y el residuo sólido amarillo se tritura con éter dietílico. Esto otorga el compuesto del título en forma de un polvo amarillo [^1H -RMN (CDCl_3): 7,88 (d, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 7,06 (br s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,82 (s, 3H); EM (electropulverización): 217 ($(\text{M}+\text{H})^+$)].

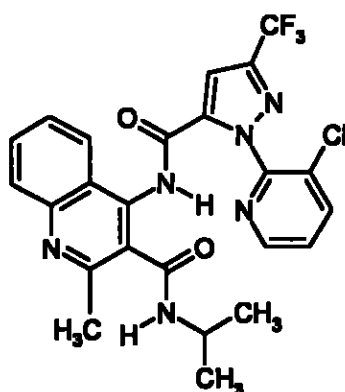
Ejemplo P5



En una atmósfera de nitrógeno 4 gotas de N,N-dimetilformamida y luego 0,08 ml (0,93 mmol) de cloruro de oxalilo se agregan en forma de gotas a temperatura ambiente revolviendo hasta una suspensión de 250 mg (0,86 mmol) de 5-carboxi-1-(3-cloropirid-2-il)-3-trifluormetil-pirazol en 10 ml de diclorometano. La mezcla reactiva se revuelve durante 1 hora, el solvente se remueve en vacío, y el residuo se co-evapora tres veces con tolueno y luego se suspende en 3 ml de tolueno para resultar en la suspensión "A". 105 mg (0,858 mmol) de 4-dimetilaminopiridina se agregan a una suspensión de 185 mg (0,858 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P4 en 3 ml de tolueno para otorgar la suspensión "B". La suspensión "A" se agrega a la suspensión "B", por un traslado completo de la suspensión "A" al frasco de reacción el recipiente que contiene la suspensión "A" se enjuaga con una pequeña cantidad de una mezcla de tolueno y algunas gotas de N,N-dimetilformamida. La mezcla reactiva se calienta hasta reflujo durante 3 horas y luego se deja enfriar hasta temperatura ambiente. El precipitado amarillo se filtra y se lava con éter dietílico. El filtrado se lava con 10 ml de agua, y el agua se vuelve a extraer con acetato etílico (2 x 50 ml). Las capas orgánicas

combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se filtran, el filtrado se concentra en vacío, y el residuo se purifica por cromatografía de columna [gel de sílice; hexano/ acetato de etilo (1:2)], lo cual da el compuesto del título [^1H -RMN (CDCl_3): 8,66 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 8,03 (d, 1H), 7,86 (t, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,40 (dd, 1H), 3,09 (s, 3H); EM (electropulverización): 458 $((\text{M}+\text{H})^+)$].

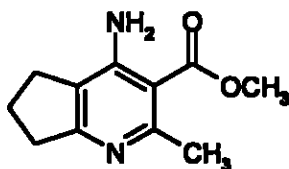
Ejemplo P6



(T38.3)

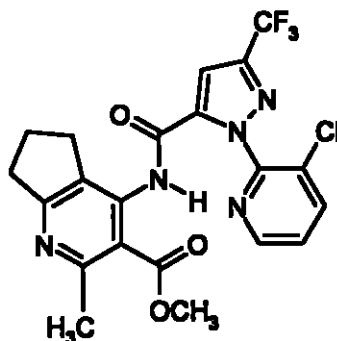
Se agregan 0,022 ml (0,262 mmol) de isopropilamina revolviendo hasta una suspensión de 40 mg (0,087 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P5 en 1 ml de tetrahidrofurano anhidro. La mezcla reactiva se calienta a 60° durante 90 minutos, se deja enfriar a temperatura ambiente y se concentra en vacío, y el residuo se purifica por cromatografía de columna [gel de sílice; metanol/diclorometano (1:9)], que da el compuesto del título T38.3 [^1H -RMN (CDCl_3): 11,17 (s, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,71 (t, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,36 (m, 1H), 6,31 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 2,30 (s, 3H), 1,16 (d, 6H); EM (electropulverización): 517 $((\text{M}+\text{H})^+)$].

Ejemplo P7



Comenzando por 1-amino-2-ciano-ciclopent-1-eno, puede prepararse el compuesto del título de manera análoga al procedimiento descrito en el Ejemplo P4 [^1H -RMN (CDCl_3): 5,77 (br s, 2H), 3,90 (s, 3H), 2,97 (m, 2H), 2,70 (m, 2H), 2,15 (m, 2H); EM (electropulverización): 207 ((M+H) $^+$)].

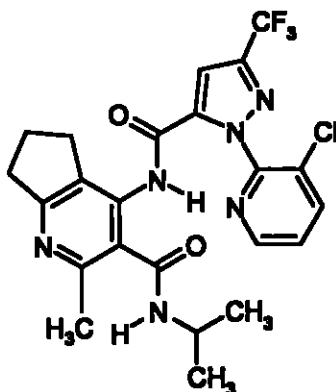
Ejemplo P8



En una atmósfera de nitrógeno 4 gotas de N,N-dimetilformamida y luego 0,16 ml (1,86 mmol) de cloruro de oxalilo se agregan en forma de gotas a temperatura ambiente revolviendo hasta una suspensión de 0,5 g (1,72 mmol) de 5-carboxi-1-(3-cloropirid-2-il)-3-trifluometil-pirazol en 20 ml de diclorometano. La mezcla reactiva se revuelve durante 90 minutos, el solvente se remueve en vacío, y el residuo se co-evapora tres veces con tolueno y luego se disuelve en 10 ml de tetrahidrofurano para dar la solución "A". 0,24 ml (1,72 mmol) de trietilamina se agregan a una suspensión de 195 mg (0,95 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P7 en 10 ml de tetrahidrofurano para dar la suspensión "B". 5 ml de la solución "A" se agregan en porciones durante un período de 30 minutos a la suspensión "B". La mezcla reactiva se revuelve durante 2,5 horas, se trata con 10 ml de solución acuosa de carbonato de hidrógeno y sodio y se extrae con acetato etílico (2 x 40 ml). Las capas orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se filtran, el filtrado se concentra en vacío, y el residuo se purifica por cromatografía en columna (gel de sílice; acetato etílico), que da el compuesto del título [^1H -RMN (CDCl_3): 10,15 (s, 1H), 8,49 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,45 (m, 1H),

7,22 (s, 1H), 3,96 (s, 3H), 2,99 (m, 2H), 2,75 (m, 2H), 2,67 (s, 3H), 2,06 (m, 2H);
EM (electropulverización): 480 ((M+H)⁺).

Ejemplo P9



(T37.3)

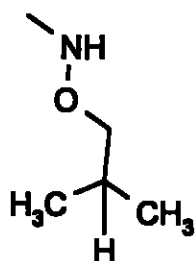
Se agregan 0,04 ml (0,47 mmol) de isopropilamina a temperatura ambiente revolviendo hasta una mezcla de 0,24 ml de una solución (2,0 M) de trimetilaluminio en hexano y 3 ml de diclorometano. La mezcla reactiva se revuelve durante 40 minutos. Se agrega una solución de 110 mg (0,22 mmol) del compuesto del título del Ejemplo P8 en 3 ml de diclorometano, y la mezcla reactiva se calienta hasta reflujo durante 6 horas, se deja enfriar hasta temperatura ambiente y reposar toda la noche y luego se vuelca en 20 ml de agua. La mezcla se extrae con diclorometano (2 x 30 ml). Las capas orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio y se filtran, el filtrado se concentra en vacío, y el residuo se purifica por cromatografía en columna [gel de sílice; hexano/ acetato de etilo (2:1), seguido de acetato etílico puro], que da el compuesto del título T37.3 [¹H-RMN (CDCl₃): 10,69 (s, 1H), 8,49 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,42 (m, 1H), 5,89 (d, 1H), 4,24 (m, 1H), 2,87 (t, 2H), 2,57 (t, 2H), 2,49 (s, 3H), 2,02 (m, 2H), 1,19 (d, 6H); EM (electropulverización): 507 ((M+H)⁺).

Ejemplo P10

292

292

Los compuestos alistados en la tabla P1 y P2 pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos descritos en los Ejemplos P1 al P9. Los puntos de fusión se muestran en °C. En las estructuras siguientes, los átomos de hidrógeno terciario enlazados a átomos de carbono no están ilustrados por ej. el grupo



se ilustra como sigue:

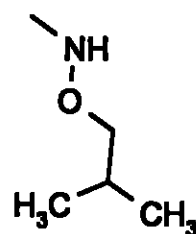
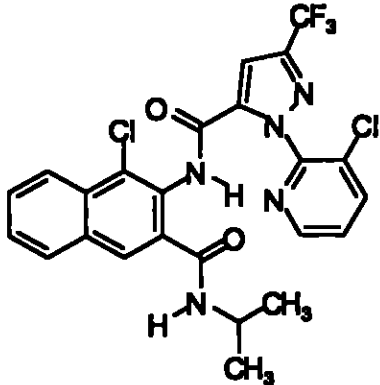
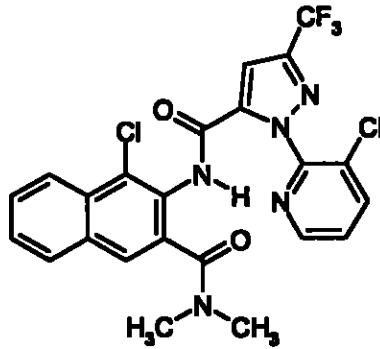
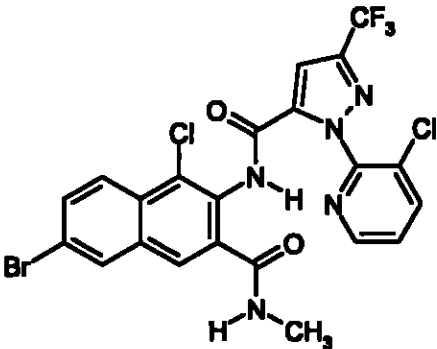


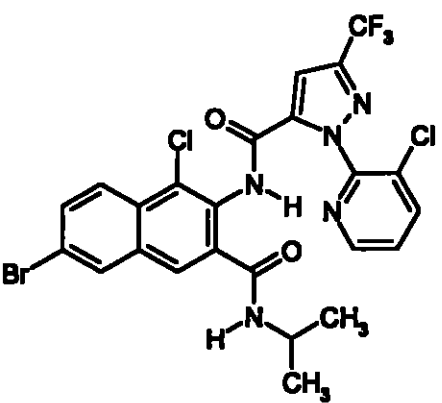
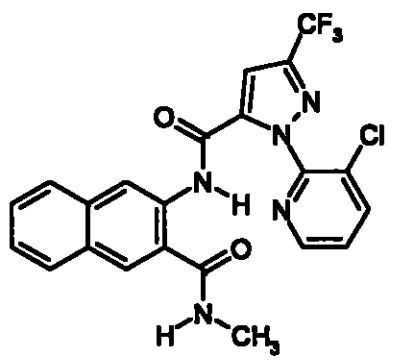
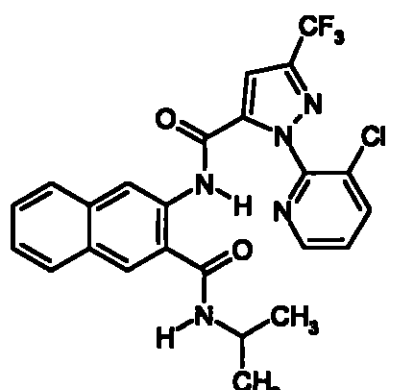
Tabla P1:

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T1.3 	Electropulverización: 536, 538, 540 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 8,43 (d, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,64 (s, 1H), 7,59 (t, 2H), 7,33 (m, 2H), 7,22 (m, 1H), 6,19 (d, 1H), 4,19 (m, 1H), 1,18 (d, 6H).	
T1.121 	Electropulverización: 522, 524, 526 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 10,95 (s, 1H), 8,43 (dd, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,35 (m, 3H), 7,16 (t, 1H), 2,77 (s, 3H), 2,71 (s, 3H).	
T2.1 	Electropulverización: 584, 586, 588, 590 ((M-H)⁺).	DMSO-d₆: 10,82 (s, 1H), 8,52 (dd, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,89 (m, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,64 (dd, 1H), 2,69 (d, 3H).	

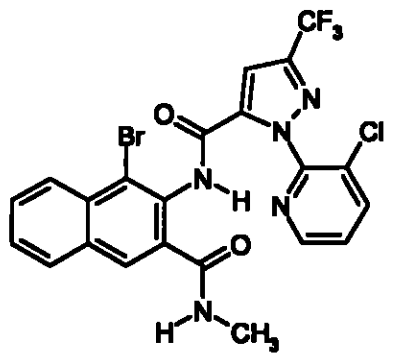
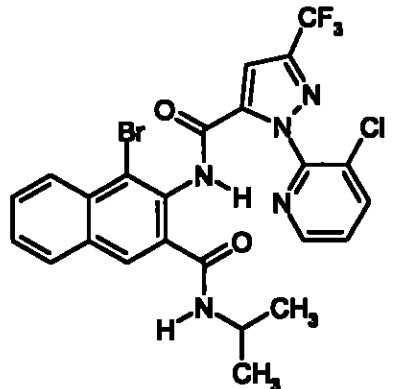
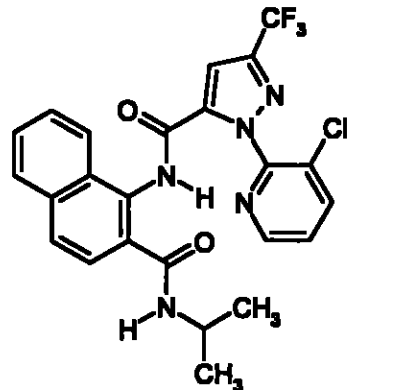
294

294

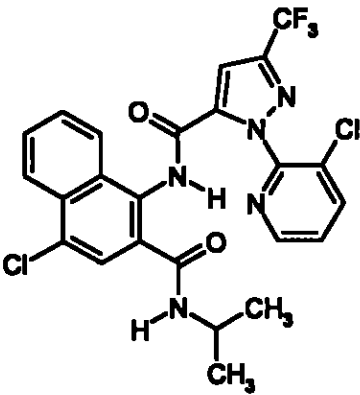
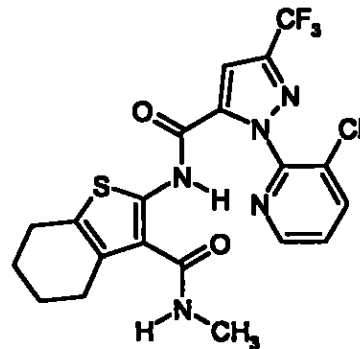
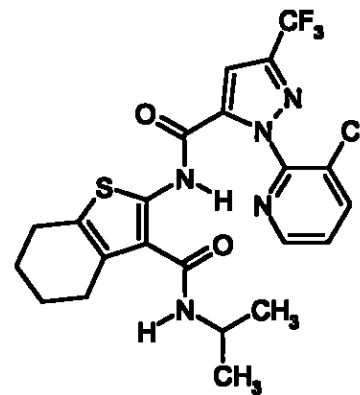
76

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T2.3 	Electropulverización: 614, 616, 618 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 10,80 (s, 1H), 8,50 (dd, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,88 (m, 1H), 7,63 (dd, 1H), 3,92 (m, 1H), 1,06 (d, 6H),	
T6.1 	Electropulverización: 474, 476 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 12,75 (s, 1H), 9,13 (d, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,91 (m, 2H), 7,74 (dd, 1H), 7,55 (m, 3H), 2,89 (d, 3H),	
T6.3 	Electropulverización: 502, 504 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 12,55 (s, 1H), 8,90 (d, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,73 (dd, 1H), 7,55 (m, 3H), 4,21 (m, 1H), 1,23 (d, 6H),	

295
7
295

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T7.1 	Electropulverización: 552, 554, 556 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 10,80 (s, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,42 (s, 1H), 8,20 (m, 2H), 8,11 (s, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,75 (t, 1H), 7,64 (m, 2H), 2,70 (d, 3H),	
T7.3 	Electropulverización: 580, 582, 584 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 10,65 (s, 1H), 8,43 (d, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,81 (d, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,34 (m, 2H), 7,21 (t, 1H), 6,12 (d, 1H), 4,20 (m, 1H), 1,17 (d, 6H),	
T21.3 	Electropulverización: 502, 504 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 10,97 (s, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,84 (m, 2H), 7,75 (s, 1H), 7,72 (m, 1H), 7,49 (m, 2H), 7,37 (m, 2H), 7,11 (d, 1H), 6,15 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 1,19 (d, 6H),	

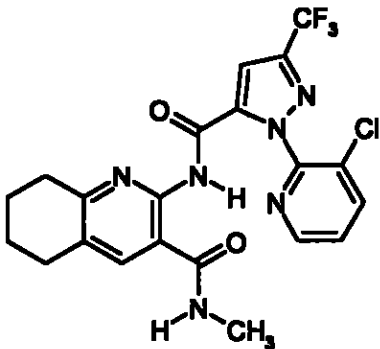
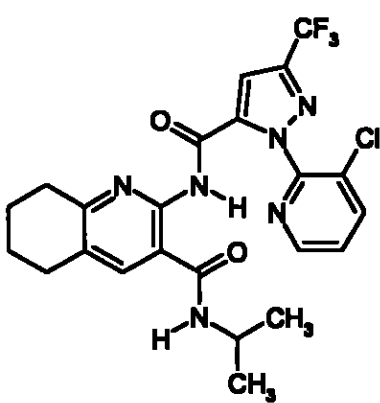
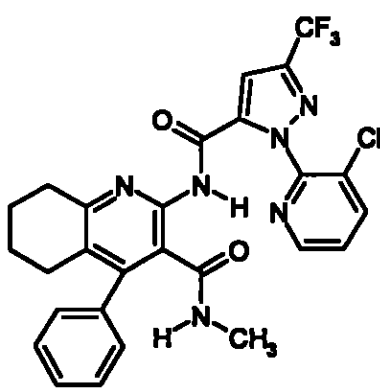
i
:
:
i

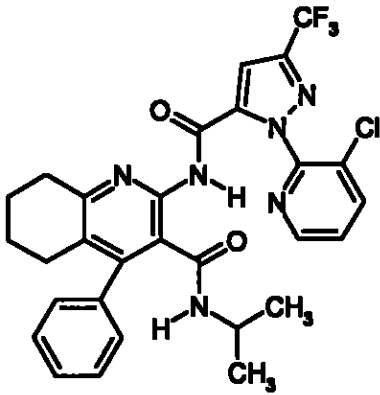
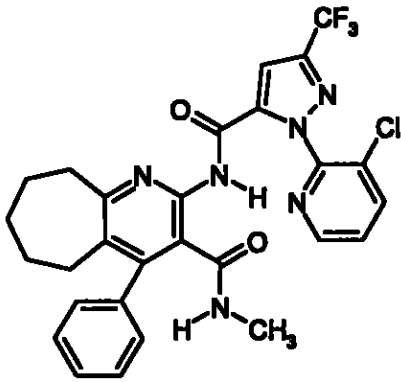
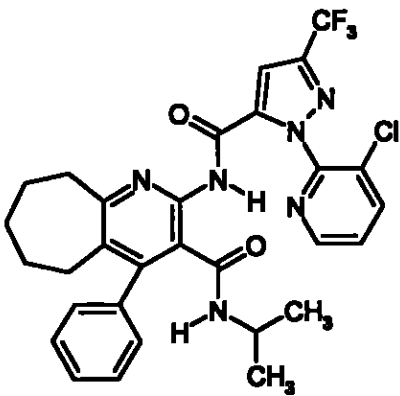
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T22.3 	Electropulverización: 536, 538 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 11,00 (s, 1H), 8,43 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 (m, 2H), 7,58 (m, 2H), 7,36 (m, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,12 (d, 1H), 4,20 (m, 1H), 1,20 (d, 6H).	
T46.1 			261 - 263
T46.3 			246 - 248

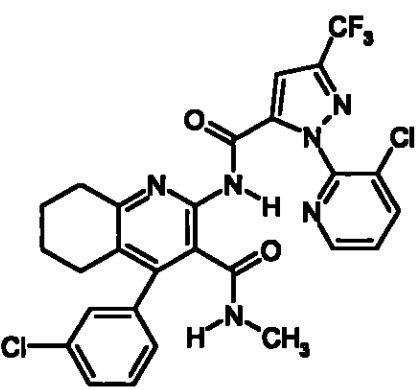
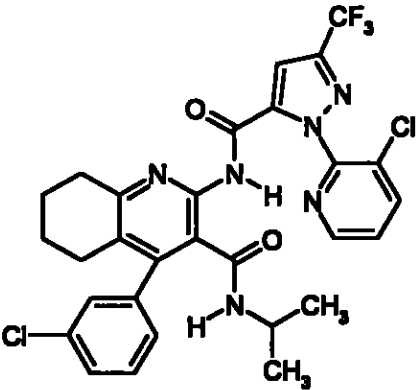
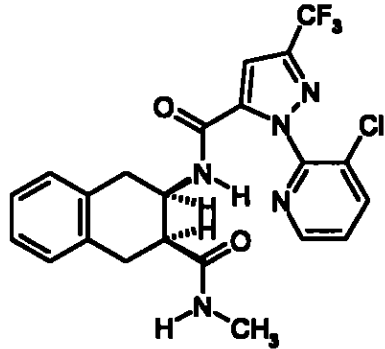
297

297

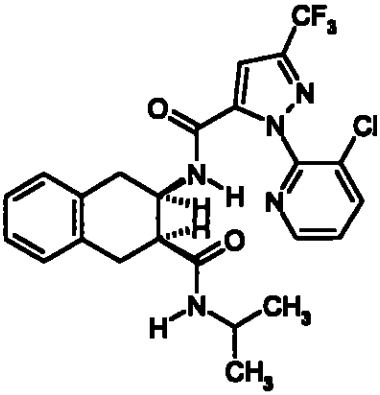
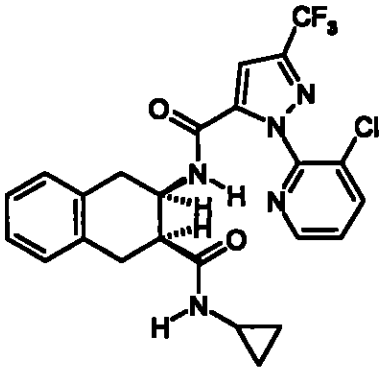
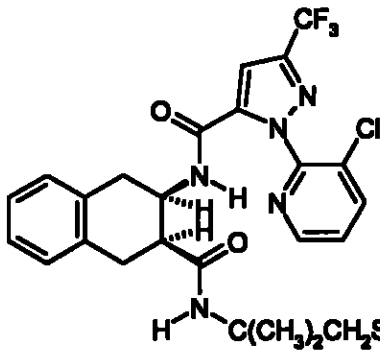
79

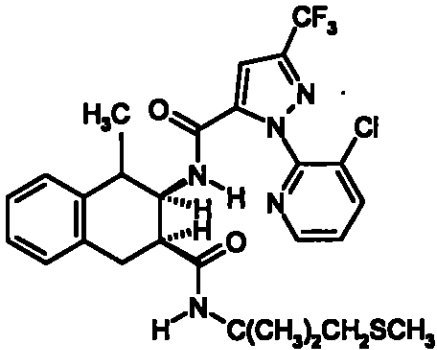
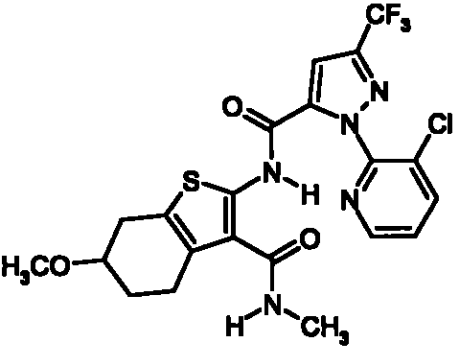
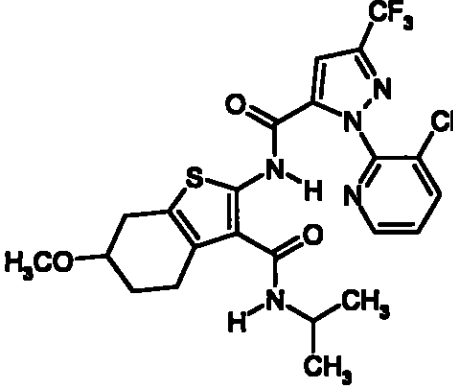
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T50.1 			145 – 147
T50.3 			143 – 145
T51.1 			165 – 168

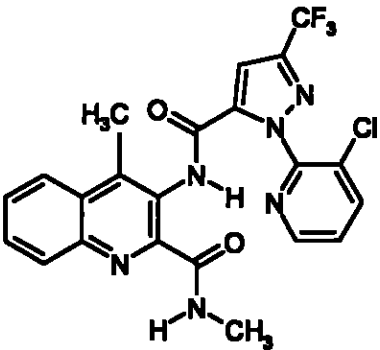
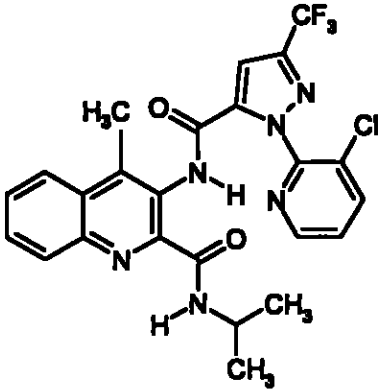
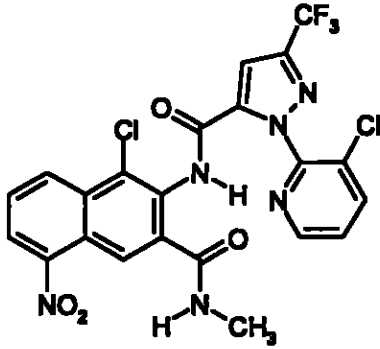
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T51.3 			146 - 148
T52.1 			211 - 213
T52.3 			269 - 270

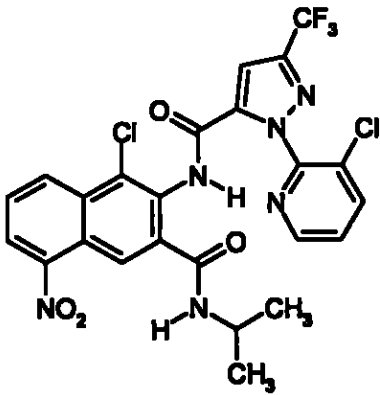
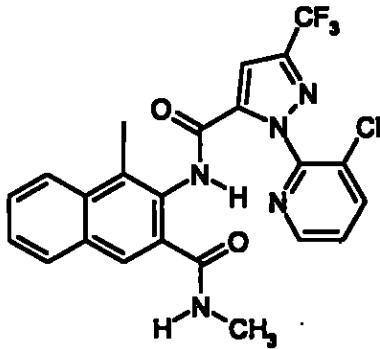
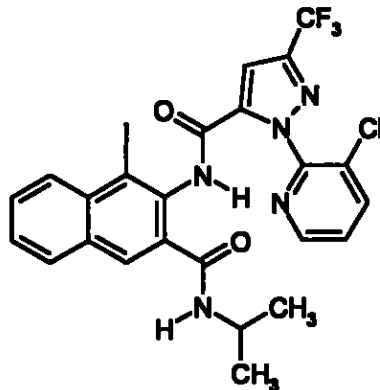
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T53.1 			183 - 185
T53.3 			259 - 260
T72.1 			226 - 228

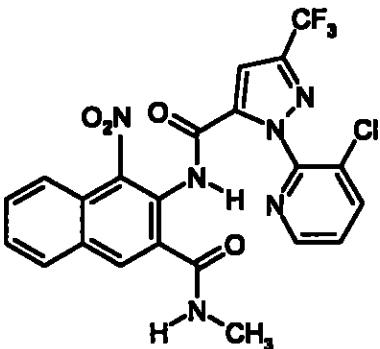
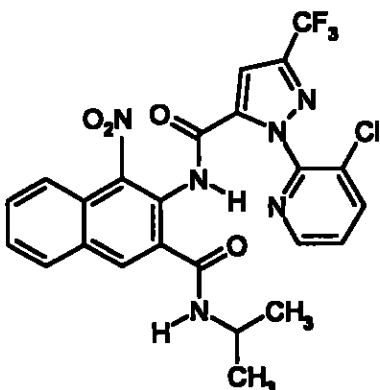
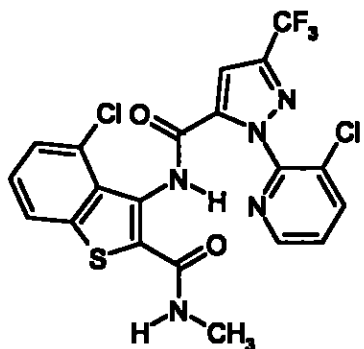
300
300

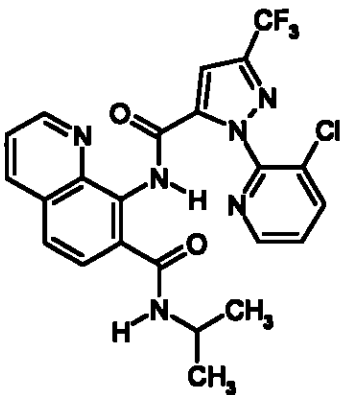
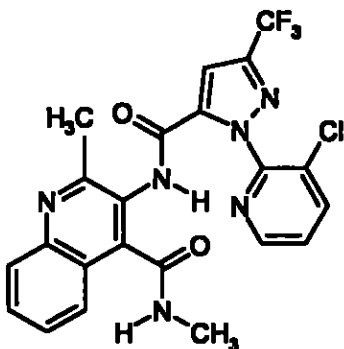
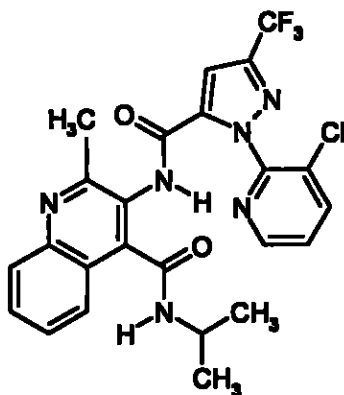
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T72.3 			229 – 232
T72.207 			230 – 233
T72.273 			184 – 186

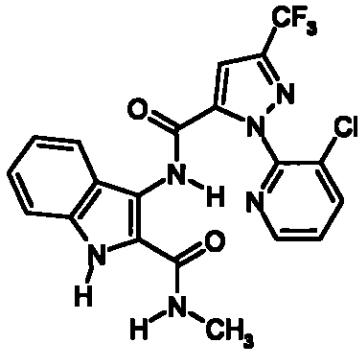
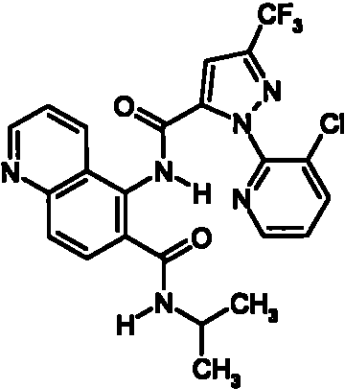
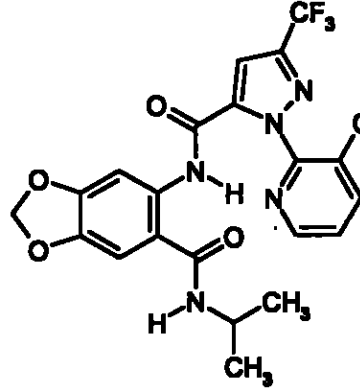
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T73.273 	Electropulverización: 580 ((M+H) ⁺).		
T74.1 			133 - 135
T74.3 			206 - 207

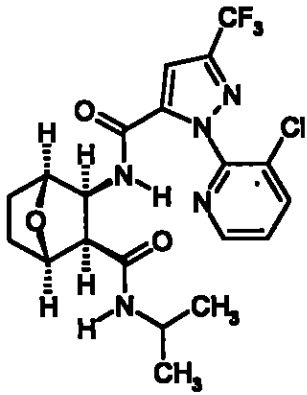
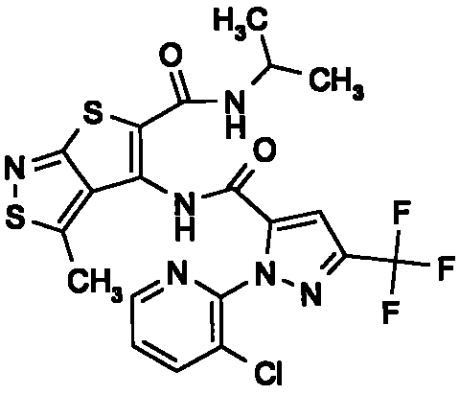
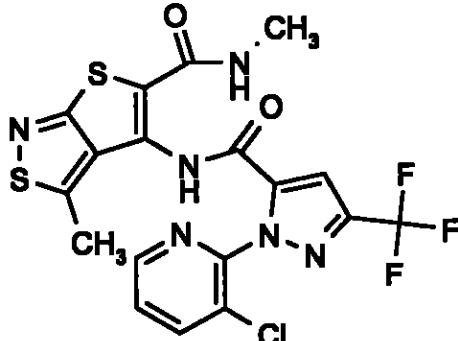
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T75.1 	Electropulverización: 489 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 11,97 (s, 1H), 8,50 (br s, 1H), 8,49 (dd, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,61 (m, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,41 (m, 1H), 3,09 (d, 3H), 2,52 (s, 3H).	
T75.3 	Electropulverización: 517 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 12,06 (s, 1H), 8,49 (dd, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,69 (m, 1H), 7,61 (m, 1H), 7,44 (s, 1H), 7,41 (m, 1H), 4,30 (m, 1H), 2,52 (s, 3H), 1,35 (d, 6H).	
T76.1 		CDCl₃: 8,47 (d, 1H), 8,17 (s, 1H), 8,13 (d, 1H), 8,08 (m, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,67 (m, 1H), 7,48 (m, 1H), 2,93 (d, 3H).	

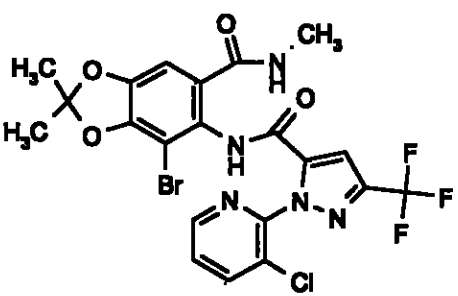
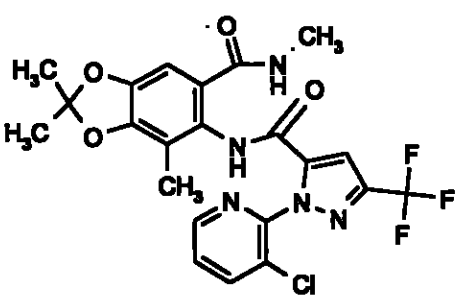
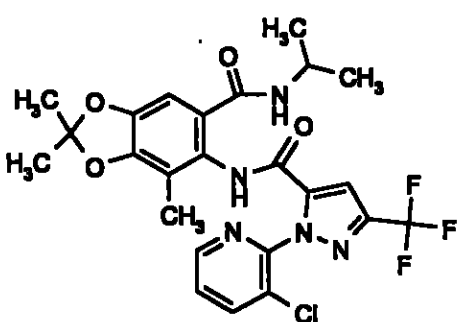
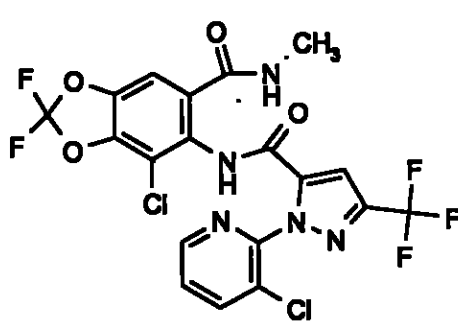
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T76.3 	Electropulverización: 581 ((M+H)⁺).	CDCl ₃ : 10,95 (s, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,47 (dd, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 4,02 (m, 1H), 1,11 (d, 6H),	
T77.1 	Electropulverización: 600 ((M+H)⁺).	CDCl ₃ : 10,29 (s, 1H), 8,47 (dd, 1H), 7,85 (dd, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,38 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 6,26 (m, 1H), 2,96 (d, 3H),	
T77.3 	Electropulverización: 628 ((M+H)⁺).	CDCl ₃ : 10,61 (s, 1H), 8,45 (dd, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,83 (dd, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,36 (m, 2H), 7,24 (m, 1H), 6,10 (d, 1H), 4,20 (m, 1H), 1,16 (d, 6H),	

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T78.1 	Electropulve rización: 519 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 10,82 (br s, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,45 (m, 1H), 7,28 (s, 1H), 6,58 (br s, 1H), 2,98 (d, 3H),	
T78.3 	Electropulve rización: 547 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 11,02 (br s, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,59 (m, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,40 (m, 1H), 6,20 (br s, 1H), 4,27 (m, 1H), 1,27 (d, 6H),	
T79.1 	Electropulve rización: 514 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 9,15 (s, 1H), 8,53 (dd, 1H), 8,22 (dd, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,66 (m, 1H), 7,47 (m, 2H), 2,77 (s, 3H),	

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T80.3 	Electropulve rización: 503, 505 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10,10 (s, 1H), 8,87 (d, 1H), 8,43 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,58 (m, 2H), 7,49 (m, 2H), 7,38 (m, 1H), 6,01 (d, 1H), 4,17 (m, 1H), 1,14 (d, 6H),	
T81.1 	Electropulve rización: 489 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10,20 (s, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,76 (t, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,41 (m, 1H), 6,45 (m, 1H), 3,04 (d, 3H), 1,94 (s, 3H),	
T81.3 	Electropulve rización: 517 ((M+H) ⁺).	CDCl ₃ : 10,49 (s, 1H), 8,44 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,75 (t, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,54 (t, 1H), 7,39 (m, 1H), 6,29 (d, 1H), 4,28 (m, 1H), 1,81 (s, 3H), 1,18 (d, 6H),	

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T82.1 	Electropulve rización: 463 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 11,58 (s, 1H), 10,65 (s, 1H), 8,57 (dd, 1H), 8,26 (dd, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,84 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,21 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 2,82 (s, 3H),	
T83.3 	Electropulve rización: 503, 505 ((M+H)⁺).	CDCl₃: 11,22 (s, 1H), 8,90 (m, 1H), 8,44 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,40 (m, 2H), 7,30 (d, 1H), 6,22 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 1,22 (d, 6H),	
T84.3 	Electropulve rización: 496, 498 ((M+H)⁺).	DMSO-d₆: 13,48 (s, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,02 (m, 2H), 7,56 (m, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,29 (s, 1H), 6,00 (s, 2H), 4,28 (m, 1H), 1,26 (d, 6H),	

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T85.3 			220 – 224
T88.3 			261- 263
T88.1 			264- 266

Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T89.1 			274-276
T90.1 			242-244
T90.3 			256-258
T91.1 			265-267

92

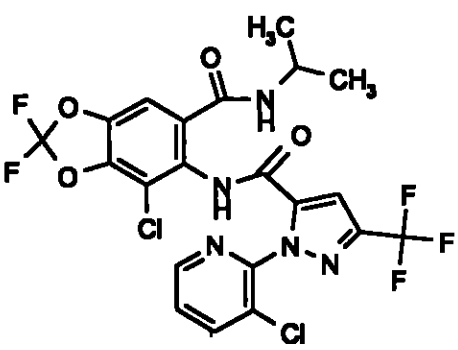
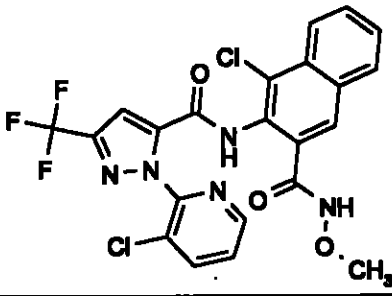
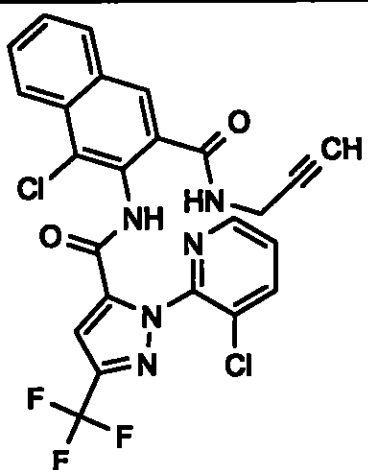
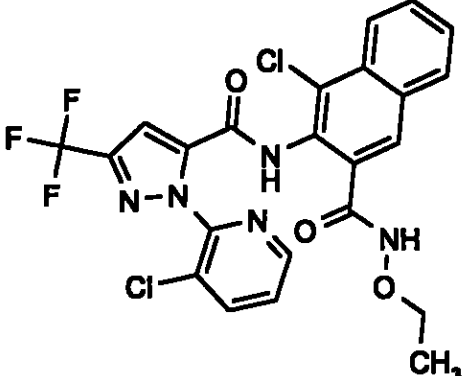
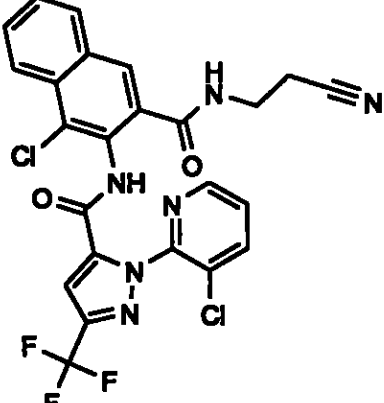
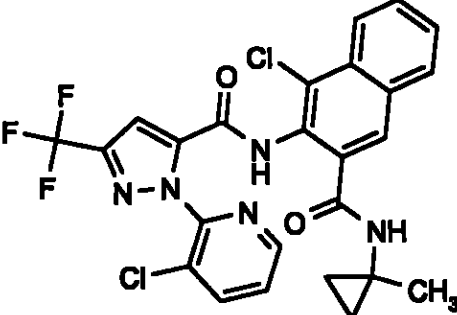
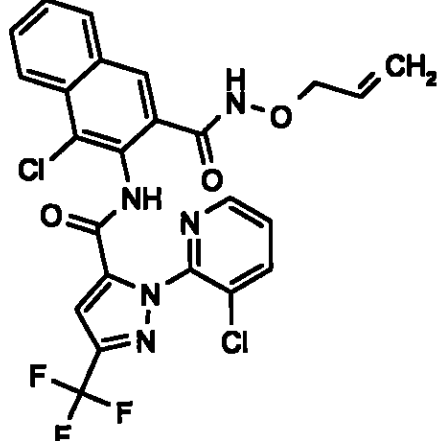
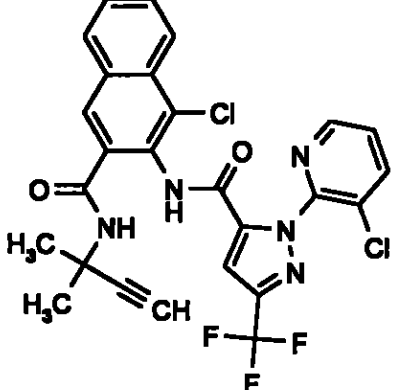
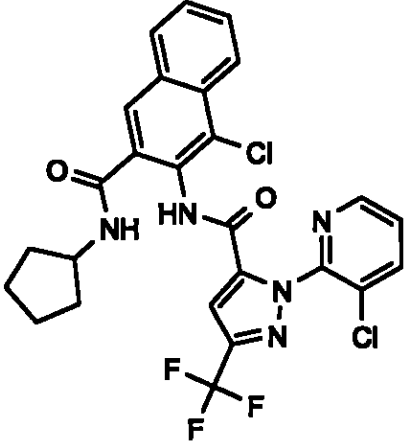
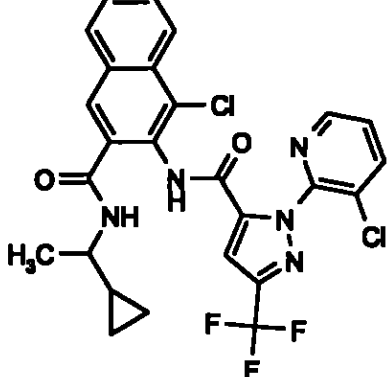
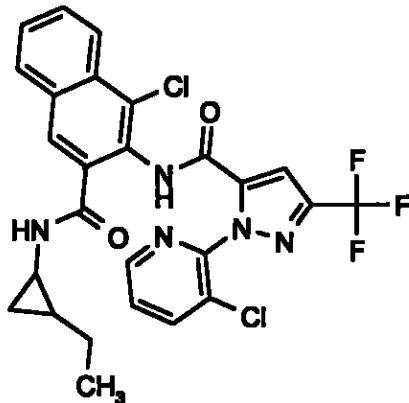
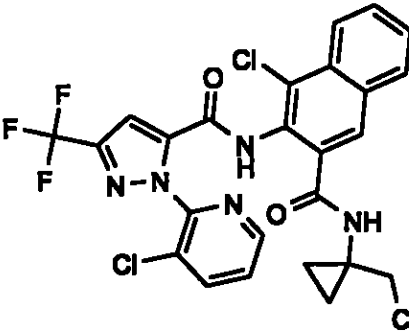
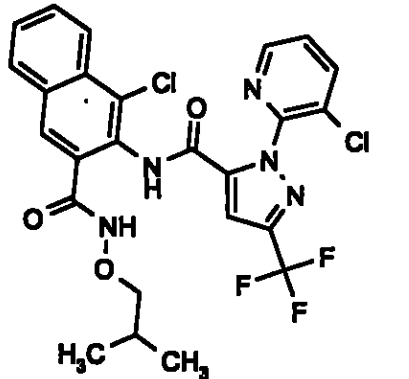
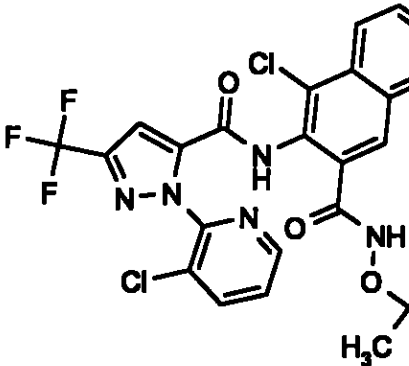
Compuesto Estructura	EM	¹ H-RMN	P.F.
T91.3 			251-253

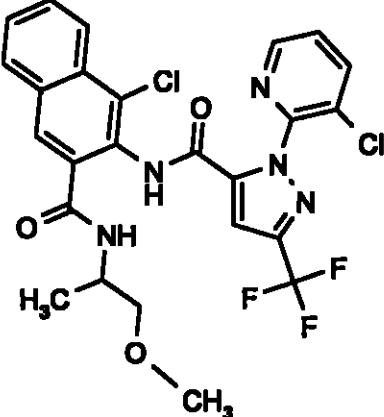
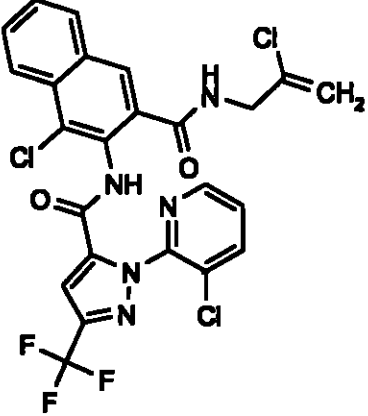
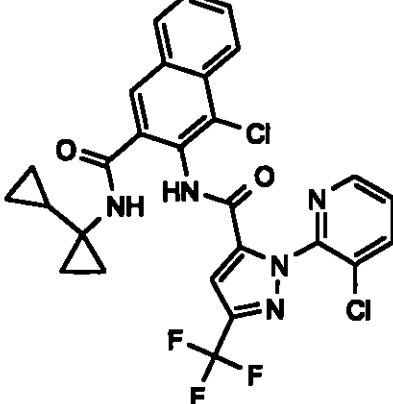
Tabla P2:

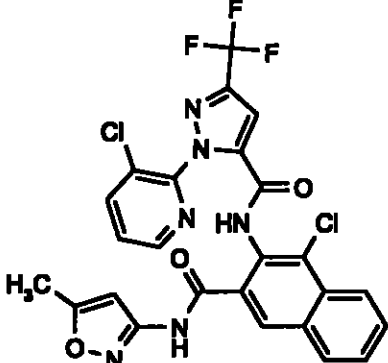
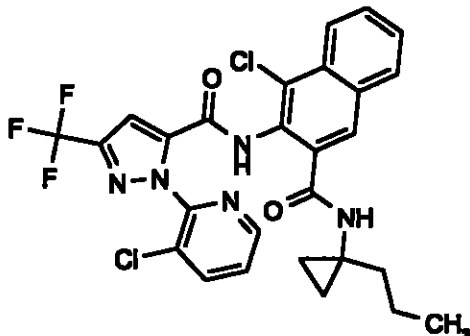
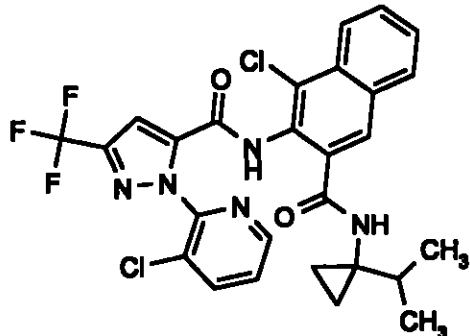
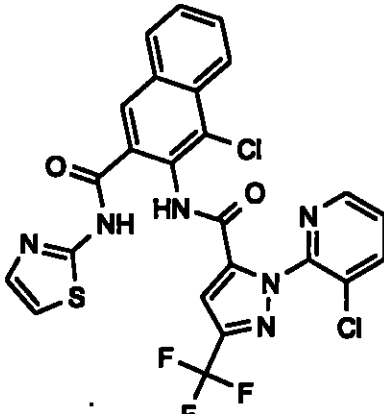
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.001		524 (M+H)+
P2.002		532 ((M+H)+)

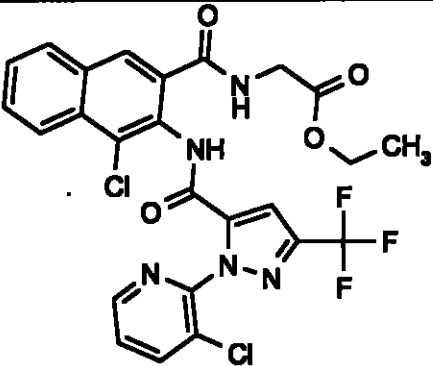
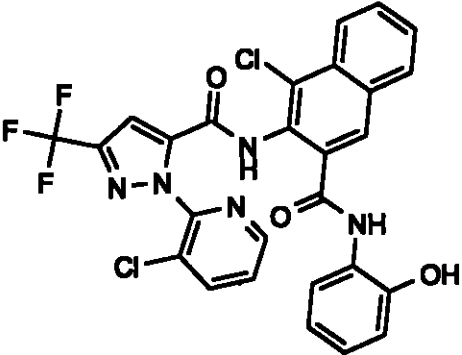
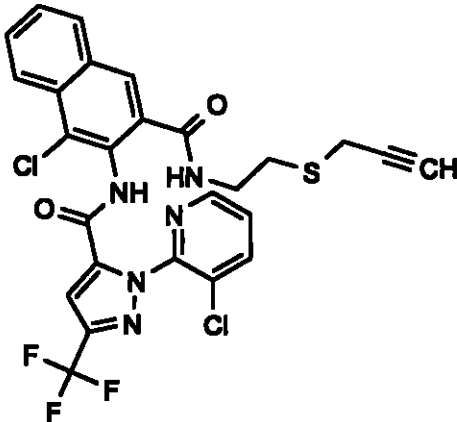
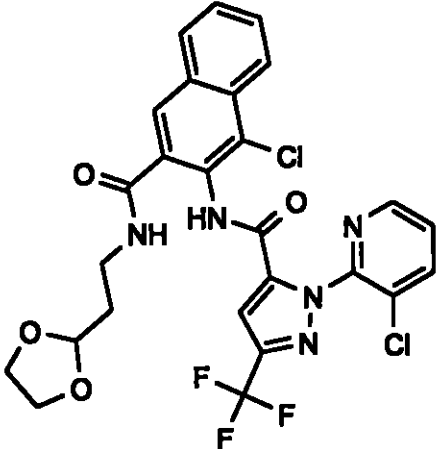
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.003		538 ((M+H)+)
P2.004		547 ((M+H)+)
P2.005		548 ((M+H)+)
P2.006		550 ((M+H)+)

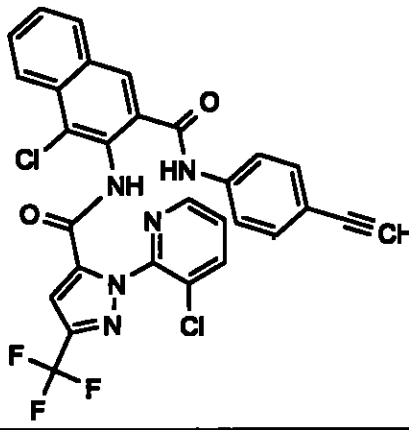
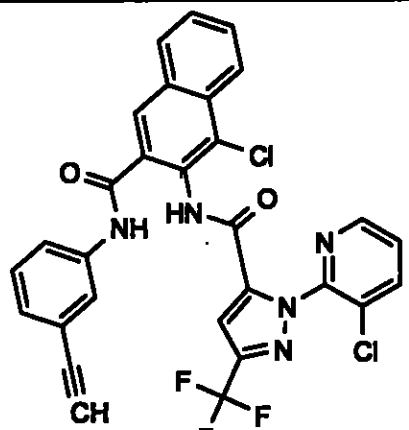
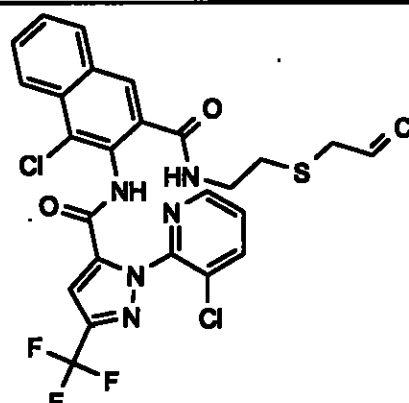
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.007		560 ((M+H)+)
P2.008		562 ((M+H)+)
P2.009		562 ((M+H)+)

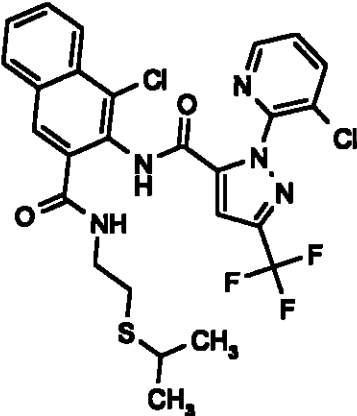
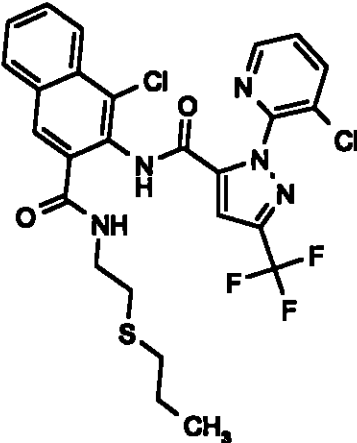
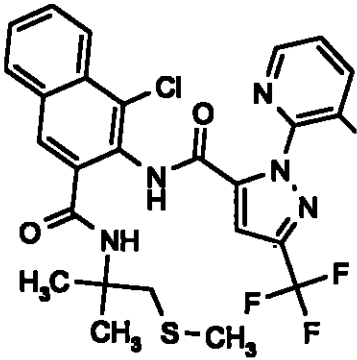
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.010		562 ((M+H)+)
P2.011		562 ((M+H)+)
P2.012		566 ((M+H)+)
P2.013		566 ((M+H)+)

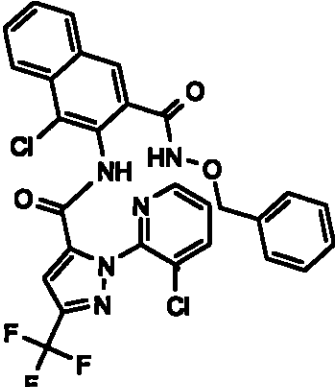
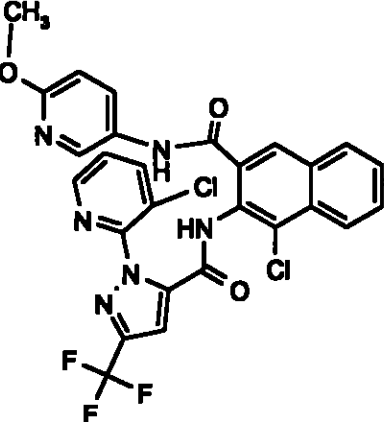
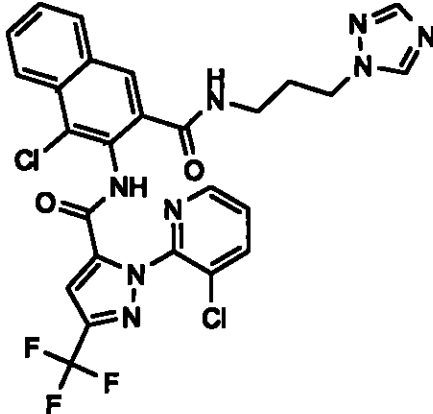
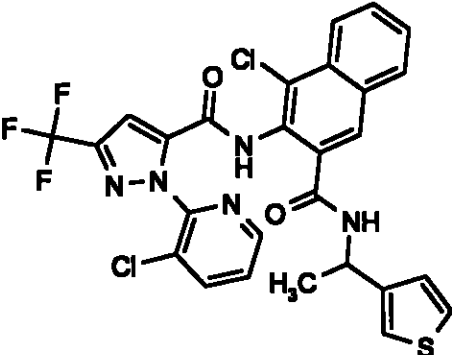
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.014		566 ((M+H)+)
P2.015		568 ((M+H)+)
P2.016		574 ((M+H)+)

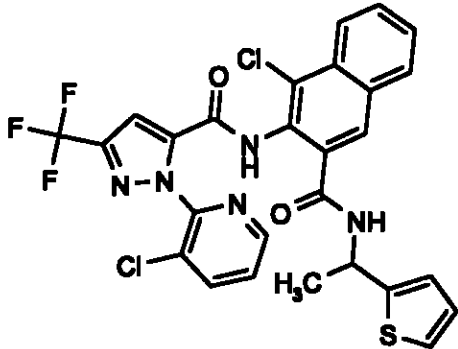
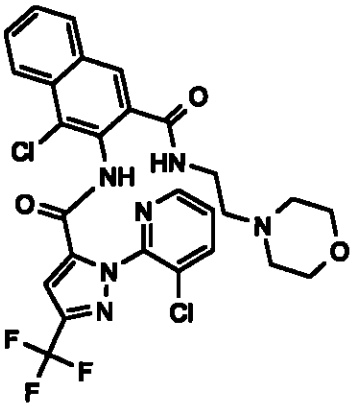
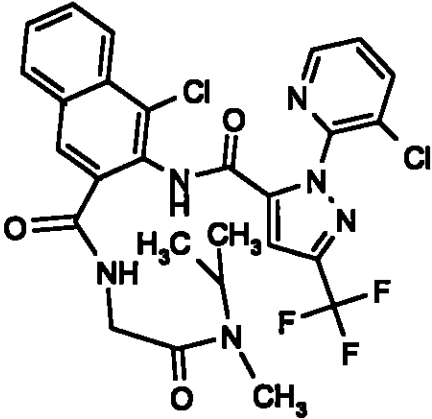
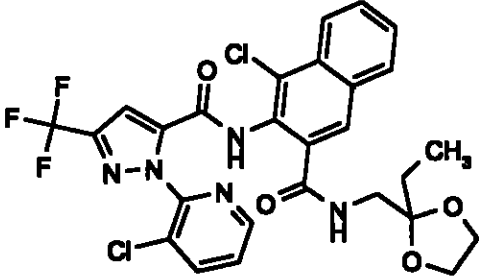
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.017		575 ((M+H)+)
P2.018		576 ((M+H)+)
P2.019		576 ((M+H)+)
P2.020		577 ((M+H)+)

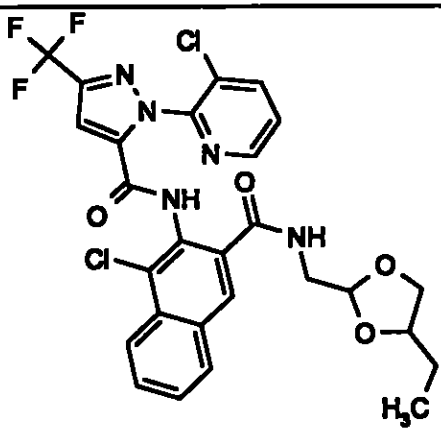
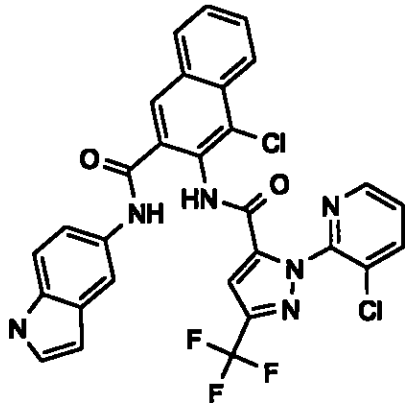
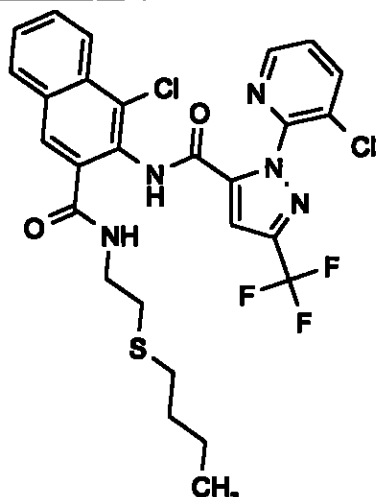
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.021		580 ((M+H)+)
P2.022		586 ((M+H)+)
P2.023		592 ((M+H)+)
P2.024		594 ((M+H)+)

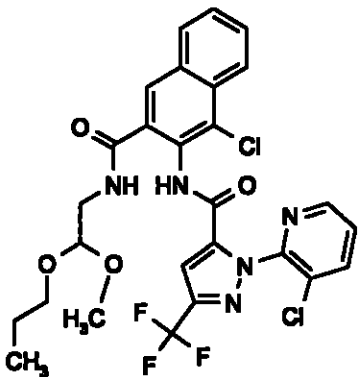
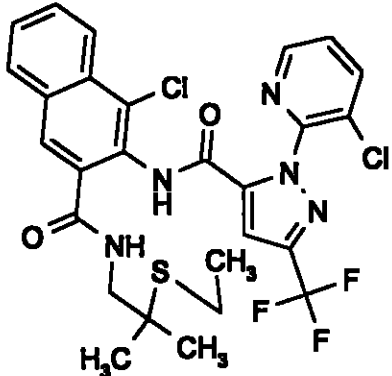
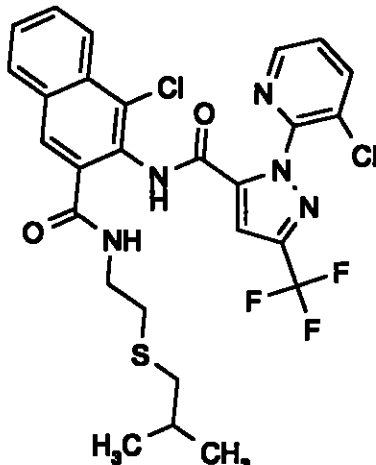
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.025		594 ((M+H)+)
P2.026		594 ((M+H)+)
P2.027		594 ((M+H)+)

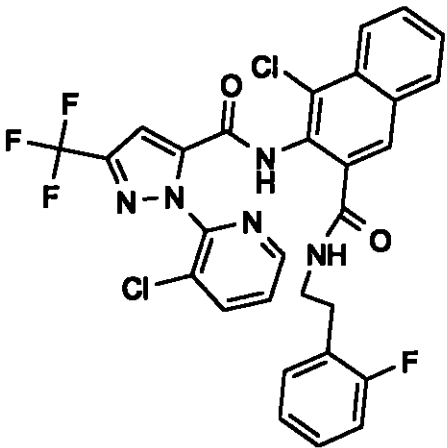
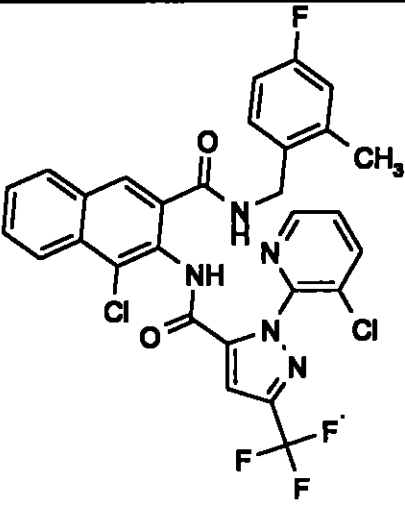
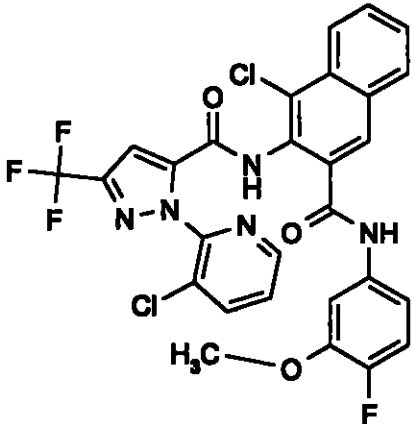
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.028		596 ((M+H)+)
P2.029		596 ((M+H)+)
P2.030 (T1.273)		596 ((M+H)+)

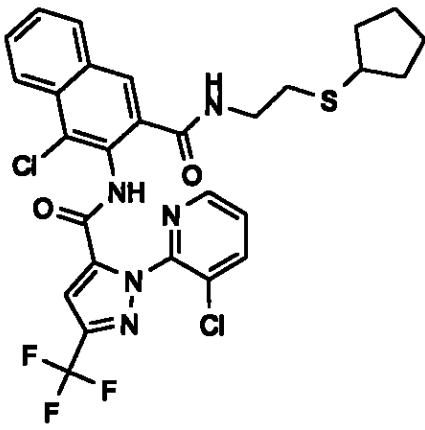
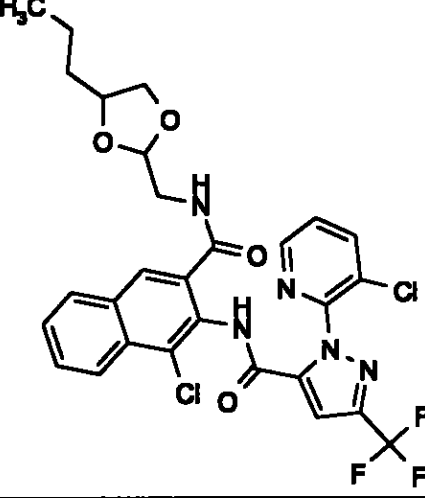
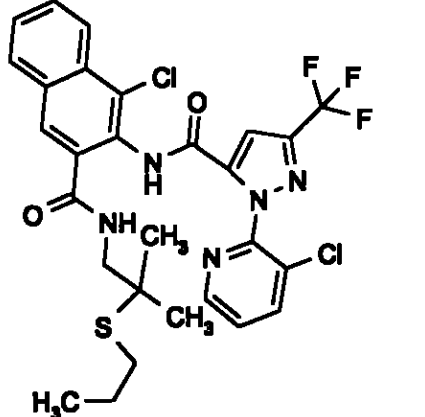
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.031		600 ((M+H)+)
P2.032		601 ((M+H)+)
P2.033		603 ((M+H)+)
P2.034		604 ((M+H)+)

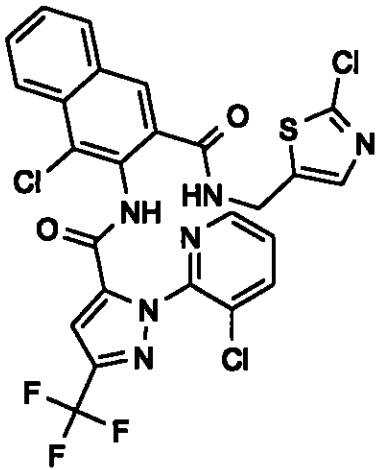
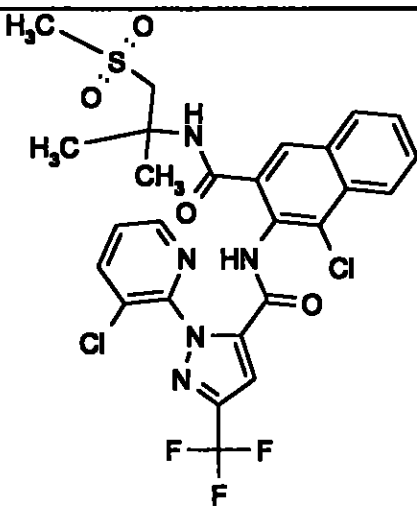
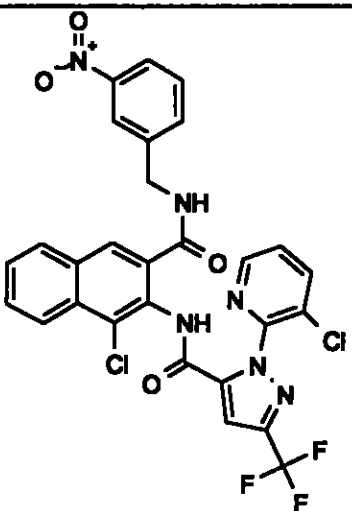
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.035		604 ((M+H)+)
P2.036		607 ((M+H)+)
P2.037		607 ((M+H)+)
P2.038		608 ((M+H)+)

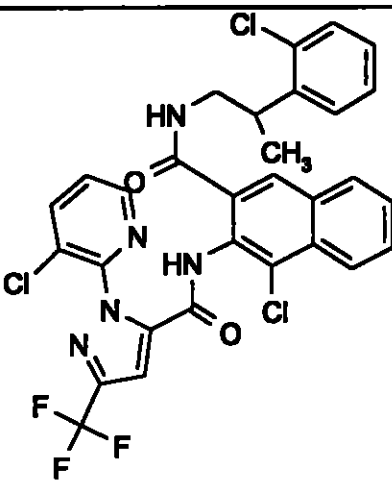
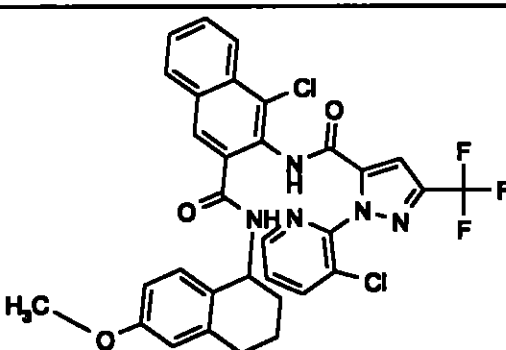
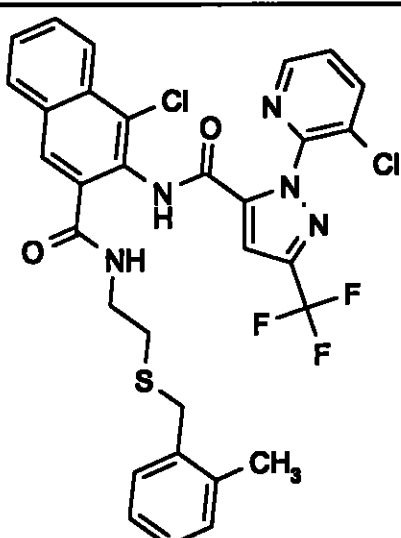
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.039		608 ((M+H)+)
P2.040		609 ((M+H)+)
P2.041		610 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.042		610 ((M+H)+)
P2.043		610 ((M+H)+)
P2.044		610 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.048		616 ((M+H)+)
P2.049		616 ((M+H)+)
P2.050		618 ((M+H)+)

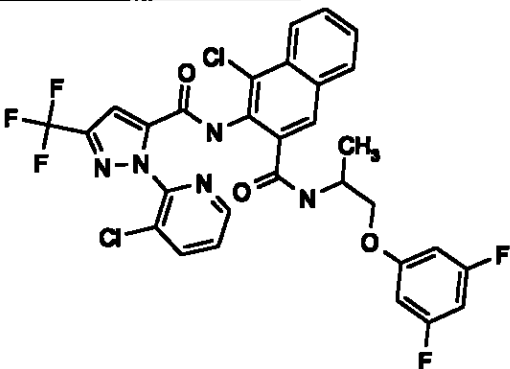
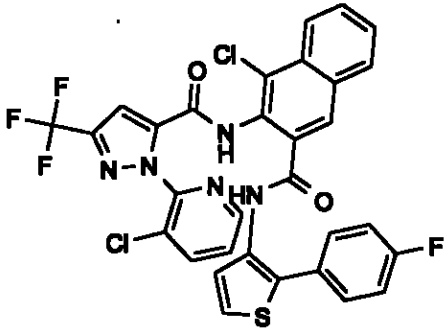
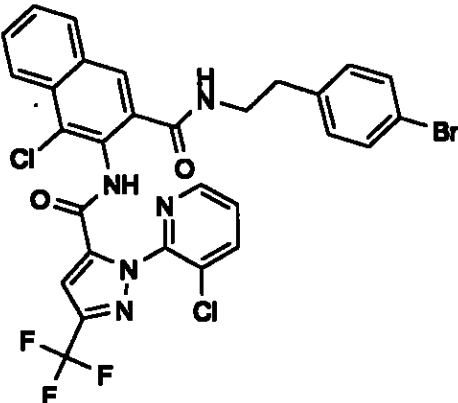
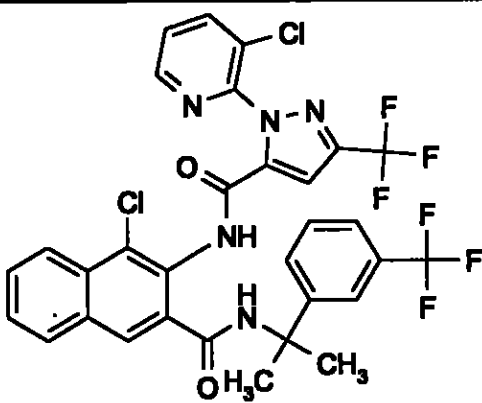
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.051		622 ((M+H)+)
P2.052		622 ((M+H)+)
P2.053		624 ((M+H)+)

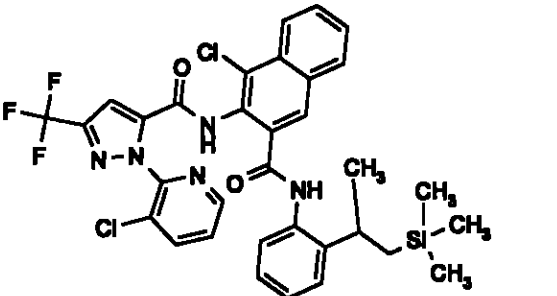
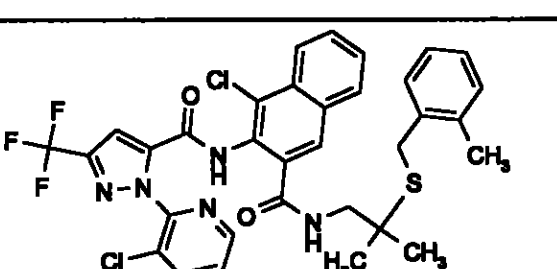
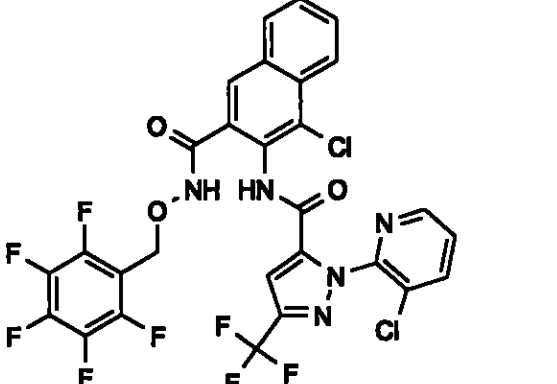
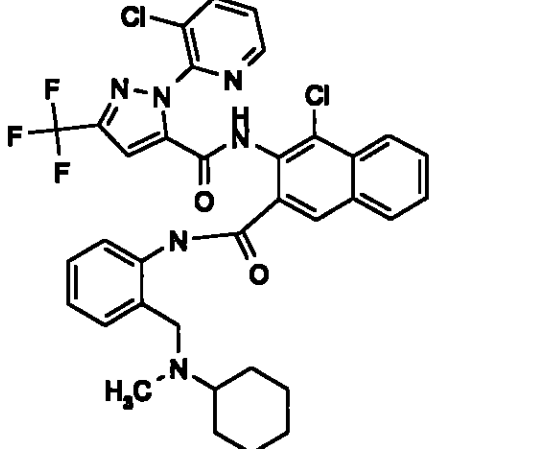
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.054		625 ((M+H)+)
P2.055		628 ((M+H)+)
P2.056		629 ((M+H)+)

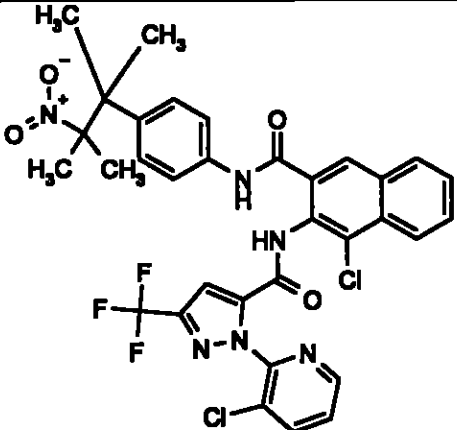
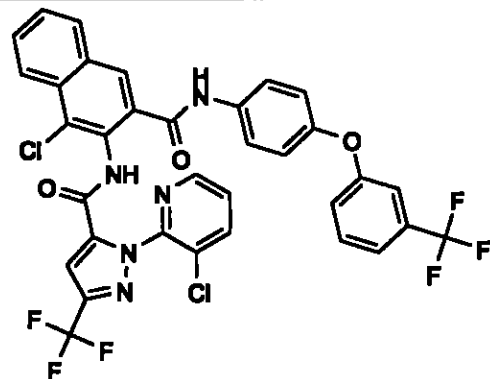
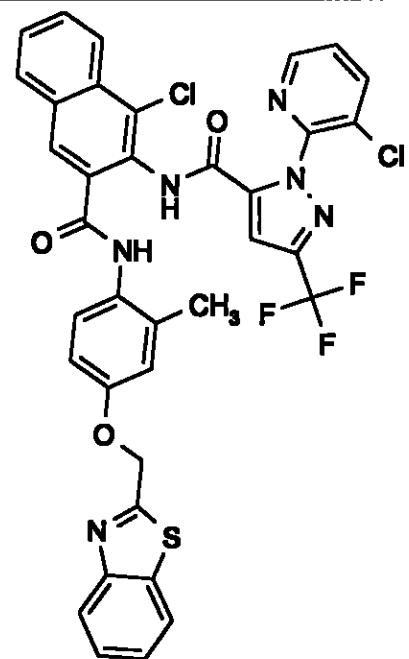
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.061		646 ((M+H)+)
P2.062		654 ((M+H)+)
P2.063		658 ((M+H)+)

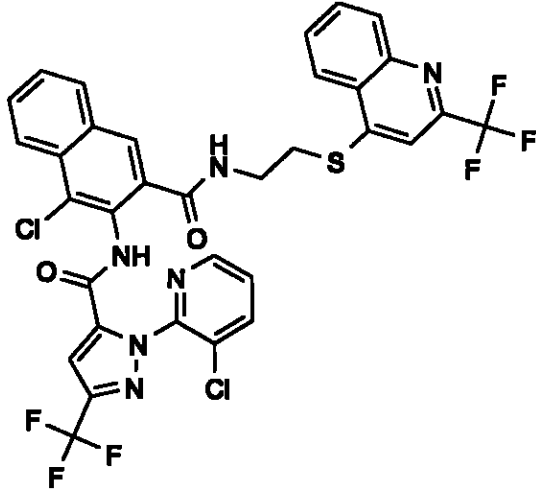
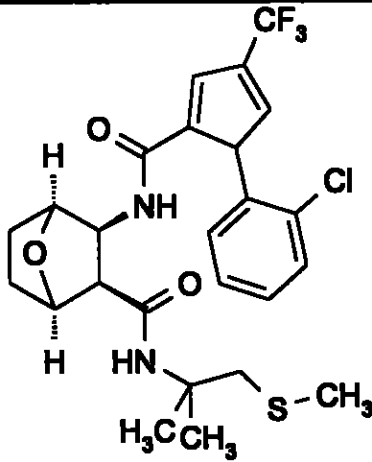
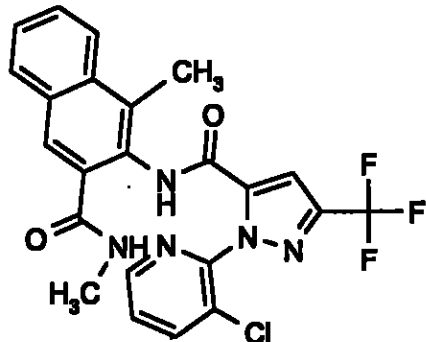
329

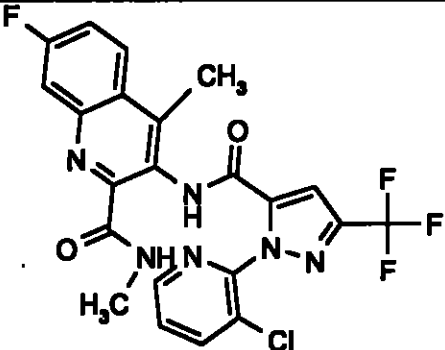
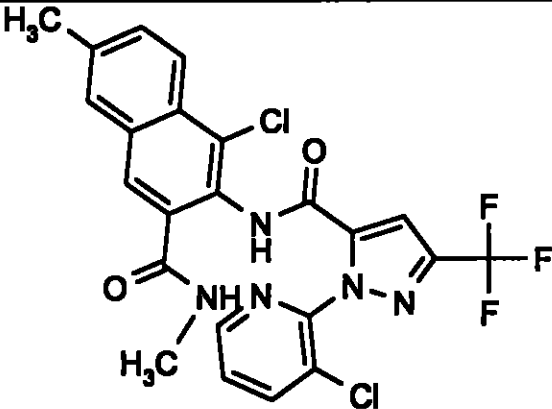
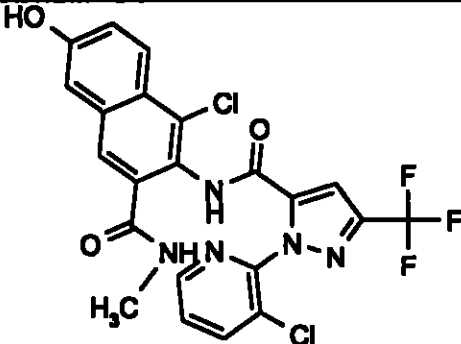
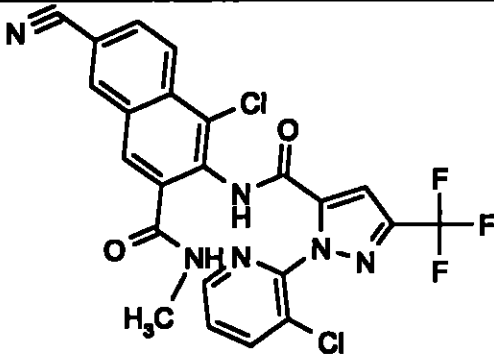
329

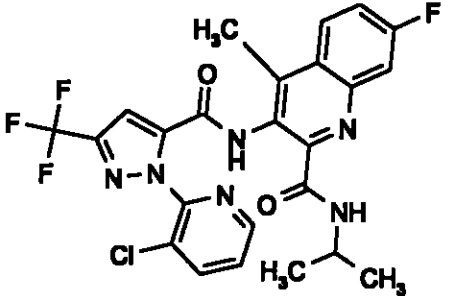
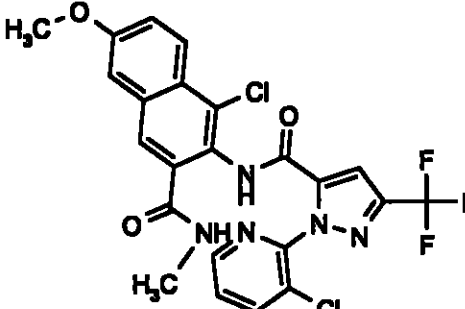
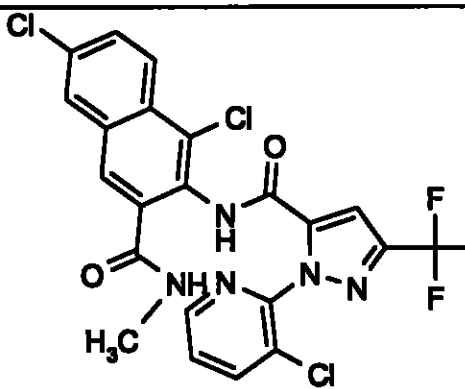
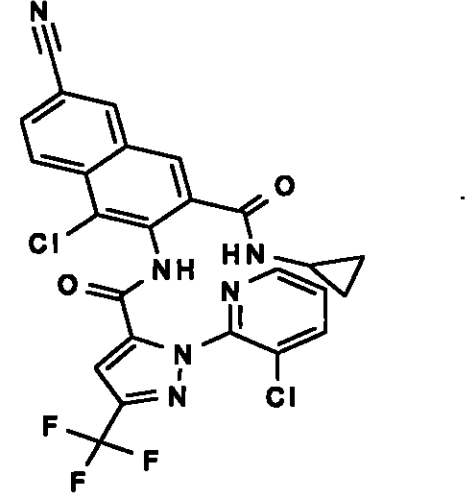
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.064		664 ((M+H)+)
P2.065		670 ((M+H)+)
P2.066		676 ((M+H)+)
P2.067		680 ((M+H)+)

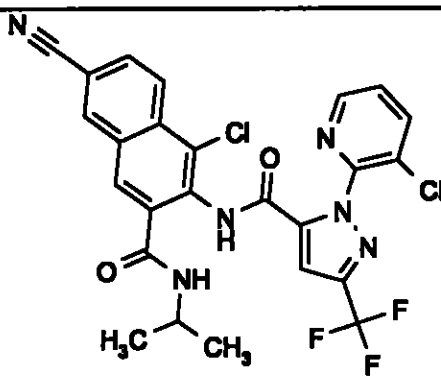
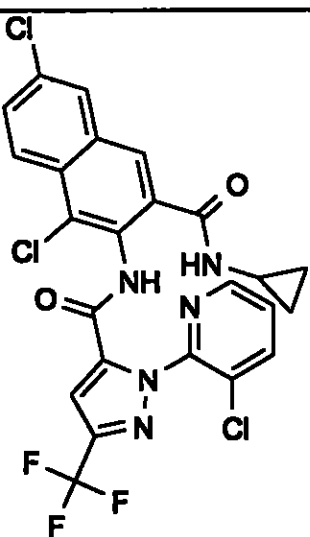
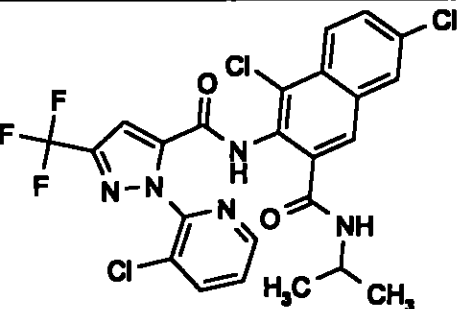
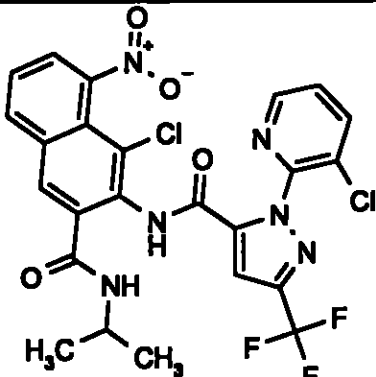
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.068		684 ((M+H)+)
P2.069		686 ((M+H)+)
P2.070		690 ((M+H)+)
P2.071		695 ((M+H)+)

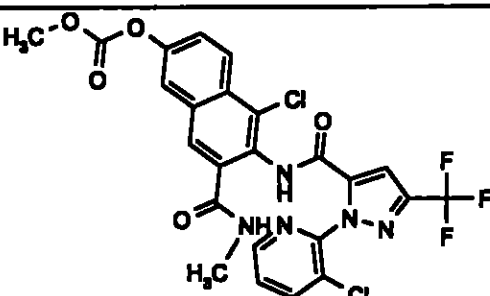
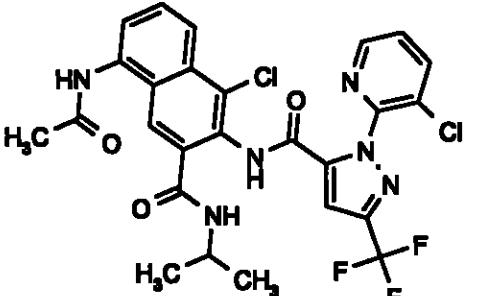
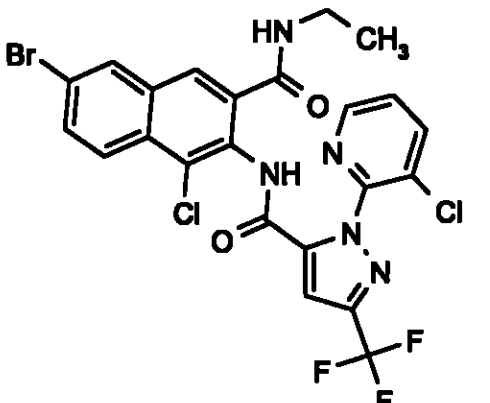
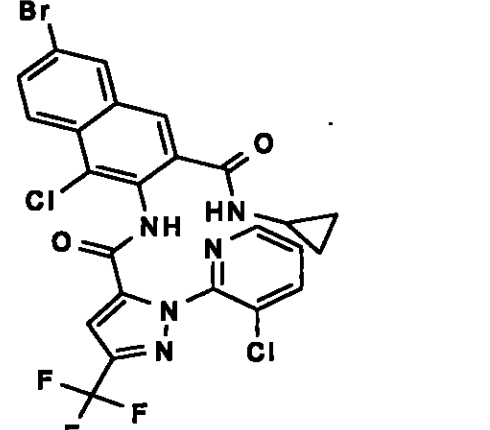
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.072		699 ((M+H)+)
P2.073		730 ((M+H)+)
P2.074		747 ((M+H)+)

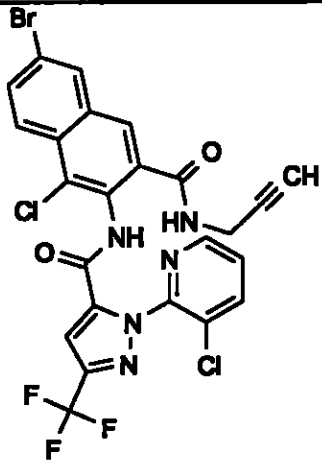
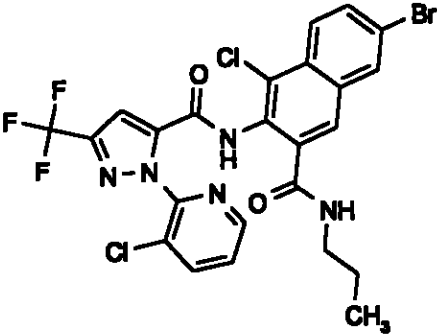
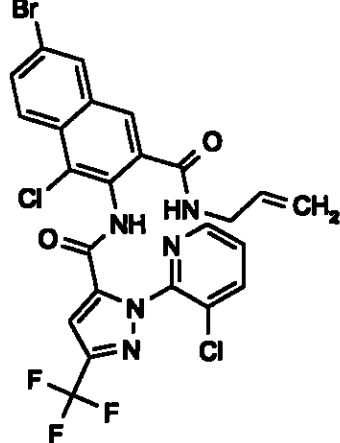
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.075		749 ((M+H)+)
P2.076 (T85.273)		459 ((M+H)+) oil
P2.077 (T8.1)		488 ((M+H)+)

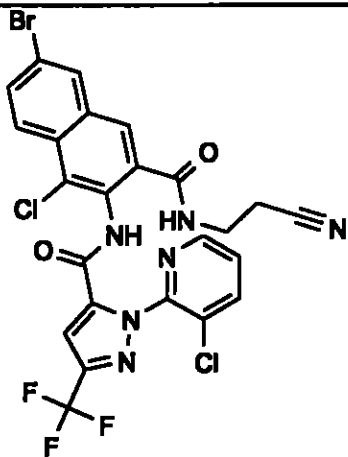
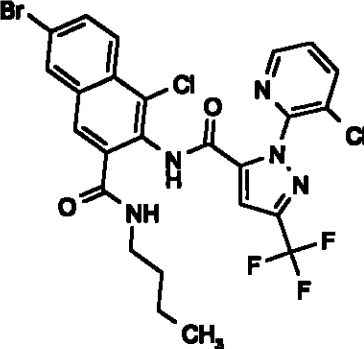
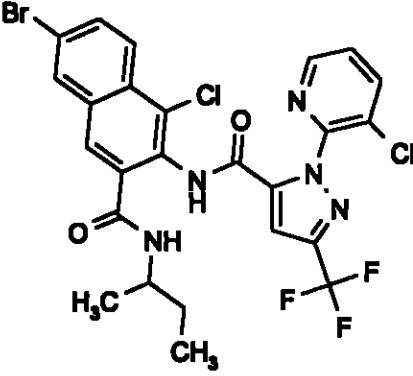
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.078		507 ((M+H)+)
P2.079		522 ((M+H)+)
P2.080		524 ((M+H)+)
P2.081 (T5.1)		533 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.082		535 ((M+H)+)
P2.083		538 ((M+H)+)
P2.084 (T20.1)		544 ((M+H)+)
P2.085 (T5.207)		559 ((M+H)+)

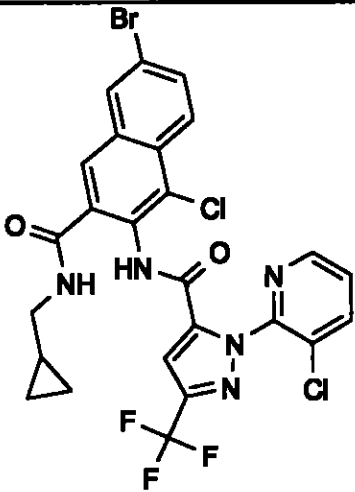
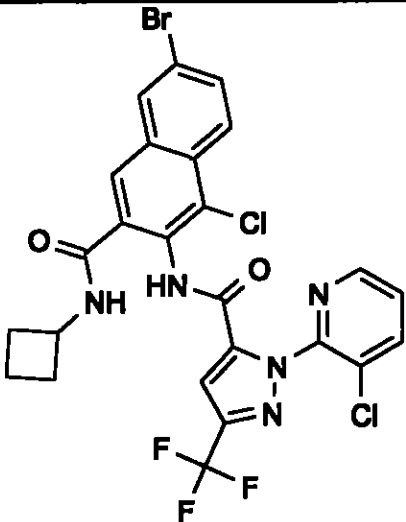
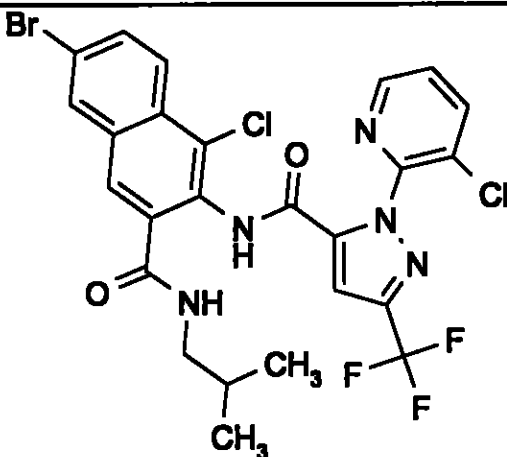
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.086 (T5.3)		561 ((M+H)+)
P2.087 (T20.207)		568 ((M+H)+)
P2.088 (T20.3)		570 ((M+H)+)
P2.089		581 ((M+H)+)

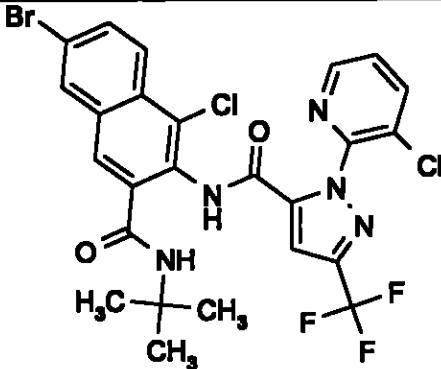
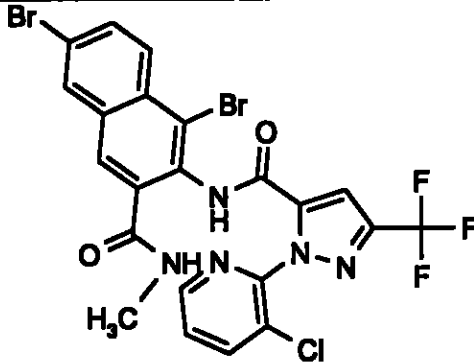
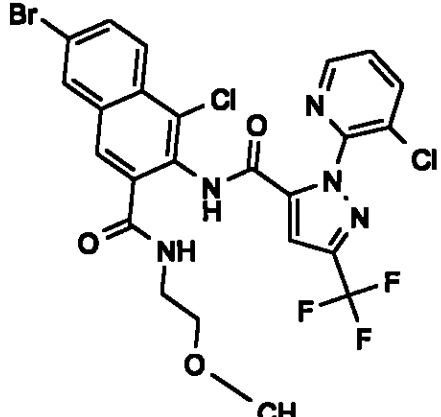
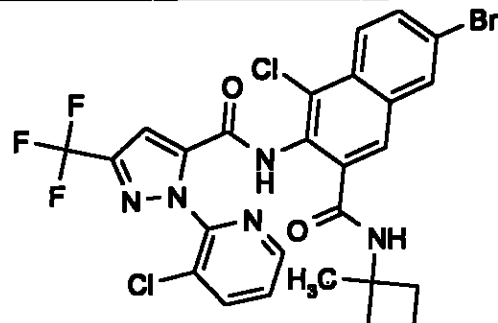
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.090		582 ((M+H)+)
P2.091		593 ((M+H)+)
P2.092 (T2.2)		602 ((M+H)+)
P2.093 (T2.207)		612 ((M-1)-)

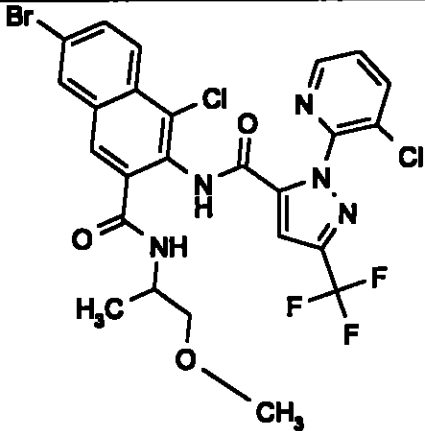
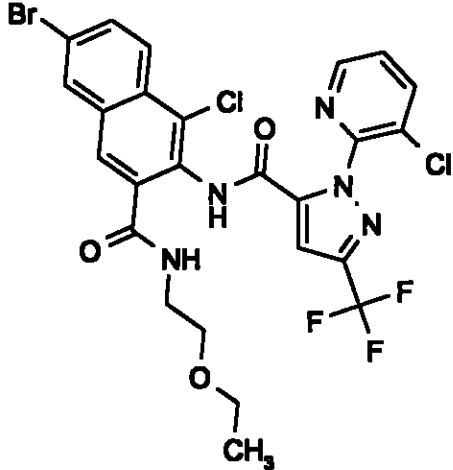
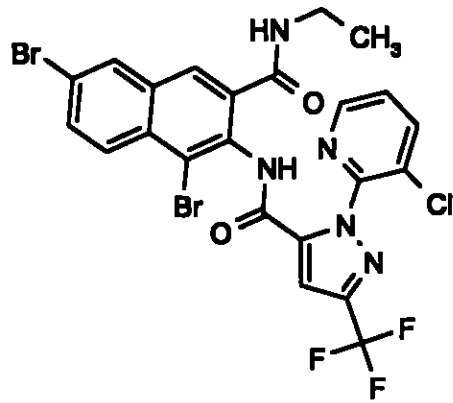
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.094		612 ((M+H)+)
P2.095		614 ((M-1)-)
P2.096		614 ((M+H)+)

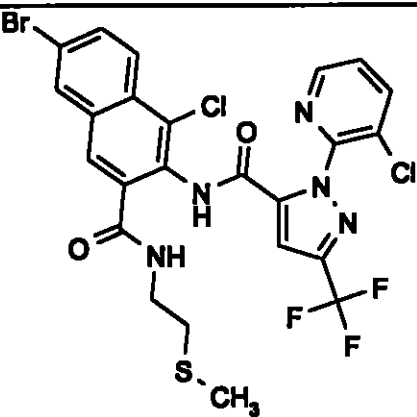
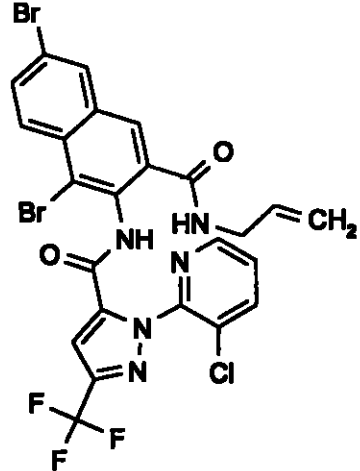
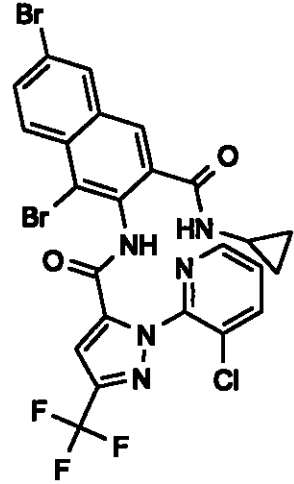
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.097		627 ((M+H)+)
P2.098		628 ((M+H)+)
P2.099		628 ((M-1)-)

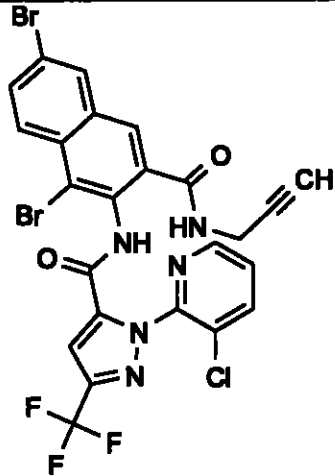
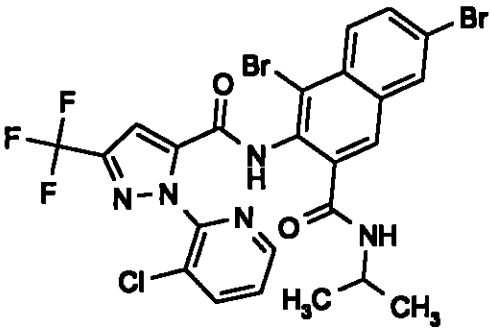
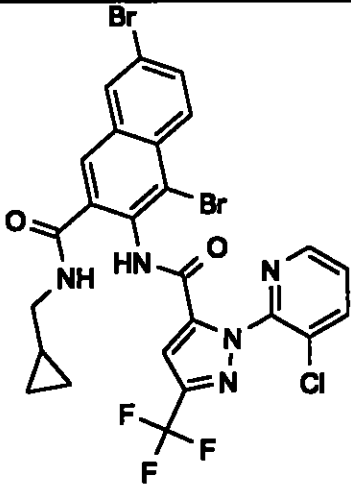
121

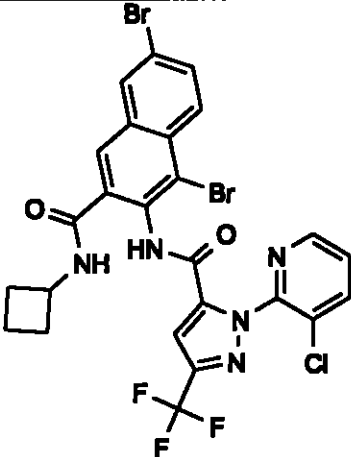
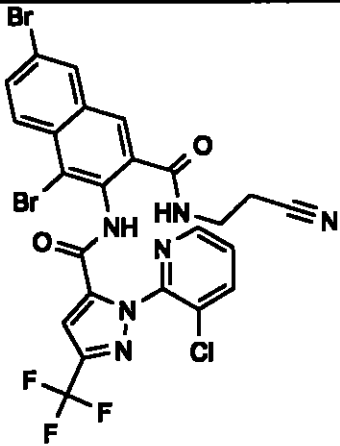
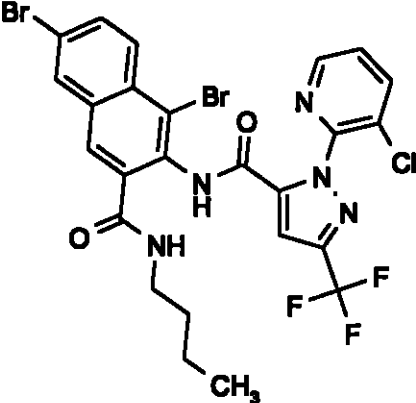
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.100		628 ((M+H)+)
P2.101		628 ((M+H)+)
P2.102		630 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.103		630 ((M+H)+)
P2.104 (T9.1)		632 ((M+H)+)
P2.105		632 ((M+H)+)
P2.106		642 ((M+H)+)

Comp. Nr.	Estructura	Datos Fisicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.107		646 ((M+H)+)
P2.108		646 ((M+H)+)
P2.109 (T9.2)		646 ((M+H)+)

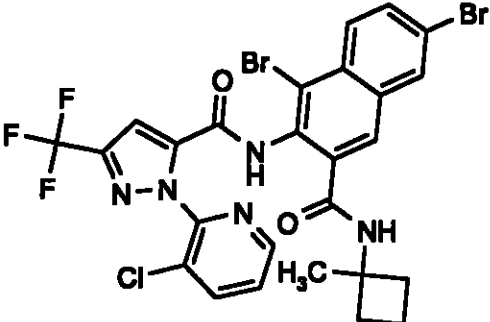
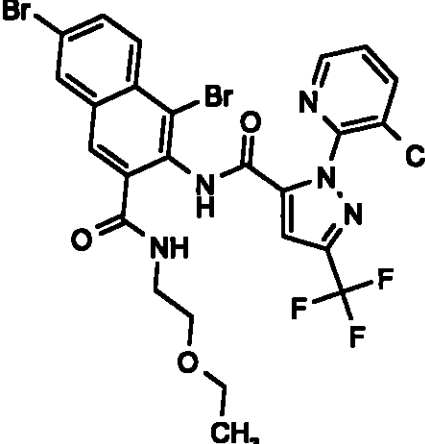
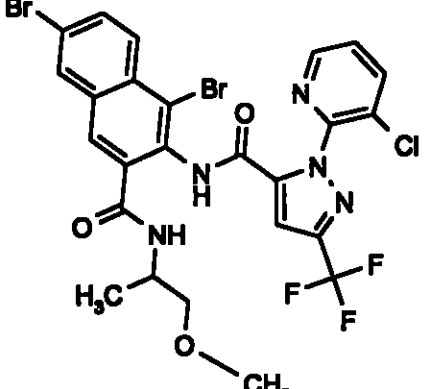
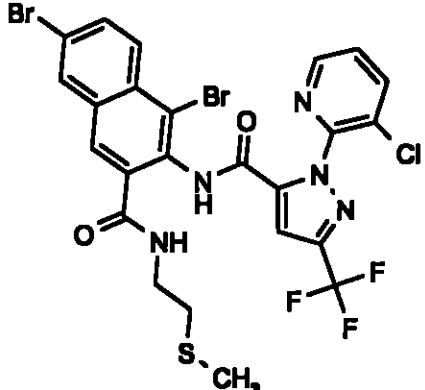
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.110		648 ((M+H)+)
P2.111		656 ((M+H)+)
P2.112 (T9.207)		656 ((M+H)+)

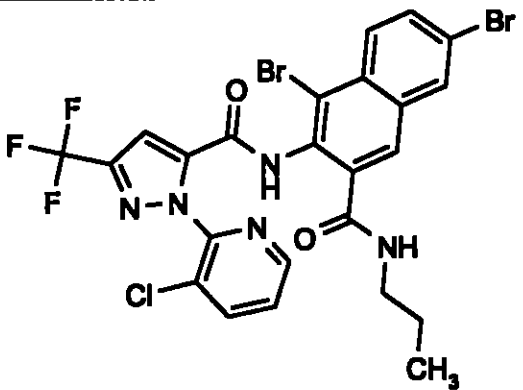
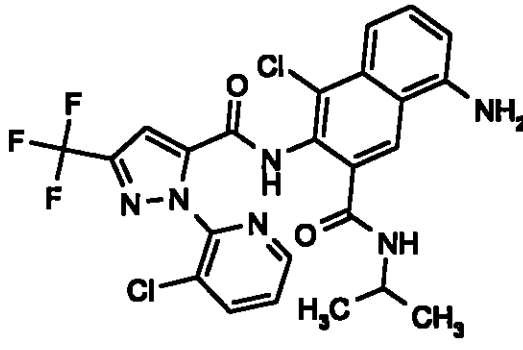
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.113		656 ((M+H)+)
P2.114 (T9.3)		660 ((M+H)+)
P2.115		670 ((M+H)+)

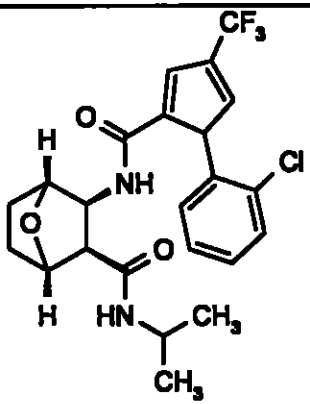
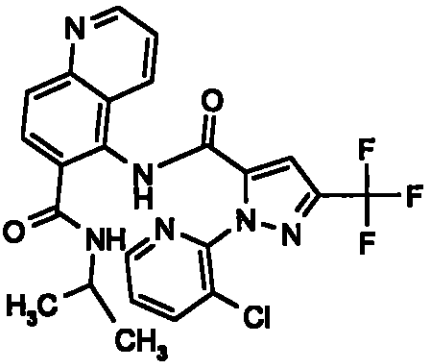
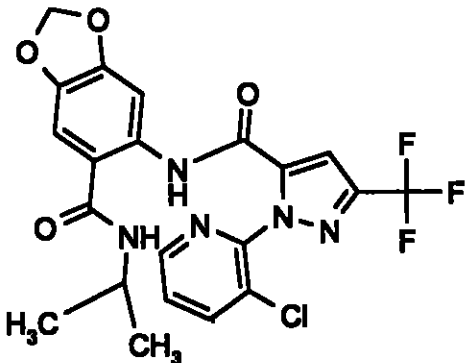
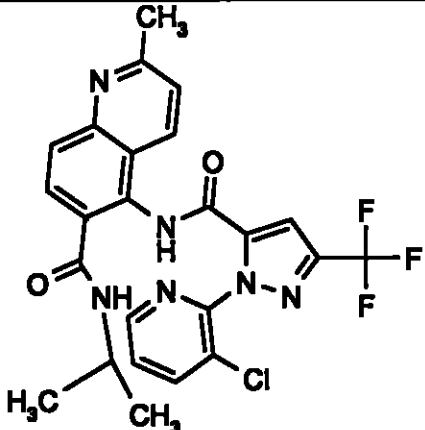
Comp. Nr.	Estructura	Datos Fisicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.116		670 ((M+H)+)
P2.117		671 ((M+H)+)
P2.118		672 ((M+H)+)

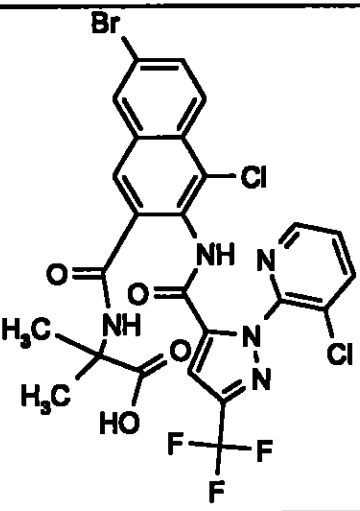
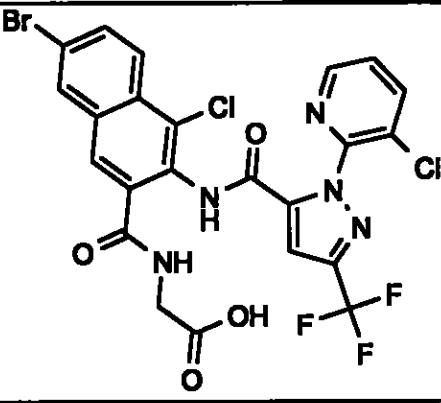
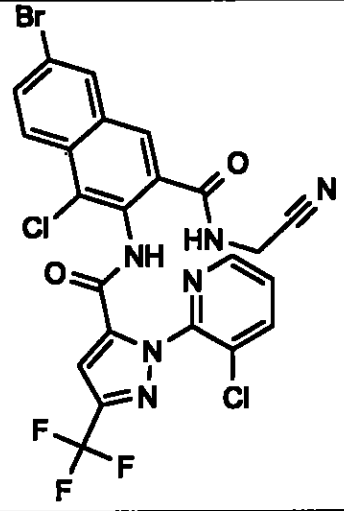
Comp. Nr.	Estructura	Datos Fisicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.119 (T9.145)		672 ((M-1)-)
P2.120		674 ((M+H)+)
P2.121		674 ((M+H)+)
P2.122		676 ((M+H)+)

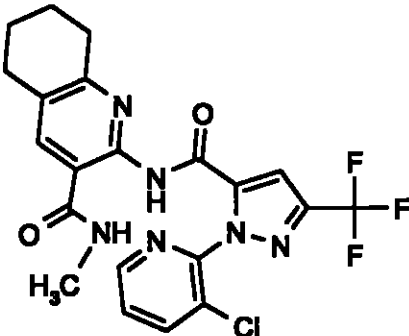
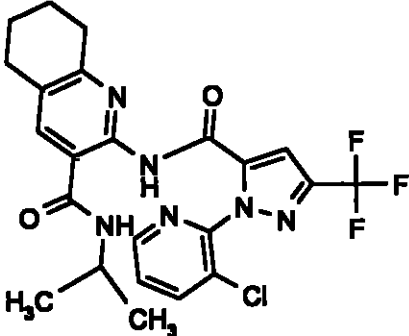
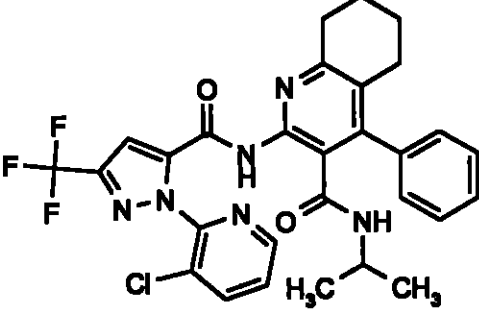
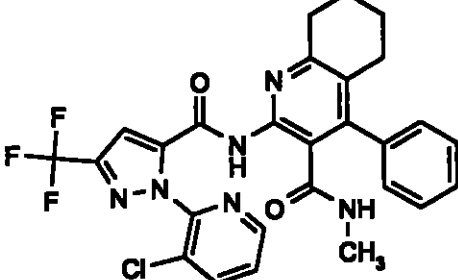
128

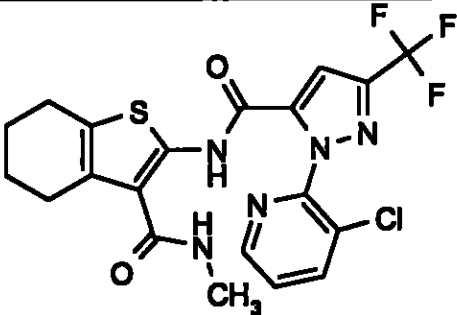
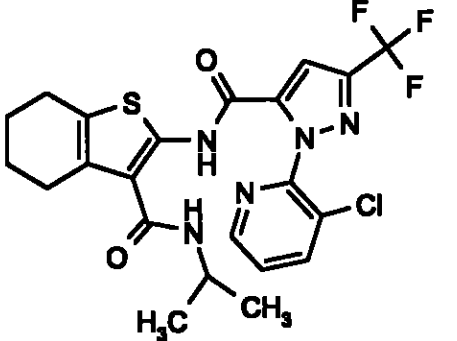
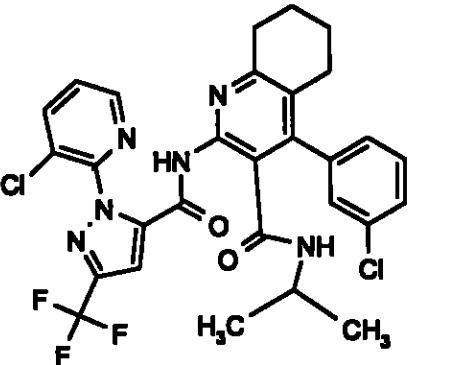
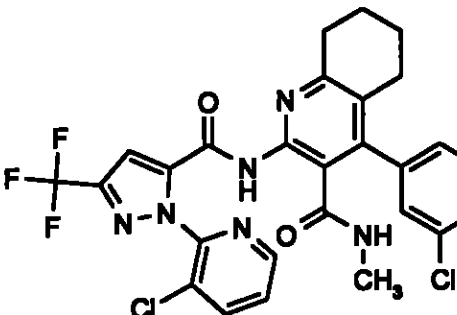
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.123		686 ((M+H)+)
P2.124		688 ((M+H)+)
P2.125		690 ((M+H)+)
P2.126		692 ((M+H)+)

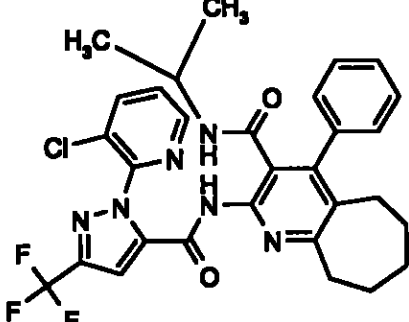
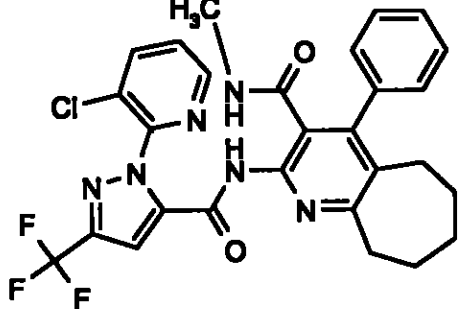
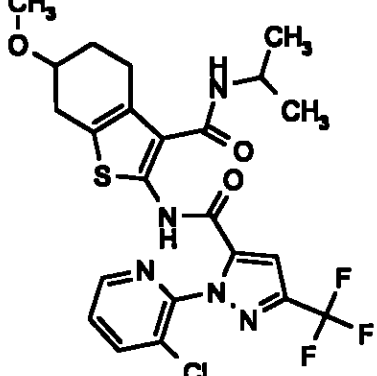
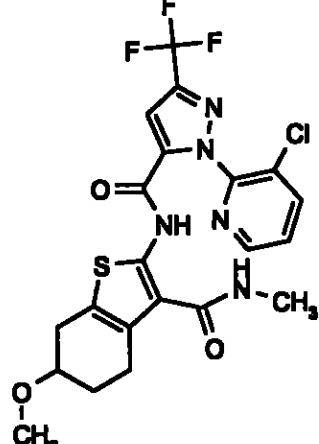
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.127		0.82-0.86 (t, 3H), 1.37-1.46 (m, 2H), 3.07-3.12 (m, 2H), 7.64-7.66 (m, 1H), 7.87-7.89 (dd, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.13-8.15 (d, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.41-8.42 (d, 1H), 8.48 (br, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H)
P2.128		1.07-7.08 (d, 6H), 3.90-3.97 (m, 1H), 6.10 (br s, 2H), 6.79-6.80 (d, 1H), 7.33-7.35 (d, 1H), 7.39-7.43 (m, 1H), 7.63-7.66 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.00-8.02 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.19-8.21 (d, 1H), 8.51-8.52 (d, 1H), 10.67 (s, 1H)

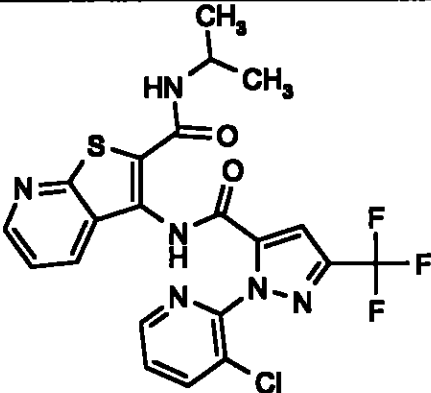
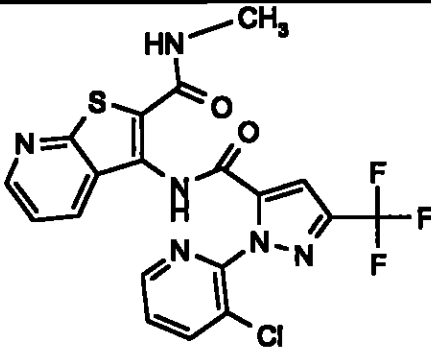
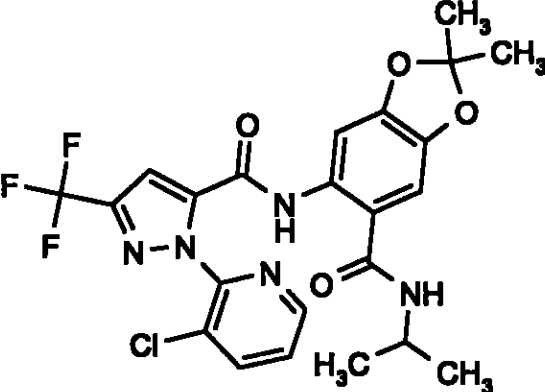
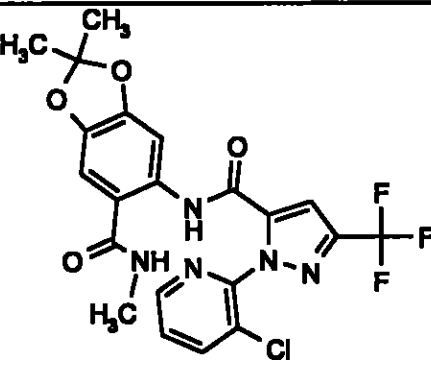
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F, en °C)
P2.129 (T85.3)		220-224°C
P2.130		503 ((M+H)+)
P2.131 (T84.3)		496 ((M+H)+)
P2.132		517 ((M+H)+)

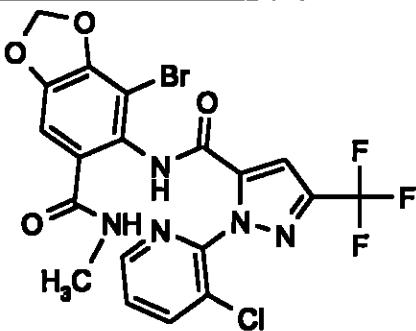
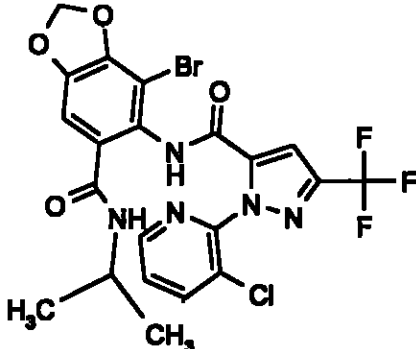
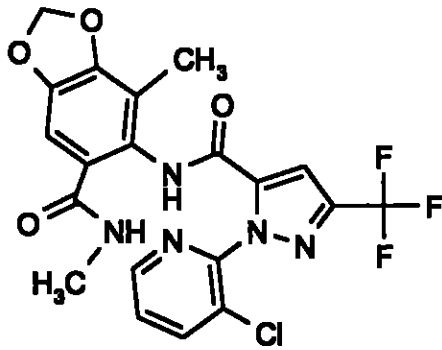
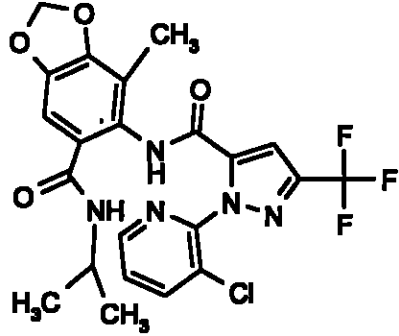
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.133		658 ((M+H)+)
P2.134		630 ((M+H)+)
P2.135		611 ((M+H)+)

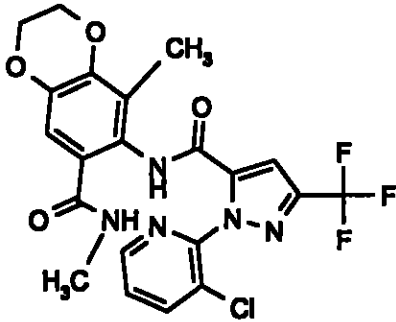
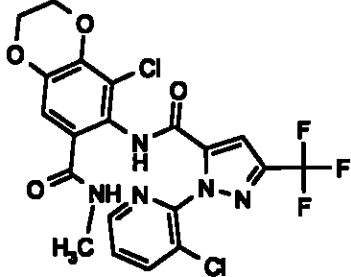
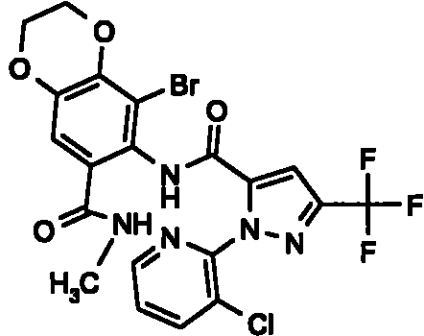
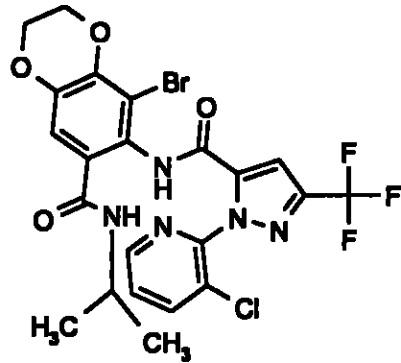
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.136 (T50.1)		145-147 °C
P2.137 (T50.3)		143-145 °C
P2.138 (T51.3)		146-148 °C
P2.139 (T51.1)		165-168 °C

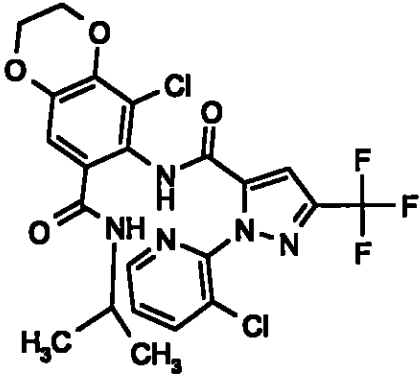
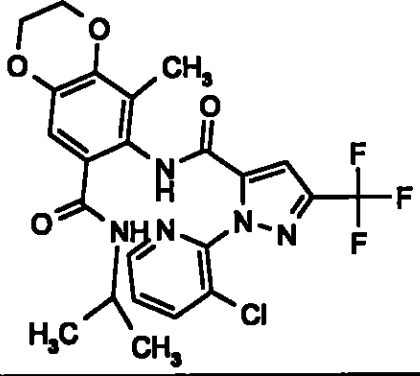
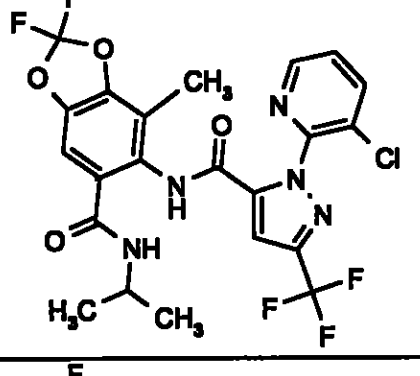
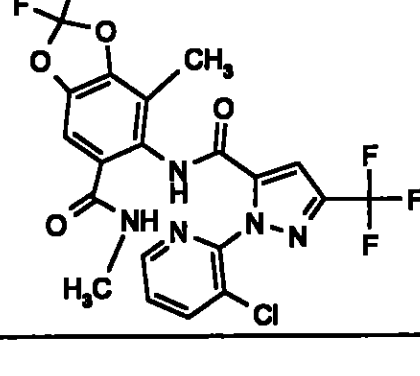
Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.140 (T46.1)		261-263 °C
P2.141 (T46.1)		246-248 °C
P2.142 (T53.3)		259-260 °C
P2.143 (T53.1)		183-185 °C

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.144 (T52.3)		269-270 °C
P2.145 (T52.1)		211-213 °C
P2.146 (T74.3)		206-207 °C
P2.147 (T74.1)		133-135 °C

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.148		212-215 °C
P2.149		253-255 °C
P2.150		284-286 °C
P2.151		273-275 °C

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.152		255-257 °C
P2.153		274-276 °C
P2.154		255-257 °C
P2.155		267-270 °C

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.156		265-267 °C
P2.157 (T57.1)		257-259 °C
P2.158		253-255 °C
P2.159		274-276 °C

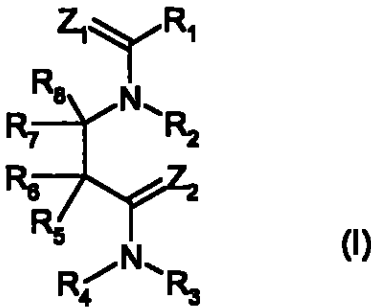
Comp. Nr.	Estructura	Datos Fisicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.160 (T57.3)		265-267 °C
P2.161		265-267 °C
P2.162		254-255 °C
P2.163		272-274 °C

Comp. Nr.	Estructura	Datos Físicos (EM., RMN, P.F. en °C)
P2.164		234-236 °C
P2.165		284-286 °C

Ejemplo P11

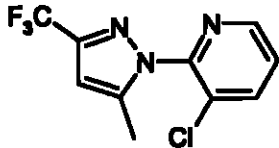
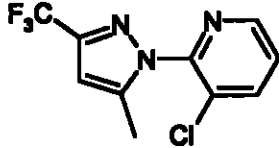
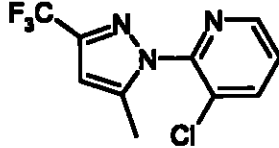
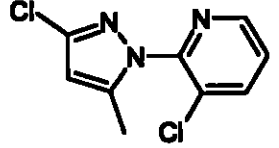
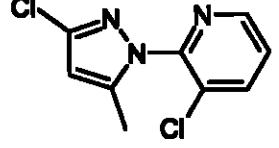
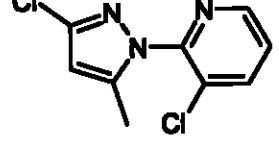
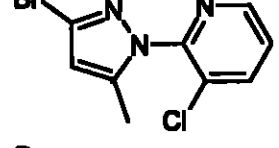
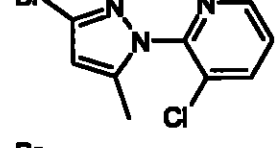
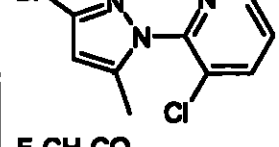
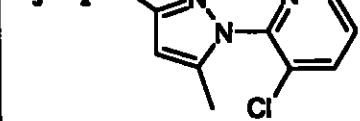
Los otros compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 también pueden prepararse en una manera análoga a los procedimientos descriptos en los ejemplos P1 a P10.
 La tabla A describe 338 significados de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ y R₄ en un compuesto de la fórmula I.

Tabla A

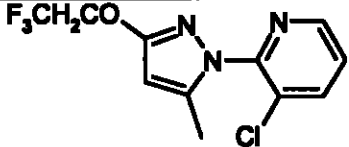
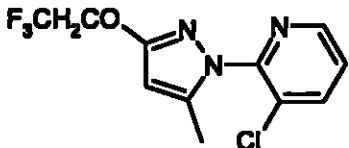
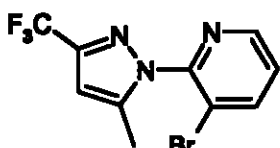
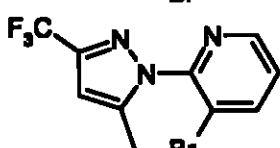
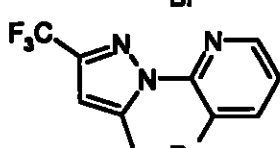
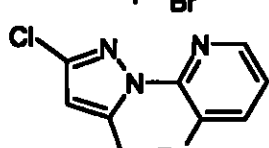
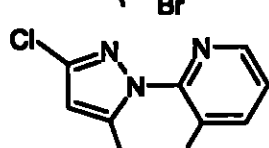
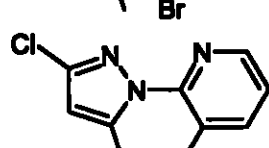
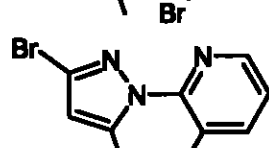
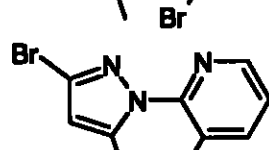


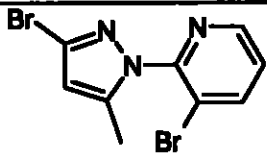
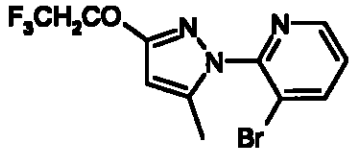
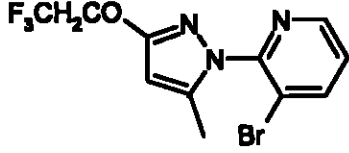
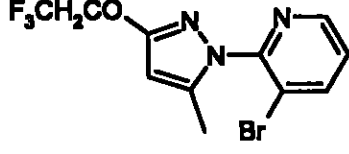
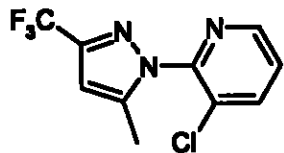
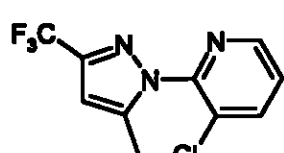
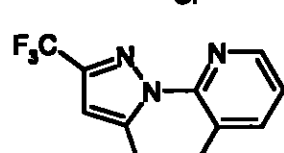
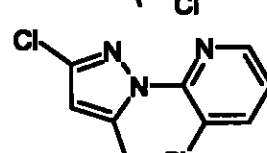
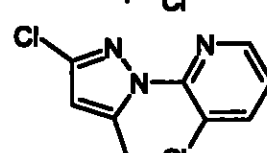
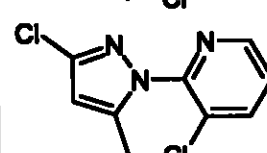
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
	1	2				

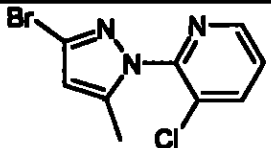
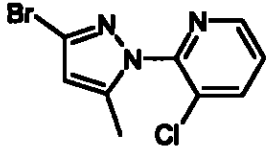
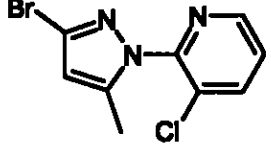
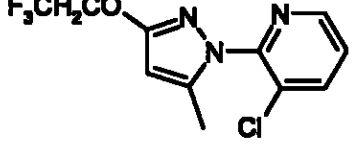
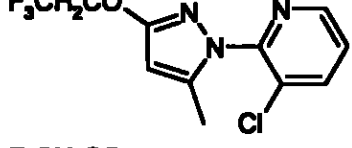
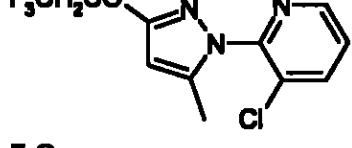
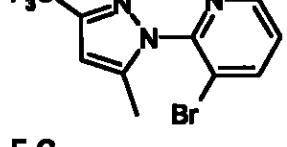
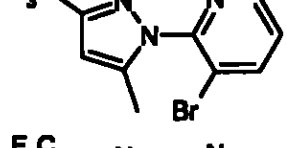
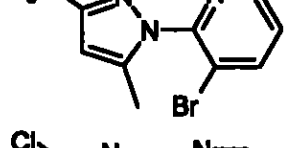
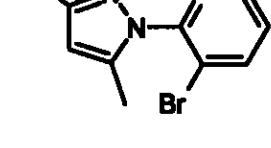
358
358

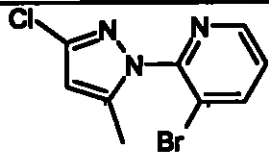
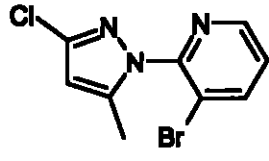
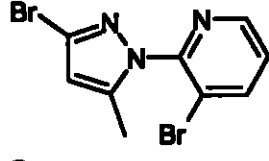
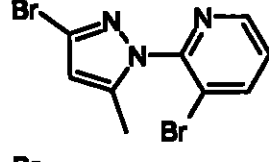
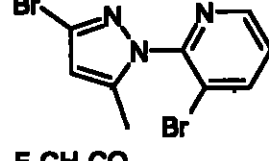
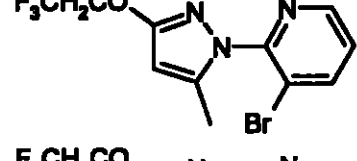
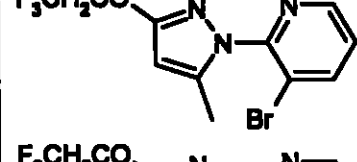
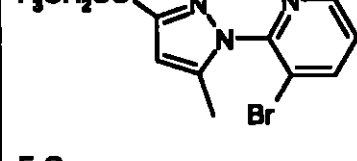
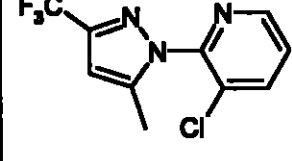
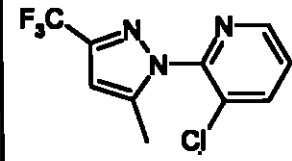
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.1	O	O		H	H	CH ₃
A.2	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.3	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.4	O	O		H	H	CH ₃
A.5	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.6	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.7	O	O		H	H	CH ₃
A.8	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.9	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.10	O	O		H	H	CH ₃

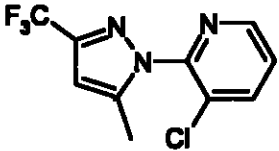
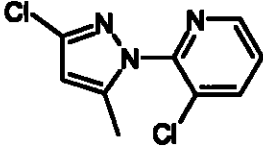
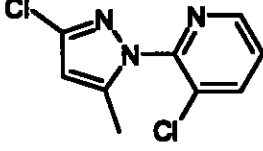
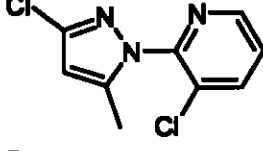
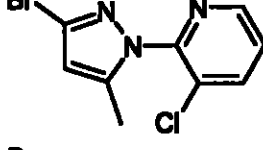
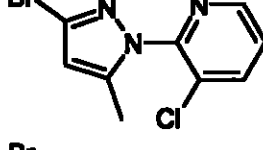
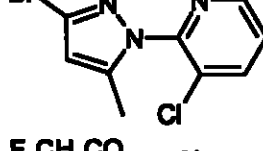
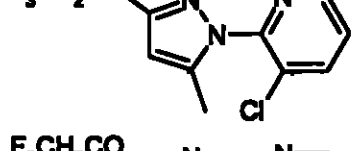
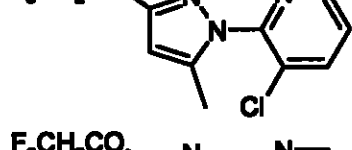
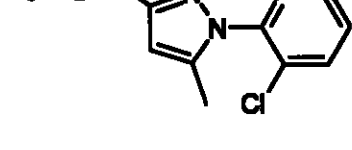
359
359

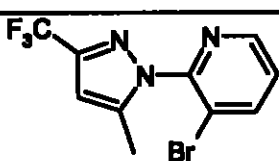
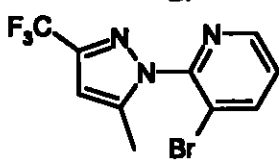
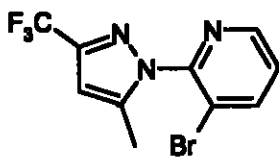
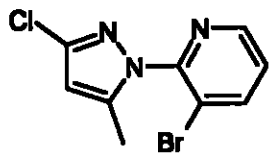
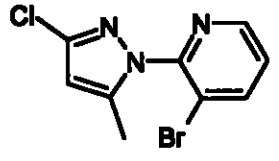
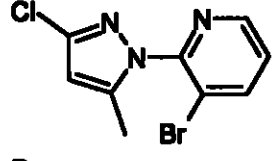
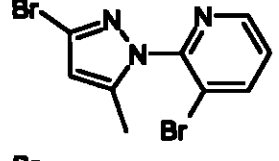
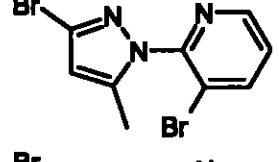
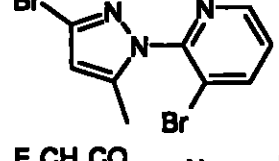
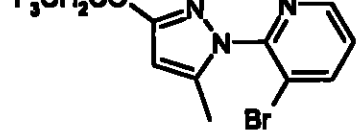
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.11	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.12	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.13	O	O		H	H	CH ₃
A.14	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.15	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16	O	O		H	H	CH ₃
A.17	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19	O	O		H	H	CH ₃
A.20	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

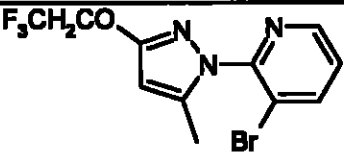
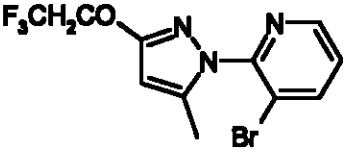
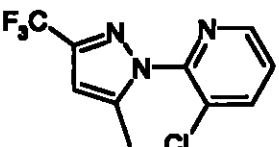
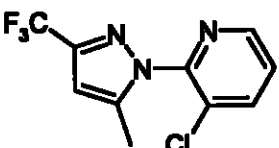
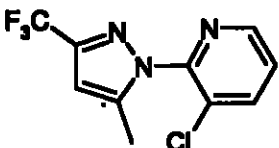
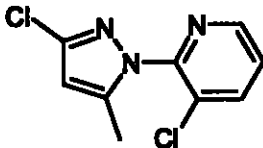
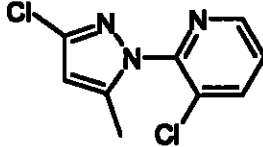
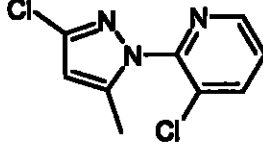
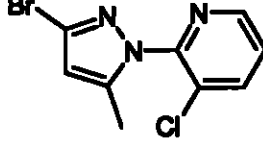
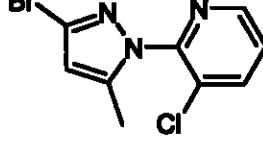
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.21	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.22	O	O		H	H	CH ₃
A.23	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.24	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.25	S	S		H	H	CH ₃
A.26	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.27	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.28	S	S		H	H	CH ₃
A.29	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.30	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂

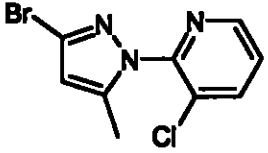
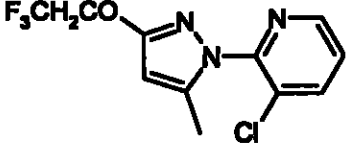
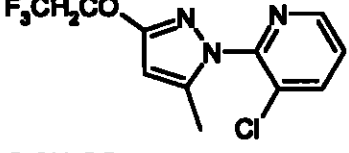
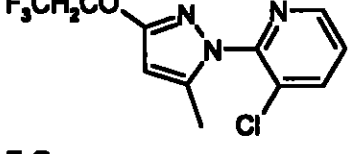
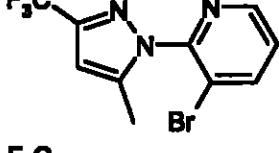
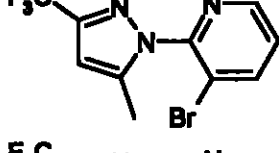
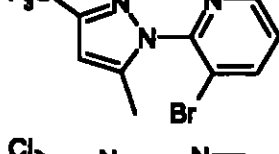
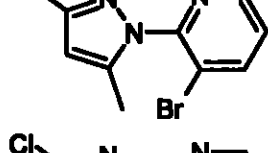
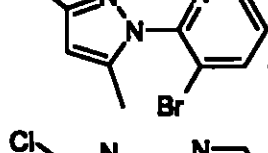
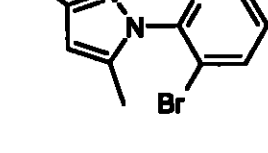
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.31	S	S		H	H	CH ₃
A.32	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.33	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.34	S	S		H	H	CH ₃
A.35	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.36	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.37	S	S		H	H	CH ₃
A.38	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.39	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.40	S	S		H	H	CH ₃

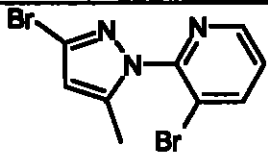
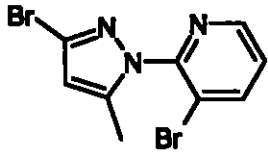
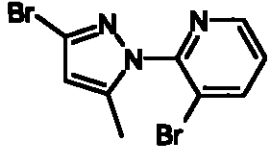
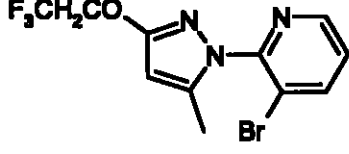
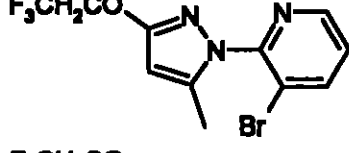
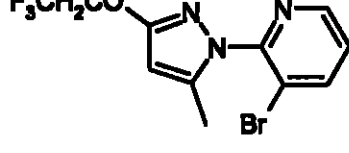
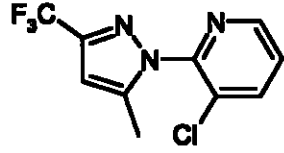
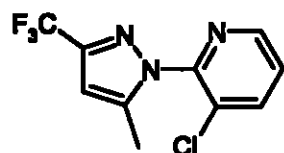
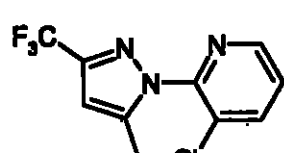
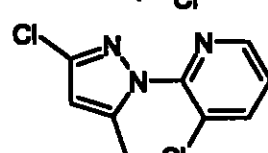
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.41	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.42	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.43	S	S		H	H	CH ₃
A.44	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.45	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.46	S	S		H	H	CH ₃
A.47	S	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.48	S	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.49	O	S		H	H	CH ₃
A.50	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃

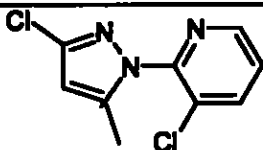
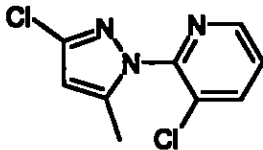
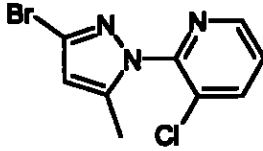
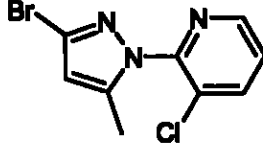
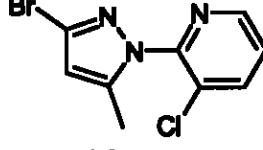
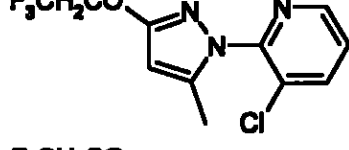
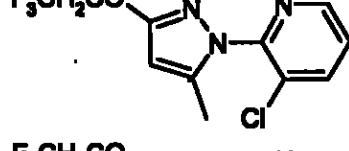
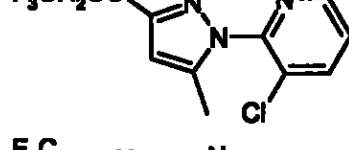
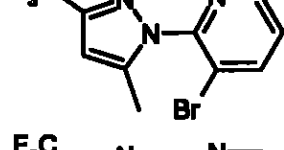
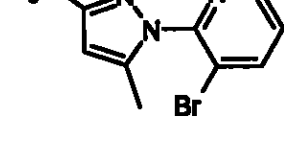
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.51	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.52	O	S		H	H	CH ₃
A.53	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.54	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.55	O	S		H	H	CH ₃
A.56	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.57	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.58	O	S		H	H	CH ₃
A.59	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.60	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂

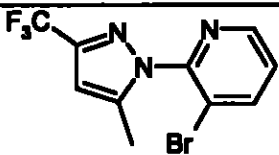
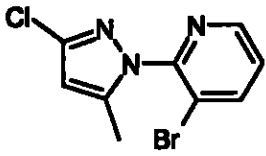
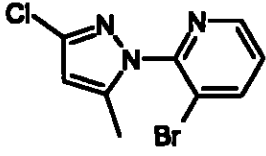
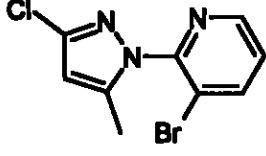
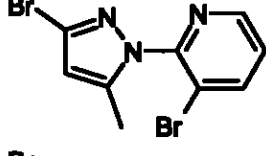
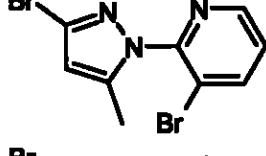
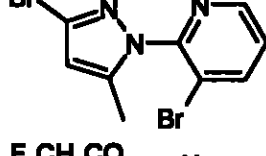
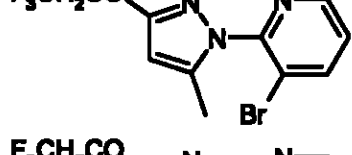
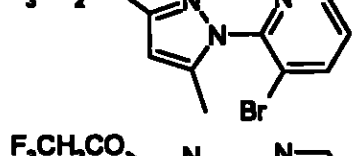
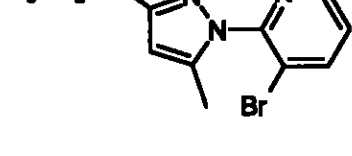
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.61	O	S		H	H	CH ₃
A.62	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.63	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.64	O	S		H	H	CH ₃
A.65	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.66	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.67	O	S		H	H	CH ₃
A.68	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.69	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.70	O	S		H	H	CH ₃

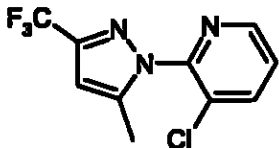
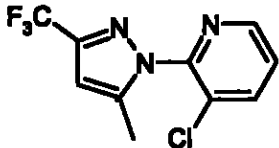
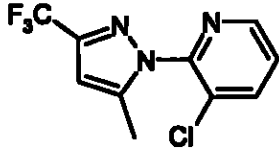
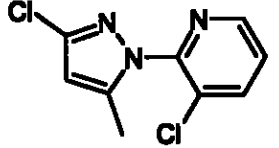
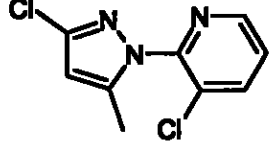
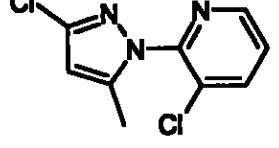
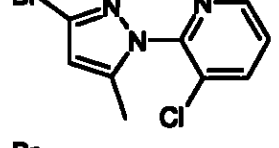
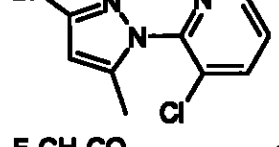
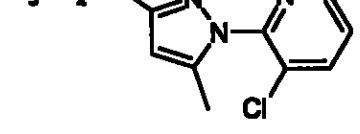
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.71	O	S		H	H	CH ₂ CH ₃
A.72	O	S		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.73	S	O		H	H	CH ₃
A.74	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.75	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.76	S	O		H	H	CH ₃
A.77	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.78	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.79	S	O		H	H	CH ₃
A.80	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃

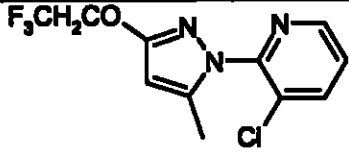
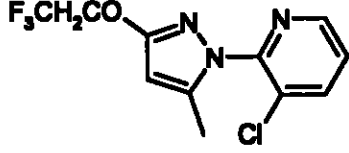
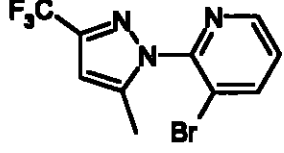
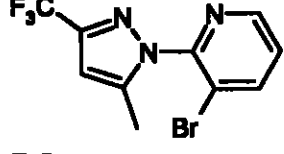
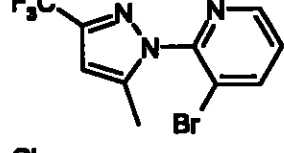
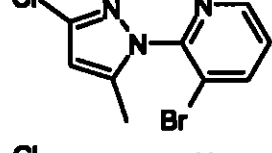
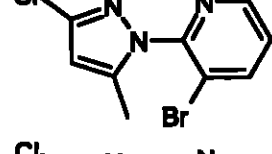
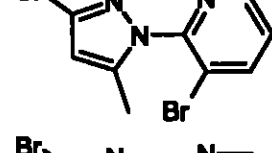
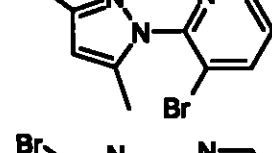
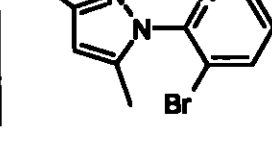
Linea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.81	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.82	S	O		H	H	CH ₃
A.83	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.84	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.85	S	O		H	H	CH ₃
A.86	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.87	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.88	S	O		H	H	CH ₃
A.89	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.90	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂

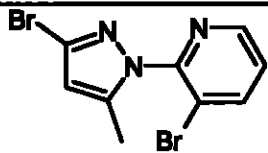
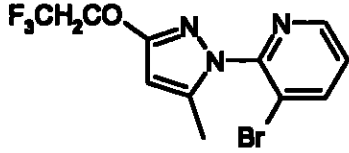
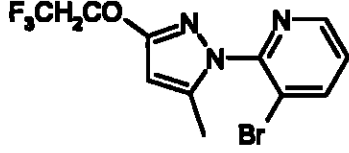
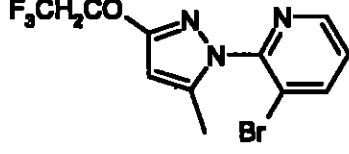
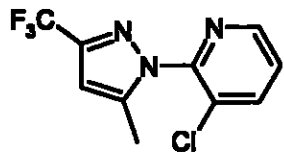
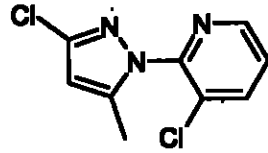
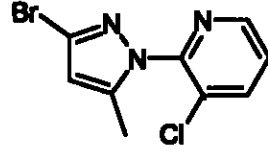
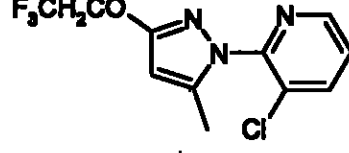
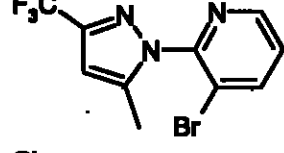
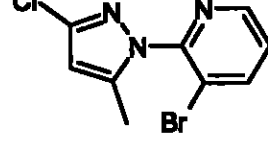
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.91	S	O		H	H	CH ₃
A.92	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.93	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.94	S	O		H	H	CH ₃
A.95	S	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.96	S	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.97	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.98	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.99	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.100	O	O		CH ₃	H	CH ₃

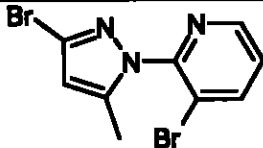
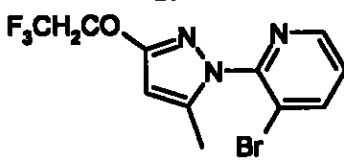
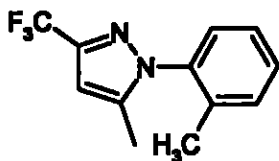
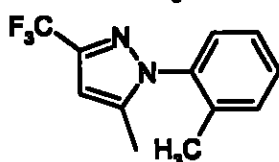
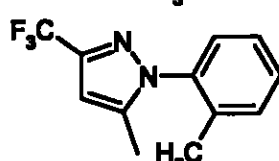
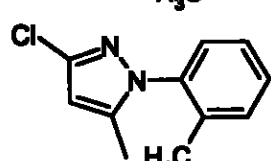
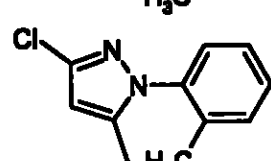
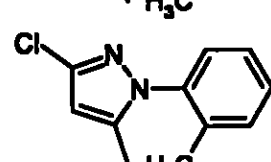
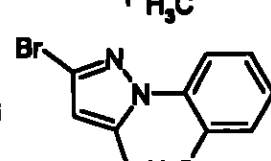
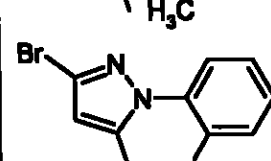
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.10 1	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.10 2	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.10 3	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.10 4	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.10 5	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.10 6	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.10 7	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.10 8	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.10 9	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.11 0	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃

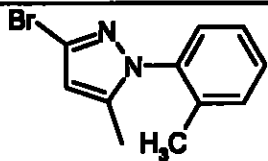
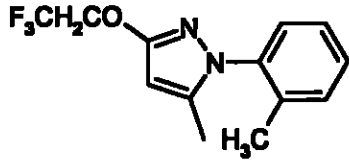
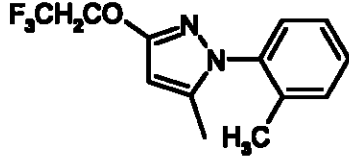
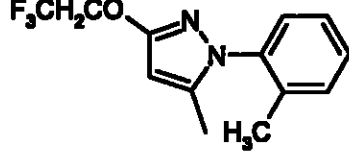
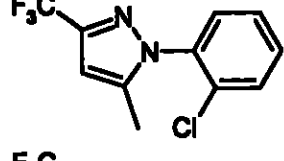
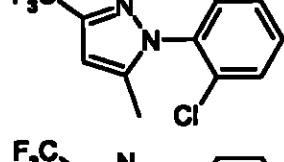
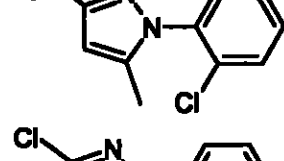
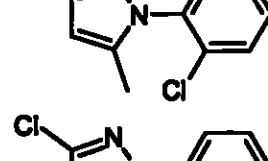
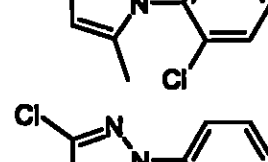
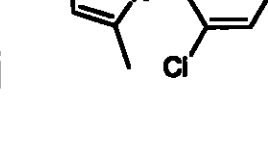
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.11 1	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.11 2	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.11 3	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.11 4	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.11 5	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.11 6	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.11 7	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂
A.11 8	O	O		CH ₃	H	CH ₃
A.11 9	O	O		CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
A.12 0	O	O		CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂

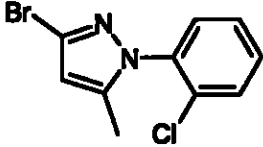
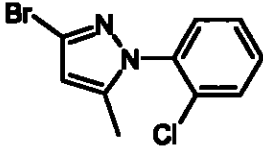
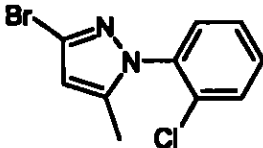
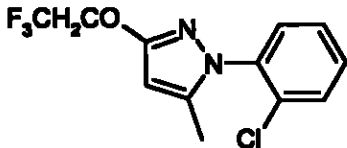
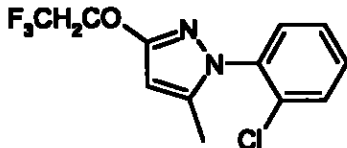
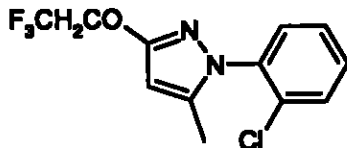
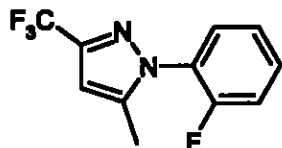
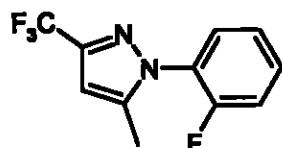
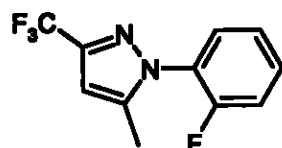
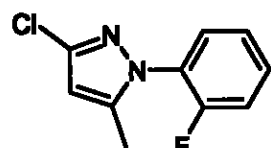
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.12 1	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.12 2	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.12 3	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.12 4	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.12 5	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.12 6	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.12 7	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.12 8	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.12 9	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.13 0	O	O		H	CH ₃	CH ₃

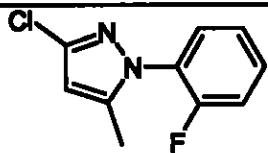
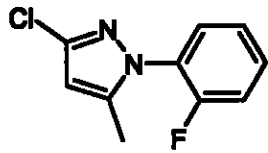
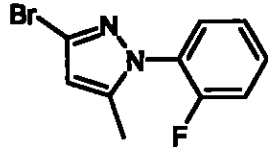
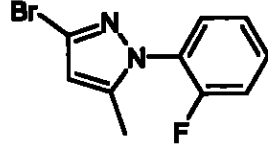
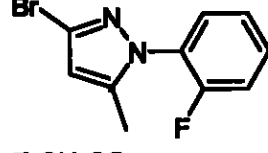
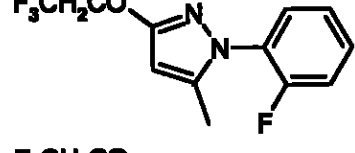
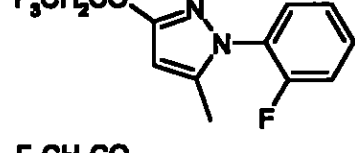
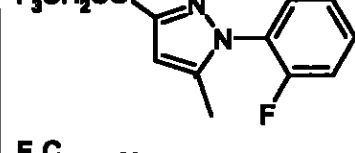
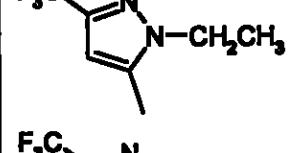
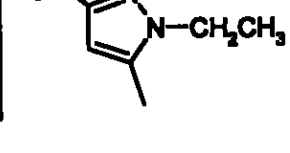
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.13 1	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.13 2	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.13 3	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.13 4	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.13 5	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.13 6	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.13 7	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.13 8	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.13 9	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.14 0	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃

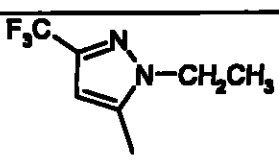
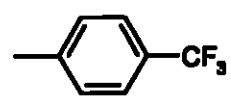
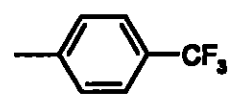
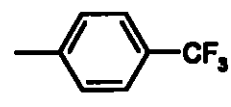
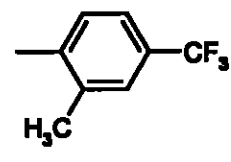
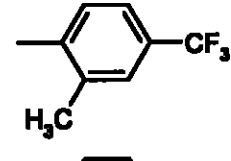
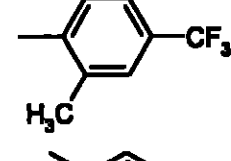
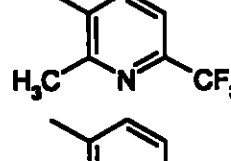
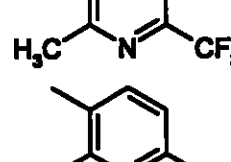
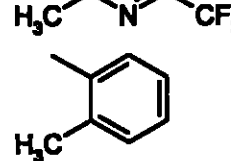
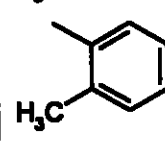
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.14 1	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.14 2	O	O		H	CH ₃	CH ₃
A.14 3	O	O		H	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A.14 4	O	O		H	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A.14 5	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.14 6	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.14 7	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.14 8	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.14 9	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.15 0	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.15 1	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.15 2	O	O		H	H	C(CH ₃) ₃
A.15 3	O	O		H	H	CH ₃
A.15 4	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.15 5	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.15 6	O	O		H	H	CH ₃
A.15 7	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.15 8	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.15 9	O	O		H	H	CH ₃
A.16 0	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

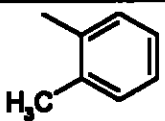
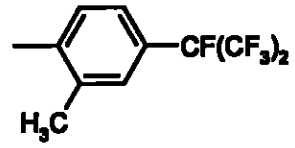
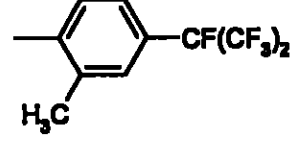
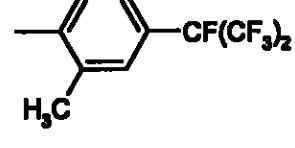
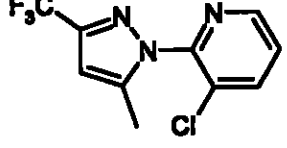
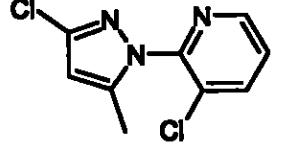
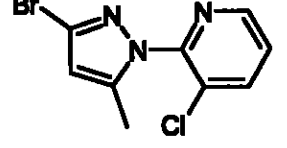
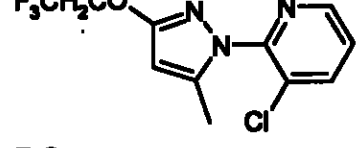
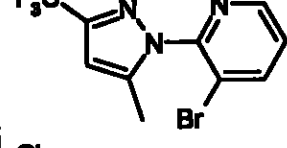
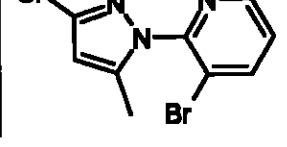
Linea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.16 1	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16 2	O	O		H	H	CH ₃
A.16 3	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.16 4	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16 5	O	O		H	H	CH ₃
A.16 6	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.16 7	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.16 8	O	O		H	H	CH ₃
A.16 9	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.17 0	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂

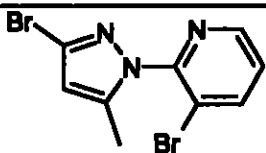
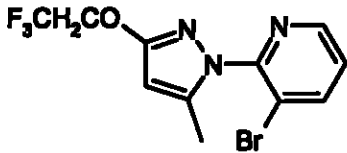
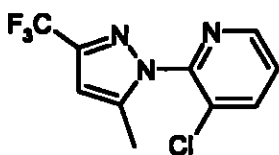
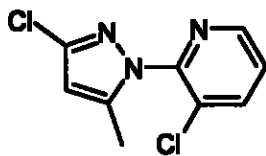
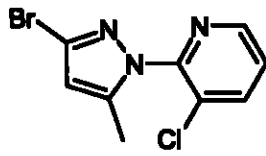
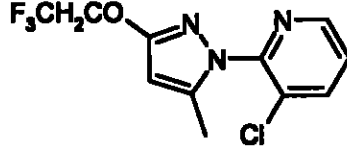
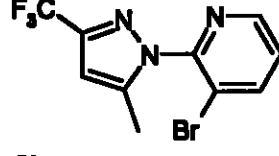
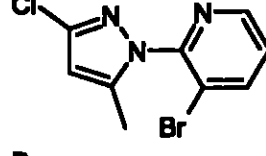
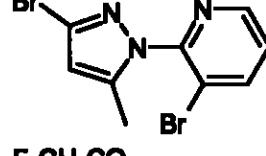
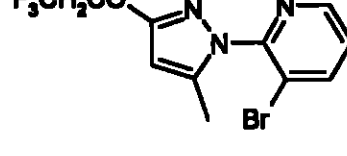
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.17 1	O	O		H	H	CH ₃
A.17 2	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.17 3	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.17 4	O	O		H	H	CH ₃
A.17 5	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.17 6	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.17 7	O	O		H	H	CH ₃
A.17 8	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.17 9	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.18 0	O	O		H	H	CH ₃

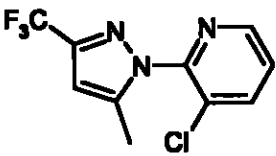
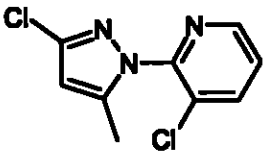
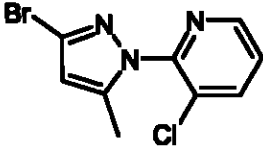
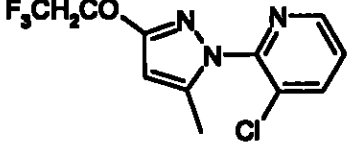
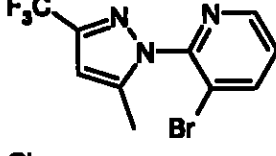
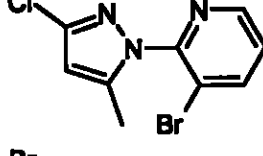
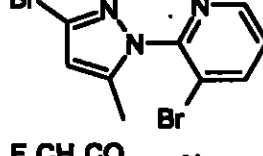
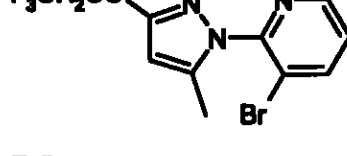
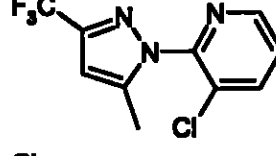
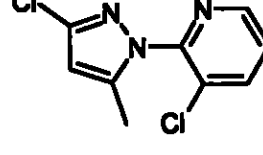
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.18 1	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18 2	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.18 3	O	O		H	H	CH ₃
A.18 4	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18 5	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.18 6	O	O		H	H	CH ₃
A.18 7	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.18 8	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.18 9	O	O		H	H	CH ₃
A.19 0	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

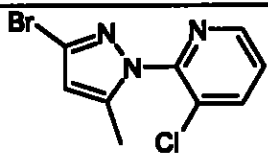
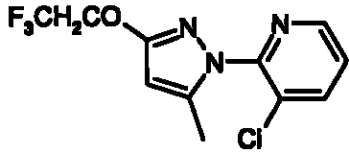
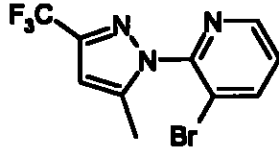
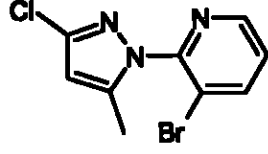
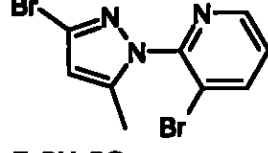
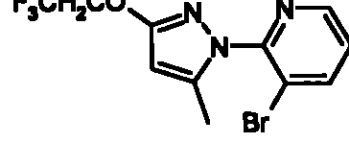
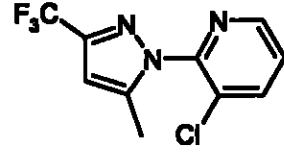
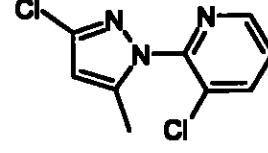
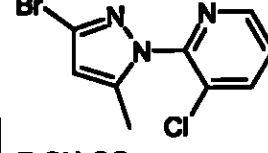
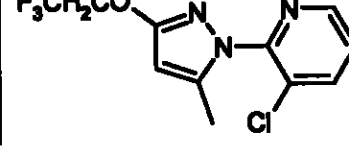
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.19 1	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19 2	O	O		H	H	CH ₃
A.19 3	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.19 4	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19 5	O	O		H	H	CH ₃
A.19 6	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.19 7	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.19 8	O	O		H	H	CH ₃
A.19 9	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.20 0	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.20 1	O	O		H	H	CH ₃
A.20 2	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃

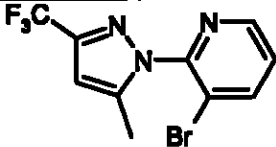
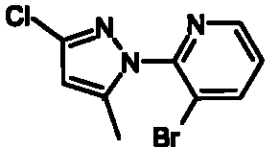
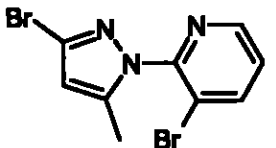
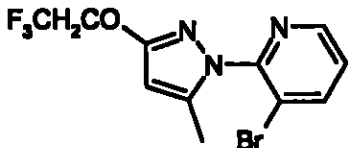
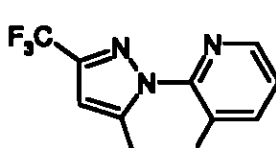
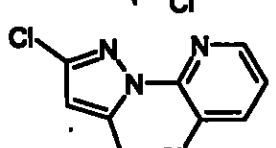
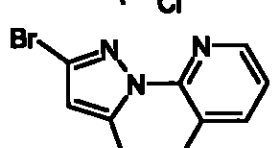
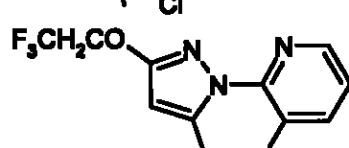
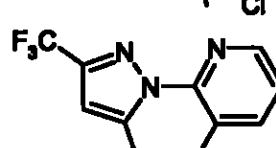
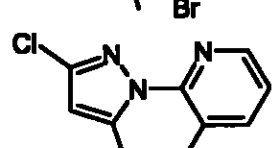
378
378

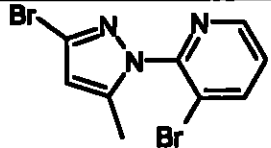
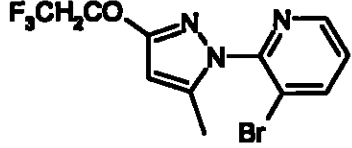
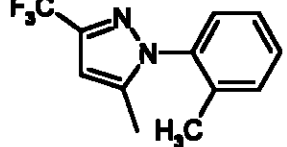
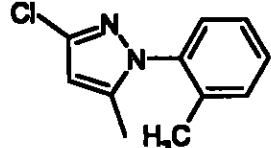
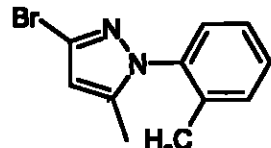
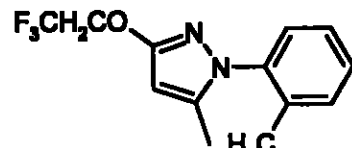
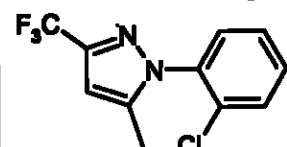
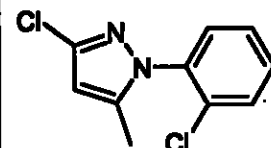
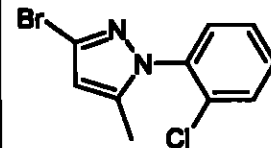
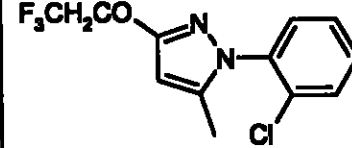
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.20 3	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.20 4	O	O		H	H	CH ₃
A.20 5	O	O		H	H	CH ₂ CH ₃
A.20 6	O	O		H	H	CH(CH ₃) ₂
A.20 7	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.20 8	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.20 9	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.21 0	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.21 1	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.21 2	O	O		H	H	Ciclopropilo

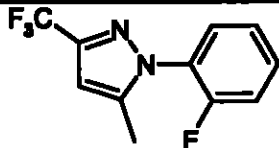
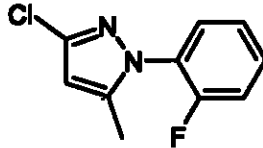
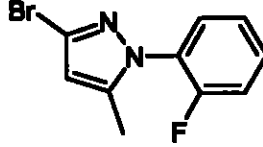
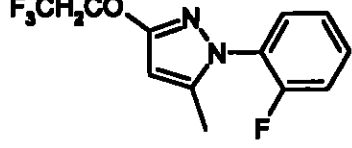
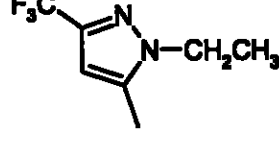
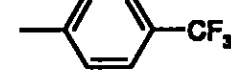
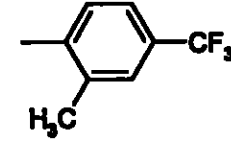
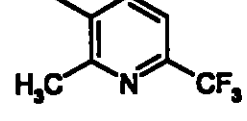
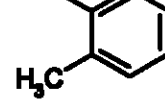
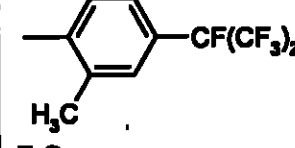
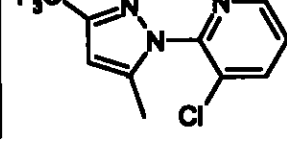
Linea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.21 3	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.21 4	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.21 5	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.21 6	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.21 7	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.21 8	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.21 9	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 0	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 1	S	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 2	S	S		H	H	Ciclopropilo

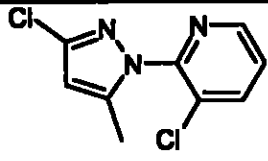
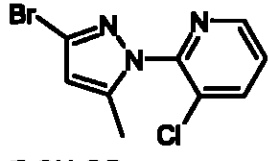
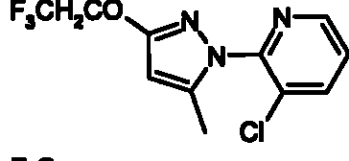
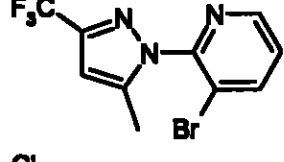
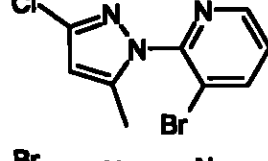
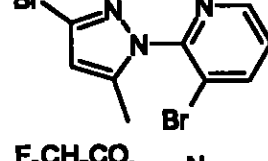
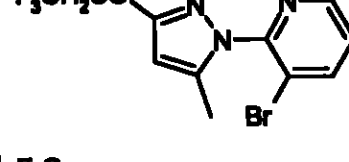
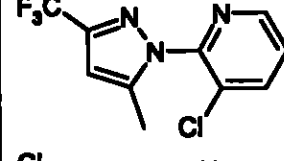
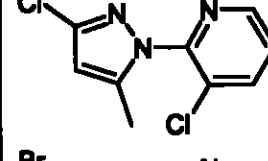
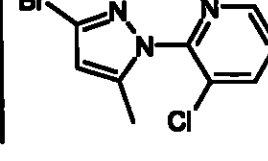
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.22 3	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 4	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 5	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 6	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 7	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 8	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.22 9	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.23 0	O	S		H	H	Ciclopropilo
A.23 1	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 2	S	O		H	H	Ciclopropilo

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.23 3	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 4	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 5	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 6	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 7	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 8	S	O		H	H	Ciclopropilo
A.23 9	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 0	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 1	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 2	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo

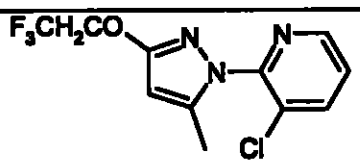
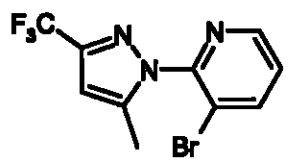
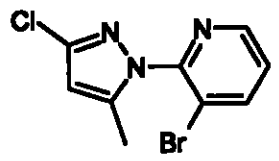
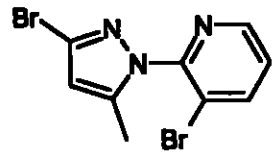
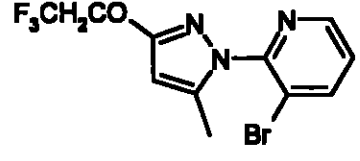
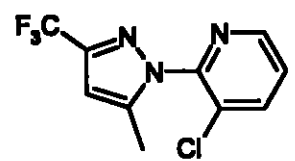
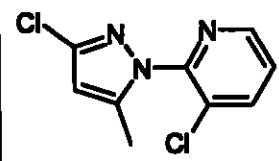
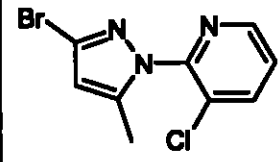
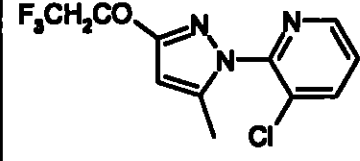
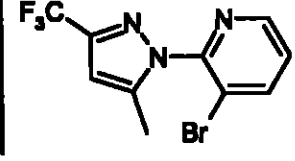
Línea	Z 1	Z 2	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.24 3	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 4	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 5	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 6	O	O		CH ₃	H	Ciclopropilo
A.24 7	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.24 8	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.24 9	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.25 0	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.25 1	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.25 2	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo

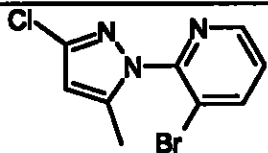
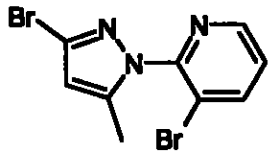
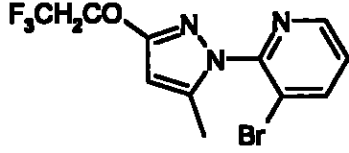
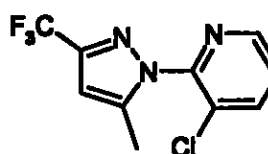
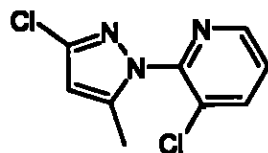
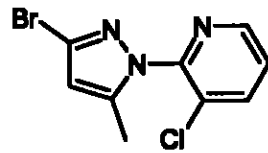
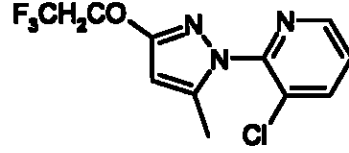
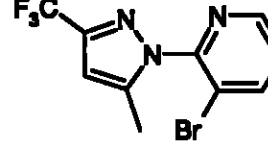
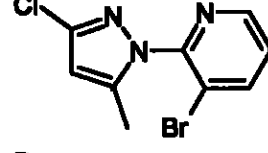
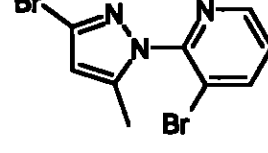
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.25 3	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.25 4	O	O		H	CH ₃	Ciclopropilo
A.25 5	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.25 6	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.25 7	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.25 8	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.25 9	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 0	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 1	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 2	O	O		H	H	Ciclopropilo

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.26 3	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 4	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 5	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 6	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 7	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 8	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.26 9	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.27 0	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.27 1	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.27 2	O	O		H	H	Ciclopropilo
A.27 3	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.27 4	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.27 5	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.27 6	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.27 7	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.27 8	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.27 9	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 0	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 1	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 2	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 3	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

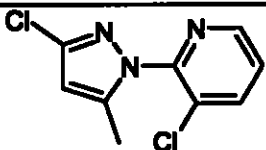
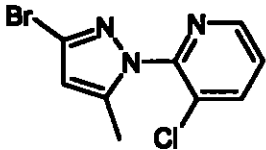
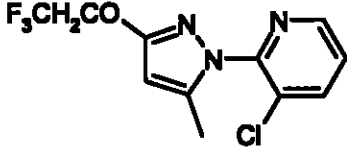
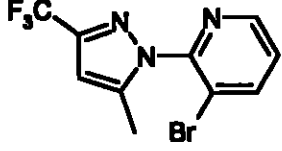
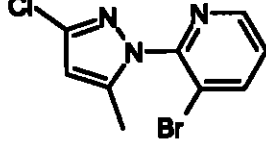
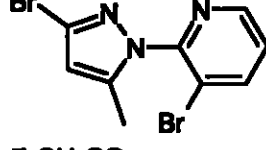
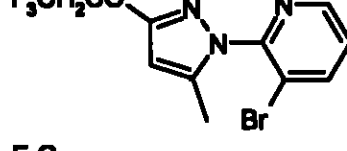
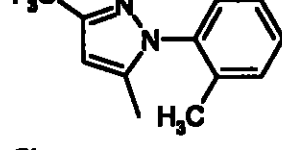
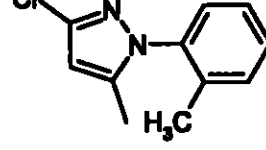
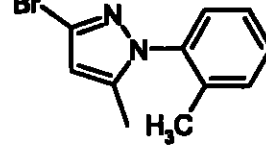
386
386

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.28 4	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 5	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 6	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 7	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 8	S	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.28 9	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 0	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 1	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 2	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 3	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

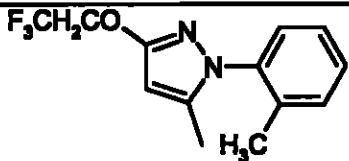
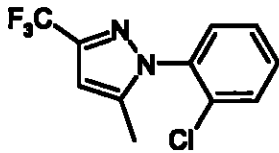
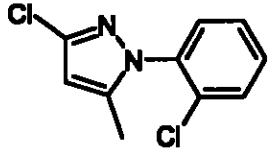
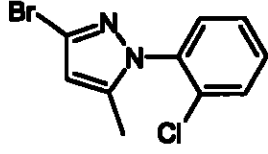
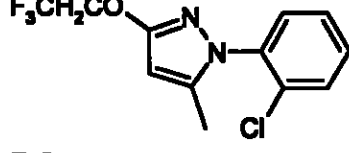
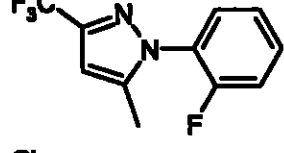
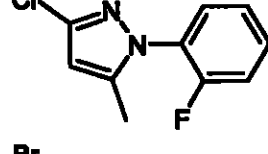
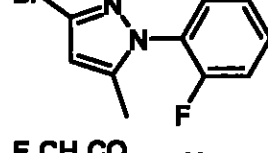
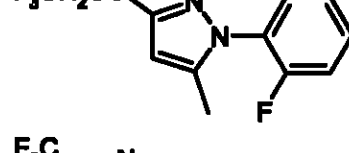
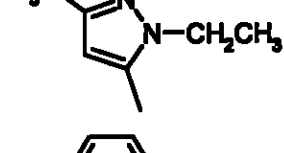
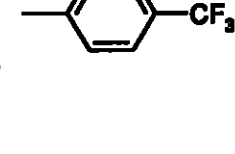
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.29 4	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 5	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 6	O	S		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 7	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 8	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.29 9	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 0	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 1	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 2	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 3	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

388
388

Linea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.30 4	S	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 5	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 6	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 7	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 8	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.30 9	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 0	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 1	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 2	O	O		CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 3	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.31 4	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 5	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 6	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 7	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 8	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.31 9	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 0	O	O		H	CH ₃	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 1	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 2	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 3	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

390
390

Linea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.32 4	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 5	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 6	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 7	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 8	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.32 9	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 0	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 1	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 2	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 3	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 4	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

391
291

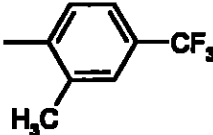
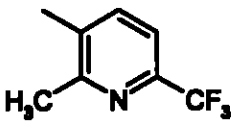
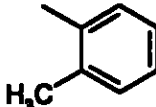
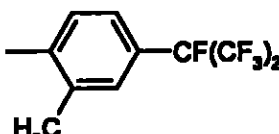
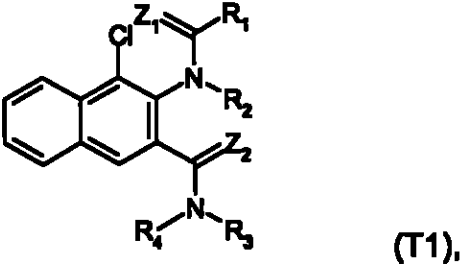
Línea	Z ₁	Z ₂	-R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
A.33 5	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 6	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 7	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
A.33 8	O	O		H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

Tabla 1: Esta tabla describe los 338 compuestos T1.1 a T.338 de la fórmula

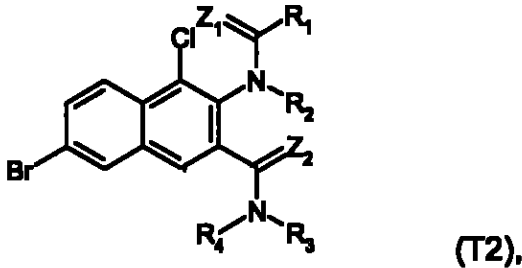


en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ y R₄ tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Por ejemplo, el compuesto específico T1.23 es el compuesto de la fórmula T1, en la cual cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ y R₄ tiene un significado específico proporcionado en la línea A.23 de la Tabla A. De acuerdo con el mismo sistema, también todos los demás 337 compuestos específicos descritos en la Tabla 1 como así también todos los compuestos específicos descritos en las Tablas 2 a 85 son análogamente especificados.

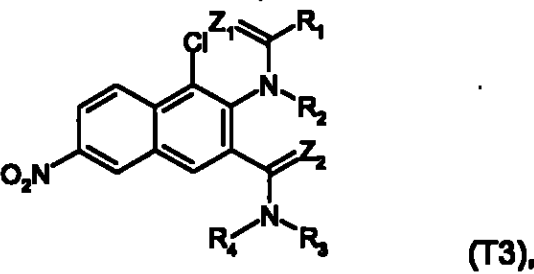
392 -
392

Tabla 2: Esta tabla describe los 338 compuestos T2.1 a T2.338 de la fórmula



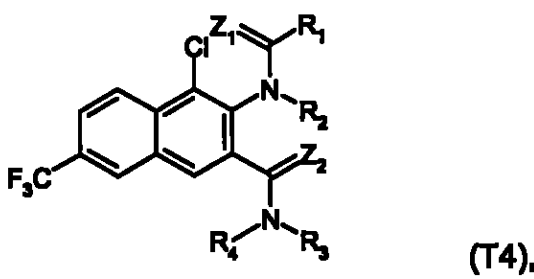
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 3: Esta tabla describe los 338 compuestos T3.1 a T3.338 de la fórmula



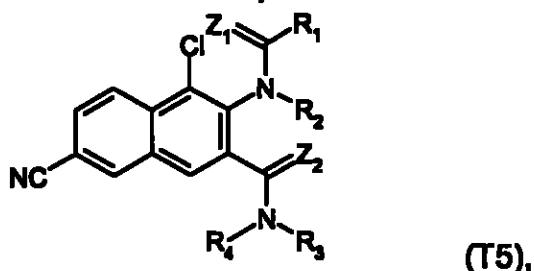
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 4: Esta tabla describe los 338 compuestos T4.1 a T4.338 de la fórmula



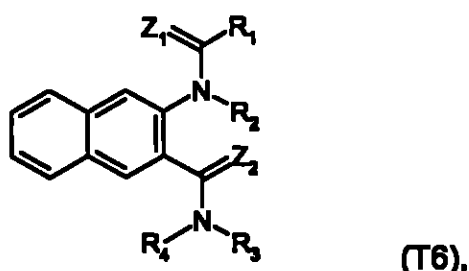
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 5: Esta tabla describe los 338 compuestos T5.1 a T5.338 de la fórmula



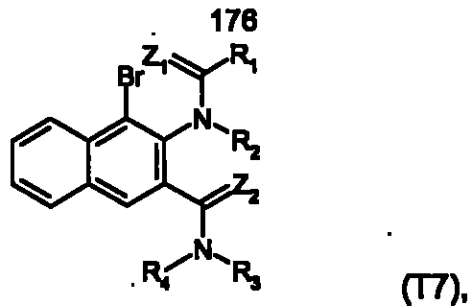
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 6: Esta tabla describe los 338 compuestos T6.1 a T6.338 de la fórmula



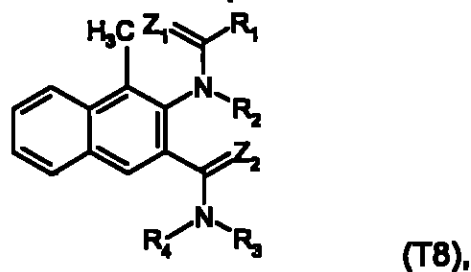
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 7: Esta tabla describe los 338 compuestos T7.1 a T7.338 de la fórmula



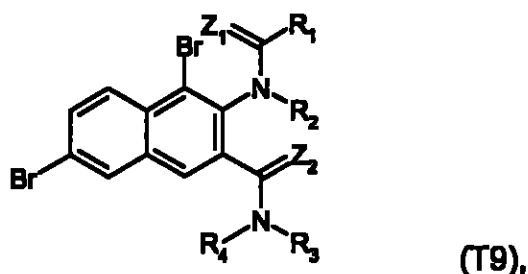
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 8: Esta tabla describe los 338 compuestos T8.1 a T8.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

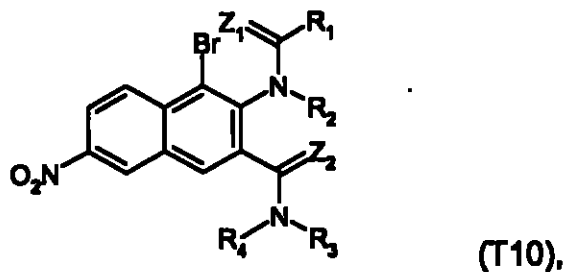
Tabla 9: Esta tabla describe los 338 compuestos T9.1 a T9.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico

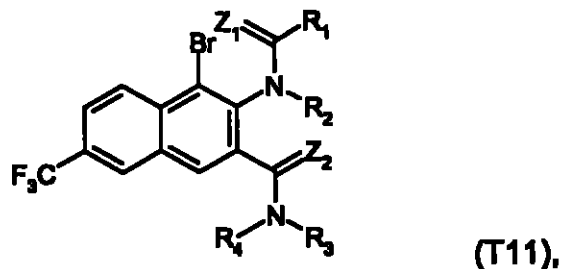
proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 10: Esta tabla describe los 338 compuestos T10.1 a T10.338 de la fórmula



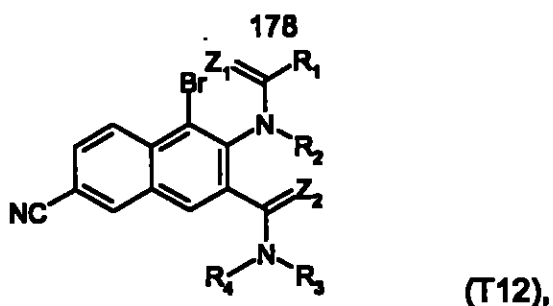
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 11: Esta tabla describe los 338 compuestos T11.1 a T11.338 de la fórmula



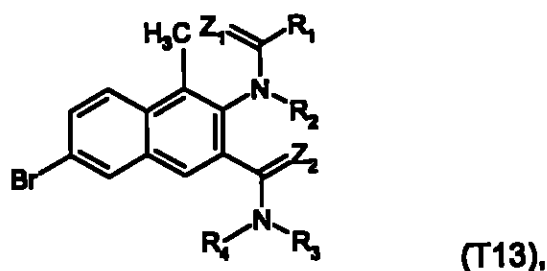
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 12: Esta tabla describe los 338 compuestos T12.1 a T12.338 de la fórmula



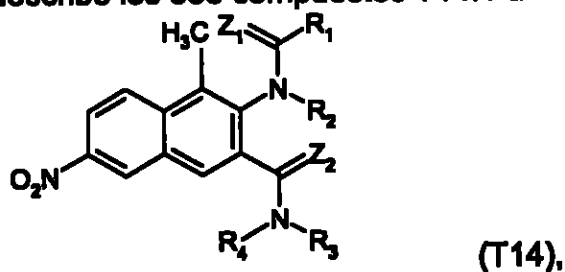
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 13: Esta tabla describe los 338 compuestos T13.1 a T13.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

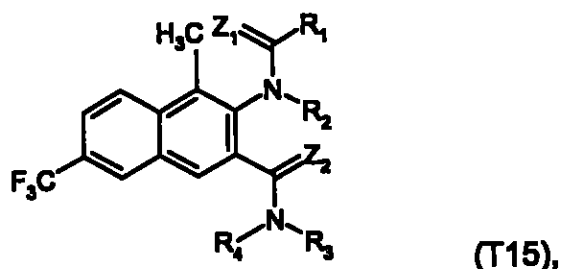
Tabla 14: Esta tabla describe los 338 compuestos T14.1 a T14.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico

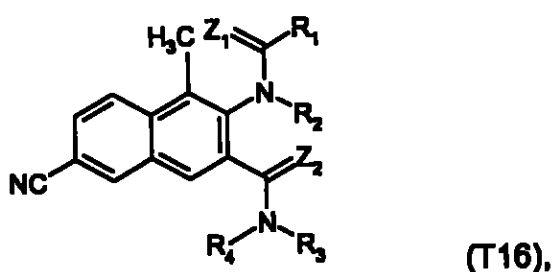
proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 15: Esta tabla describe los 338 compuestos T15.1 a T15.338 de la fórmula



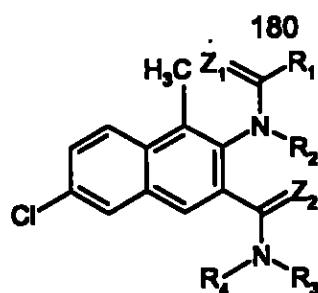
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 16: Esta tabla describe los 338 compuestos T16.1 a T16.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

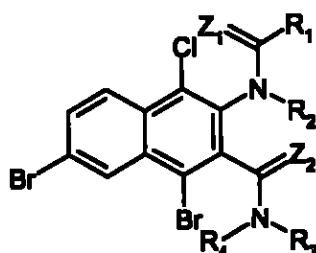
Tabla 17: Esta tabla describe los 338 compuestos T17.1 a T17.338 de la fórmula



(T17),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

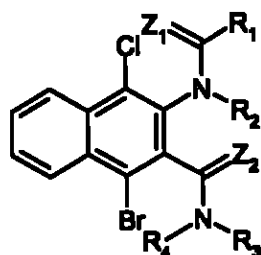
Tabla 18: Esta tabla describe los 338 compuestos T18.1 a T18.338 de la fórmula



(T18),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tiene un significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

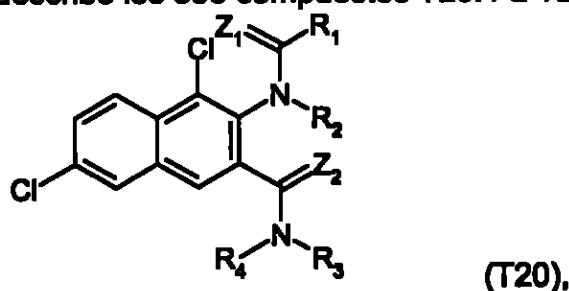
Tabla 19: Esta tabla describe los 338 compuestos T19.1 a T19.338 de la fórmula



(T19),

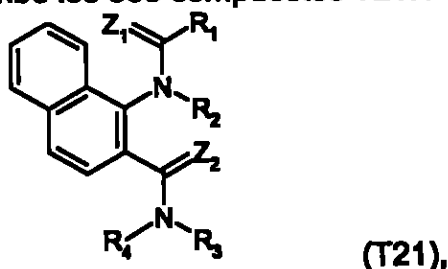
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 20: Esta tabla describe los 338 compuestos T20.1 a T20.338 of the formula



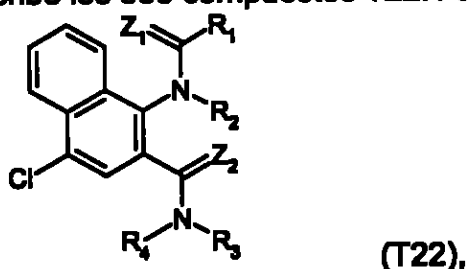
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 21: Esta tabla describe los 338 compuestos T21.1 a T21.338 of the formula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

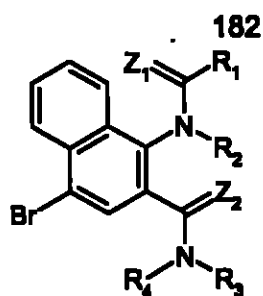
Tabla 22: Esta tabla describe los 338 compuestos T22.1 a T22.338 of the formula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 23: Esta tabla describe los 338 compuestos T23.1 a T23.338 of the formula

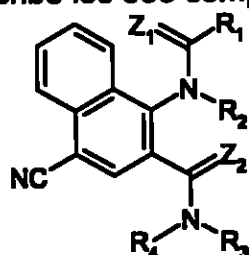
406
400



(T23),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

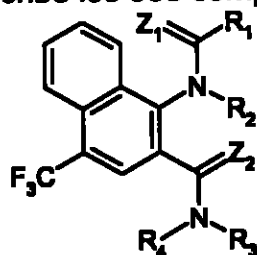
Tabla 24: Esta tabla describe los 338 compuestos T24.1 a T24.338 of the formula



(T24),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

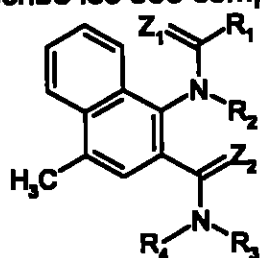
Tabla 25: Esta tabla describe los 338 compuestos T25.1 a T25.338 of the formula



(T25),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

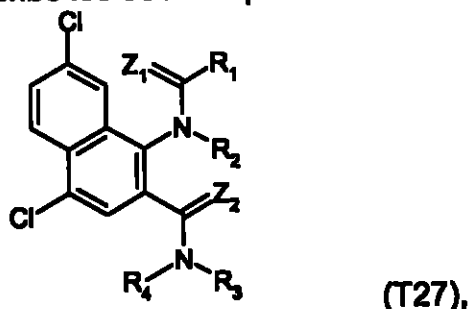
Tabla 26: Esta tabla describe los 338 compuestos T26.1 a T26.338 of the formula



(T26),

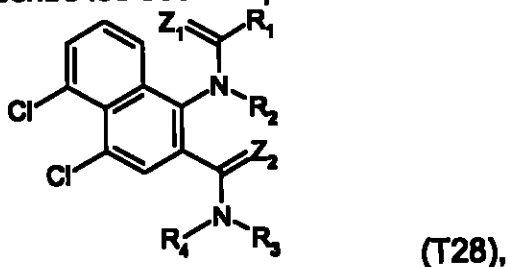
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 27: Esta tabla describe los 338 compuestos T27.1 a T27.338 of the formula



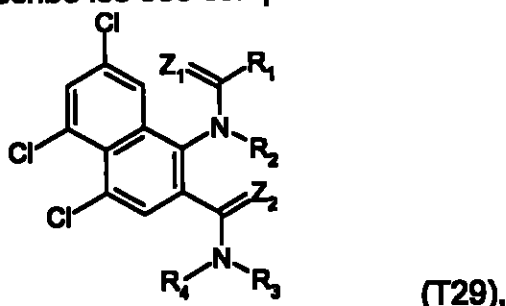
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 28: Esta tabla describe los 338 compuestos T28.1 a T28.338 of the formula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

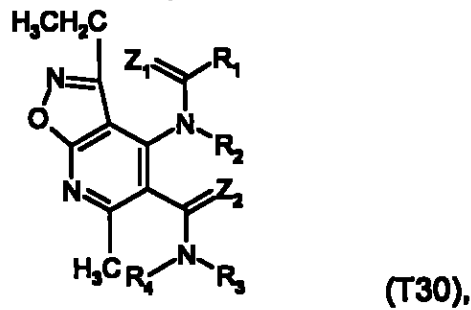
Tabla 29: Esta tabla describe los 338 compuestos T29.1 a T29.338 of the formula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

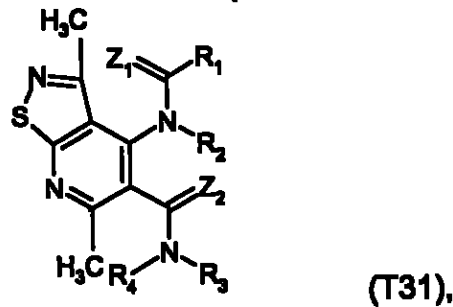
Tabla 30: Esta tabla describe los 338 compuestos T30.1 a T30.338 de la fórmula

184



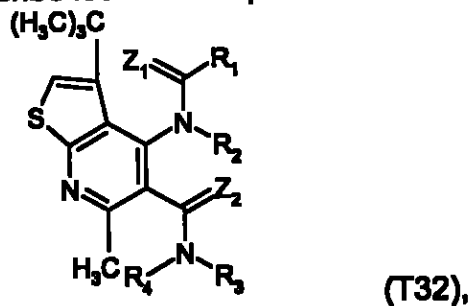
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 31: Esta tabla describe los 338 compuestos T31.1 a T31.338 de la fórmula



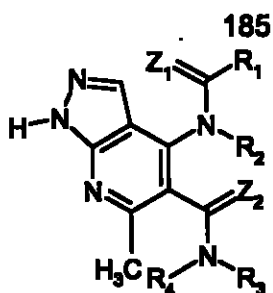
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 32: Esta tabla describe los 338 compuestos T32.1 a T32.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

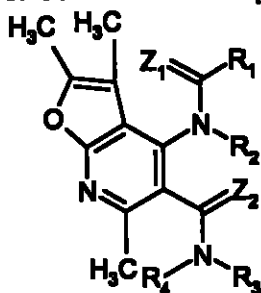
Tabla 33: Esta tabla describe los 338 compuestos T33.1 a T33.338 de la fórmula



(T33),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

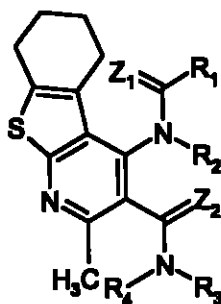
Tabla 34: Esta tabla describe los 338 compuestos T34.1 a T34.338 de la fórmula



(T34),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 35: Esta tabla describe los 338 compuestos T35.1 a T35.338 de la fórmula

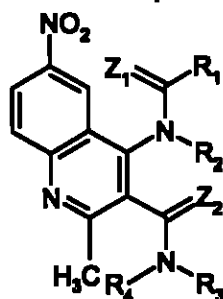


(T35),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 36: Esta tabla describe los 338 compuestos T36.1 a T36.338 de la fórmula

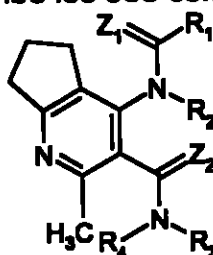
186



(T36),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

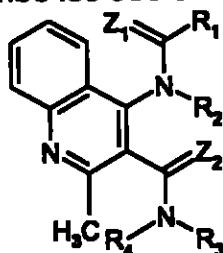
Tabla 37: Esta tabla describe los 338 compuestos T37.1 a T37.338 de la fórmula



(T37),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

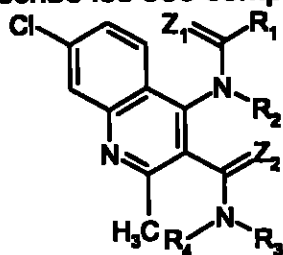
Tabla 38: Esta tabla describe los 338 compuestos T38.1 a T38.338 de la fórmula



(T38),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

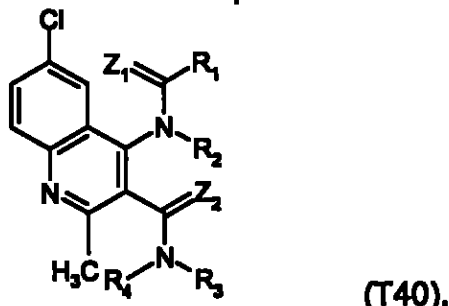
Tabla 39: Esta tabla describe los 338 compuestos T39.1 a T39.338 de la fórmula



(T39),

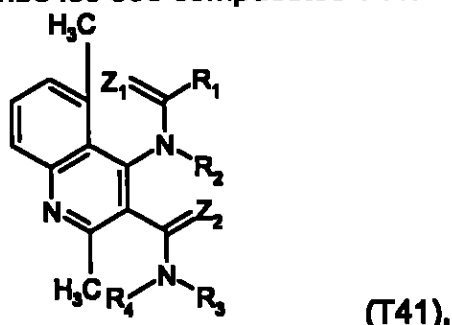
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 40: Esta tabla describe los 338 compuestos T40.1 a T40.338 de la fórmula



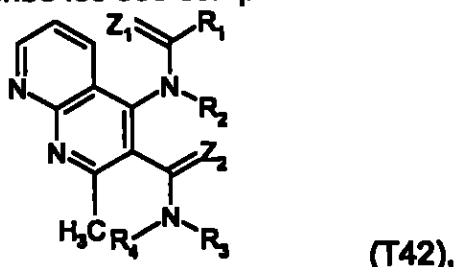
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 41: Esta tabla describe los 338 compuestos T41.1 a T41.338 de la fórmula



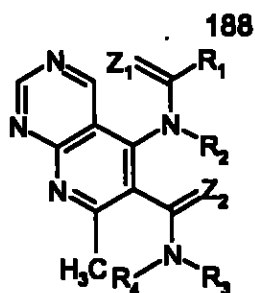
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 42: Esta tabla describe los 338 compuestos T42.1 a T42.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

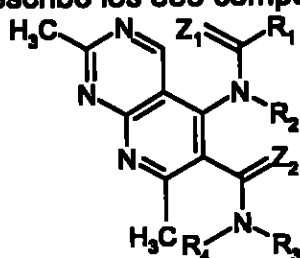
Tabla 43: Esta tabla describe los 338 compuestos T43.1 a T43.338 de la fórmula



(T43),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

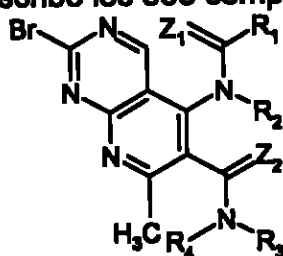
Tabla 44: Esta tabla describe los 338 compuestos T44.1 a T44.338 de la fórmula



(T44),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

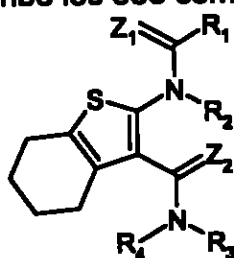
Tabla 45: Esta tabla describe los 338 compuestos T45.1 a T45.338 de la fórmula



(T45),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

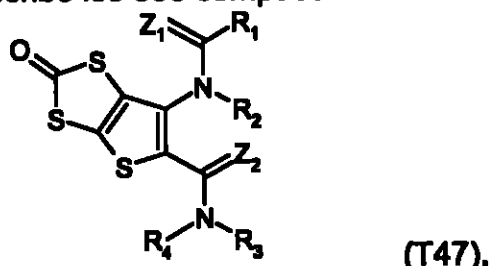
Tabla 46: Esta tabla describe los 338 compuestos T46.1 a T46.338 de la fórmula



(T46),

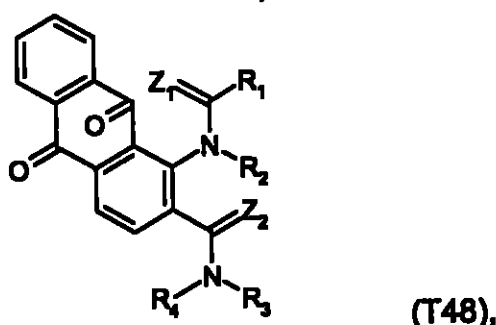
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 47: Esta tabla describe los 338 compuestos T47.1 a T47.338 de la fórmula



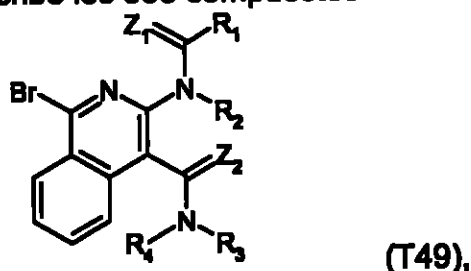
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 48: Esta tabla describe los 338 compuestos T48.1 a T48.338 de la fórmula



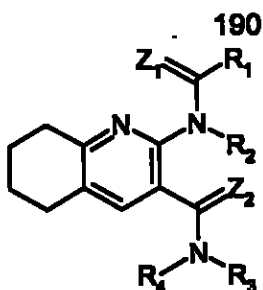
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 49: Esta tabla describe los 338 compuestos T49.1 a T49.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

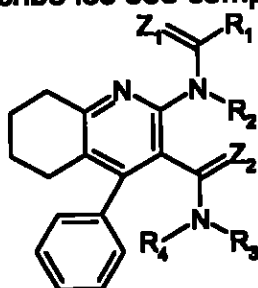
Tabla 50: Esta tabla describe los 338 compuestos T50.1 a T50.338 de la fórmula



(T50).

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

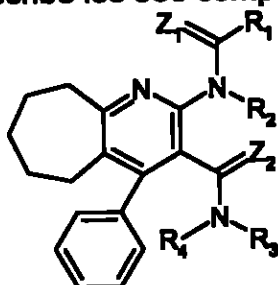
Tabla 51: Esta tabla describe los 338 compuestos T51.1 a T51.338 de la fórmula



(T51).

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

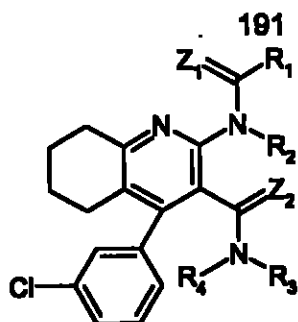
Tabla 52: Esta tabla describe los 338 compuestos T52.1 a T52.338 de la fórmula



(T52).

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

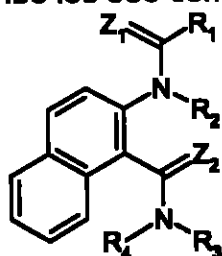
Tabla 53: Esta tabla describe los 338 compuestos T53.1 a T53.338 de la fórmula



(T53),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

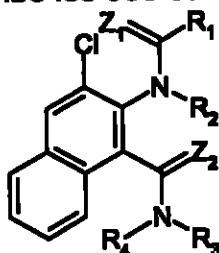
Tabla 54: Esta tabla describe los 338 compuestos T54.1 a T54.338 de la fórmula



(T54),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

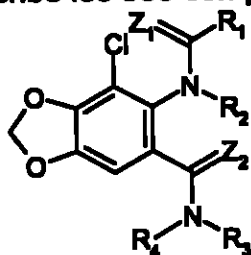
Tabla 55: Esta tabla describe los 338 compuestos T55.1 a T55.338 de la fórmula



(T55),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

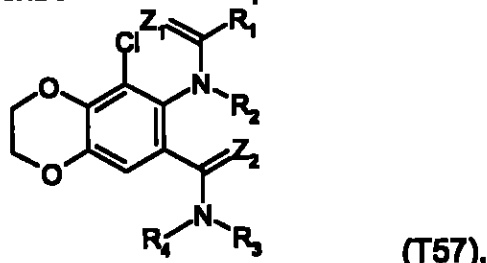
Tabla 56: Esta tabla describe los 338 compuestos T56.1 a T56.338 de la fórmula



(T56),

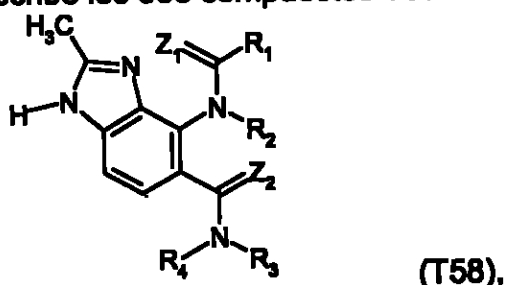
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 57: Esta tabla describe los 338 compuestos T57.1 a T57.338 de la fórmula



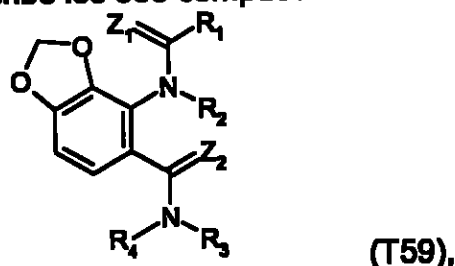
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 58: Esta tabla describe los 338 compuestos T58.1 a T58.338 de la fórmula



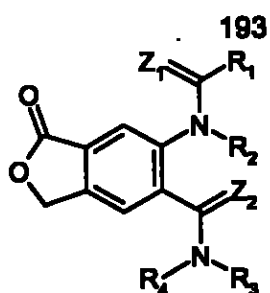
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 59: Esta tabla describe los 338 compuestos T59.1 a T59.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

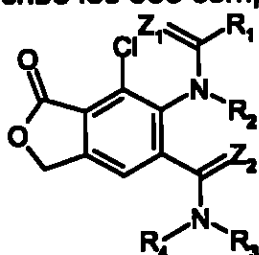
Tabla 60: Esta tabla describe los 338 compuestos T60.1 a T60.338 de la fórmula



(T60),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

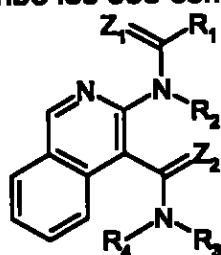
Tabla 61: Esta tabla describe los 338 compuestos T61.1 a T61.338 de la fórmula



(T61),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

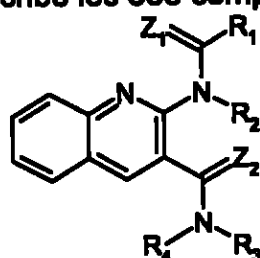
Tabla 62: Esta tabla describe los 338 compuestos T62.1 a T62.338 de la fórmula



(T62),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

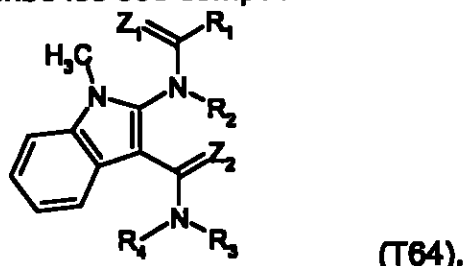
Tabla 63: Esta tabla describe los 338 compuestos T63.1 a T63.338 de la fórmula



(T63),

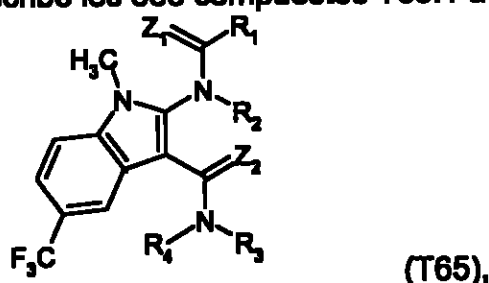
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 64: Esta tabla describe los 338 compuestos T64.1 a T64.338 de la fórmula



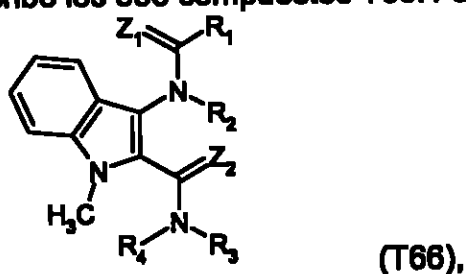
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 65: Esta tabla describe los 338 compuestos T65.1 a T65.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

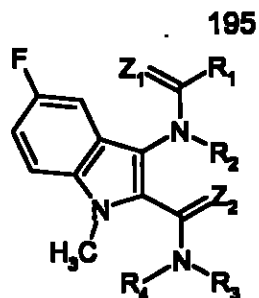
Tabla 66: Esta tabla describe los 338 compuestos T66.1 a T66.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 67: Esta tabla describe los 338 compuestos T67.1 a T67.338 de la fórmula

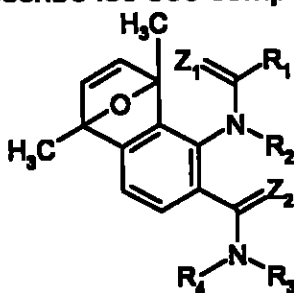
413
413



(T67),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

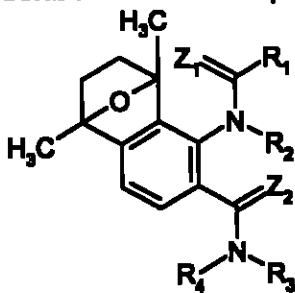
Tabla 68: Esta tabla describe los 338 compuestos T68.1 a T68.338 de la fórmula



(T68),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

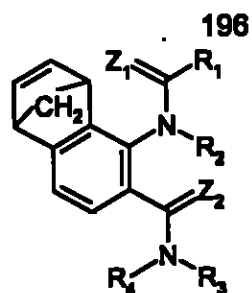
Tabla 69: Esta tabla describe los 338 compuestos T69.1 a T69.338 de la fórmula



(T69),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

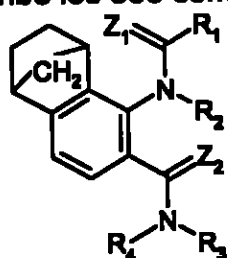
Tabla 70: Esta tabla describe los 338 compuestos T70.1 a T70.338 de la fórmula



(T70),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

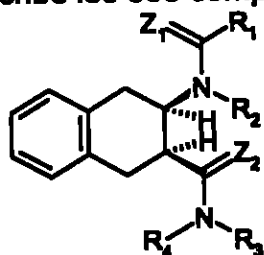
Tabla 71: Esta tabla describe los 338 compuestos T71.1 a T71.338 de la fórmula



(T71),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

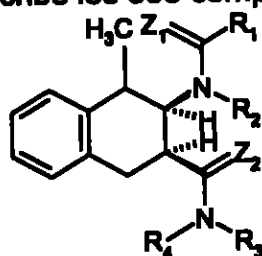
Tabla 72: Esta tabla describe los 338 compuestos T72.1 a T72.338 de la fórmula



(T72),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

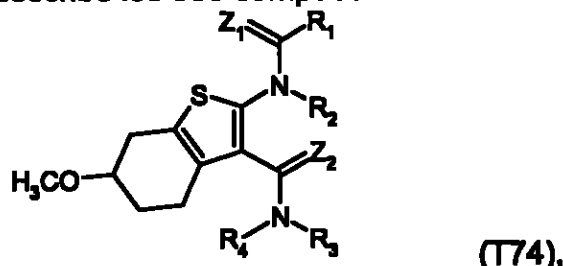
Tabla 73: Esta tabla describe los 338 compuestos T73.1 a T73.338 de la fórmula



(T73),

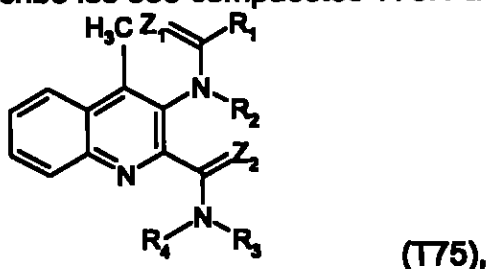
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 74: Esta tabla describe los 338 compuestos T74.1 a T74.338 de la fórmula



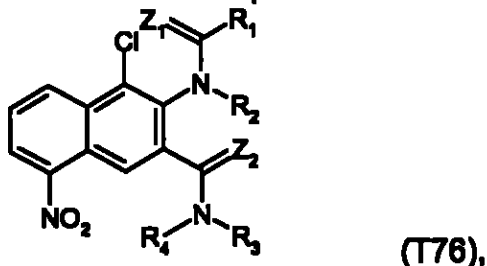
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 75: Esta tabla describe los 338 compuestos T75.1 a T75.338 de la fórmula



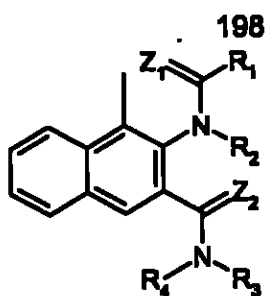
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 76: Esta tabla describe los 338 compuestos T76.1 a T76.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

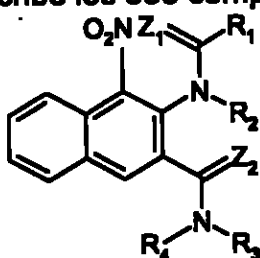
Tabla 77: Esta tabla describe los 338 compuestos T77.1 a T77.338 de la fórmula



(T77),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

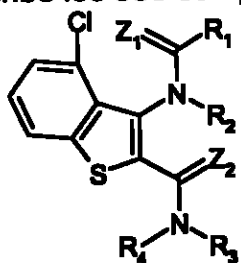
Tabla 78: Esta tabla describe los 338 compuestos T78.1 a T78.338 de la fórmula



(T78),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

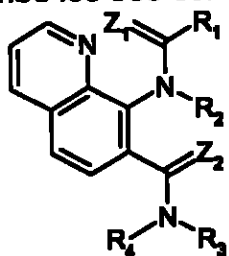
Tabla 79: Esta tabla describe los 338 compuestos T79.1 a T79.338 de la fórmula



(T79),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

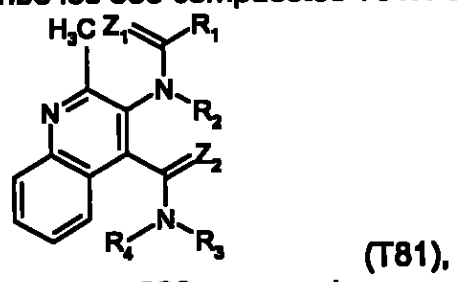
Tabla 80: Esta tabla describe los 338 compuestos T80.1 a T80.338 de la fórmula



(T80),

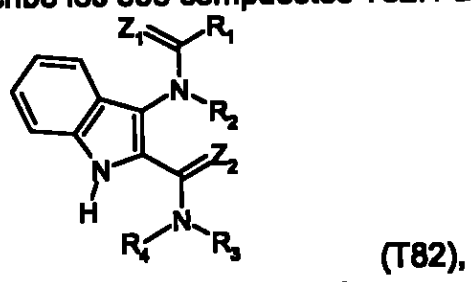
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 81: Esta tabla describe los 338 compuestos T81.1 a T81.338 de la fórmula



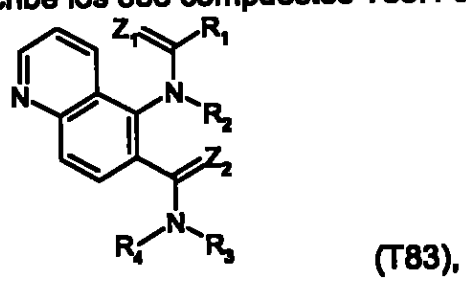
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 82: Esta tabla describe los 338 compuestos T82.1 a T82.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

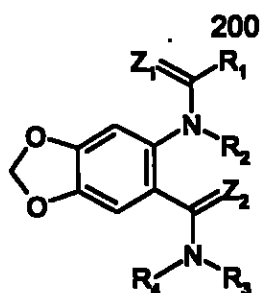
Tabla 83: Esta tabla describe los 338 compuestos T83.1 a T83.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 84: Esta tabla describe los 338 compuestos T84.1 a T84.338 de la fórmula

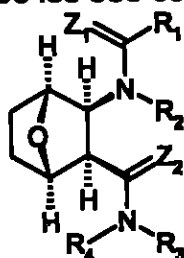
418
410



(T84),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

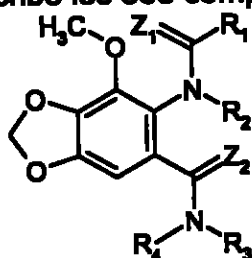
Tabla 85: Esta tabla describe los 338 compuestos T85.1 a T85.338 de la fórmula



(T85),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

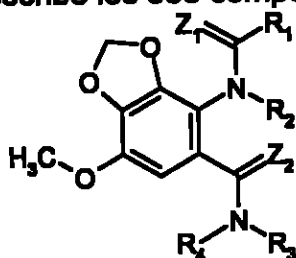
Tabla 86: Esta tabla describe los 338 compuestos T86.1 a T86.338 de la fórmula



(T86),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

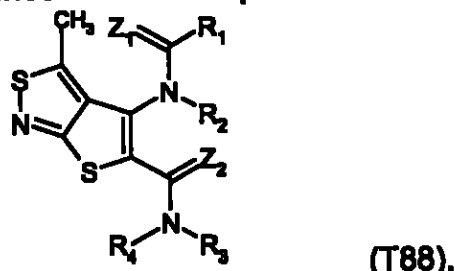
Tabla 87: Esta tabla describe los 338 compuestos T87.1 a T87.338 de la fórmula



(T87),

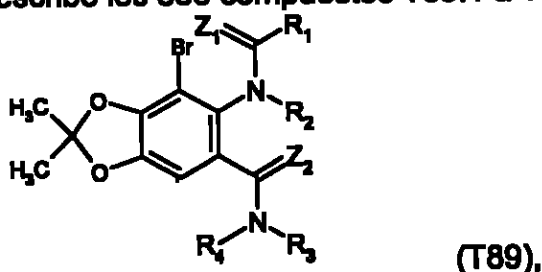
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 88: Esta tabla describe los 338 compuestos T88.1 a T88.338 de la fórmula



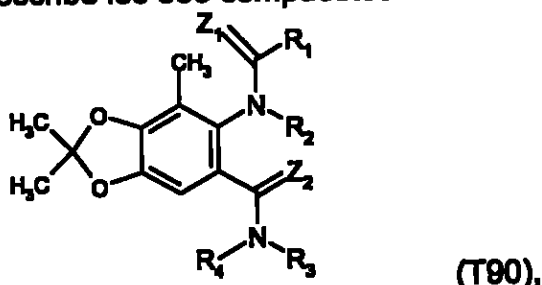
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 89: Esta tabla describe los 338 compuestos T89.1 a T89.338 de la fórmula



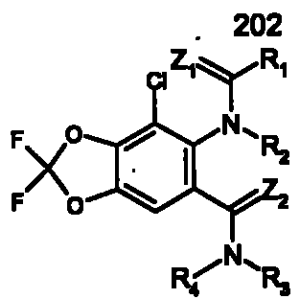
en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 90: Esta tabla describe los 338 compuestos T90.1 a T90.338 de la fórmula



en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z_1 , Z_2 , R_1 , R_2 , R_3 and R_4 tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Tabla 91: Esta tabla describe los 338 compuestos T91.1 a T91.338 de la fórmula



(T91),

en la cual, para cada uno de estos 338 compuestos específicos, cada una de las variables Z₁, Z₂, R₁, R₂, R₃ and R₄ tiene el significado específico proporcionado en la línea correspondiente, seleccionado apropiadamente entre las 338 líneas A.1 a A.338, de la Tabla A.

Ejemplos de Formulación (% = porcentaje por peso)

Ejemplo F1: Concentrados de Emulsión	a)	b)	c)
Ingrediente Activo	25 %	40 %	50 %
Dodecilbenzenosulfonato de calcio	5 %	8 %	6 %
Polietilenglicoléter de aceite de ricino (36 mol de OE)	5 %	-	-
Eter de Tributilfenoxipolietilenglicol (30 mol de OE)	-	12 %	4 %
Ciclohexanono	-	15 %	20 %
Mezcla de xileno	65 %	25 %	20 %

Las emulsiones de cualquier concentración deseada se pueden preparar a partir de tales concentrados mediante dilución con agua.

Ejemplo F2: Soluciones	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	80 %	10 %	5 %	95 %
monometiléter de etilenglycol	20 %	-	-	-
Polietilenglicol MW 400	-	70 %	-	-
N-Metilpirrolid-2-ona	-	20 %	-	-
Aceite de coco epoxidado	-	-	1 %	5 %
Éter de petróleo (rango de ebullición: 160-190°)	-	-	-	94 %

Las soluciones son adecuadas para uso en la forma de microgotas.

Ejemplo F3: Gránulos	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	10 %	8 %	21 %
Caolín	94 %	-	79 %	54 %
Sílice altamente dispersada	1 %	-	13 %	7 %
Attapulguita	-	90 %	-	18 %

El Ingrediente activo se disolvió en diclorometano, la solución es pulverizada sobre el o los portadores , y el solvente es subsecuentemente evaporado in vacuo.

Ejemplo F4: Polvos	a)	b)
---------------------------	----	----

	203	
Ingrediente activo	2 %	5 %
Silice altamente dispersada	1 %	5 %
Talco	97 %	-
Caolín	-	90 %

Los polvos listos para usar son obtenidos mezclando intimamente los portadores y los ingredientes activos.

<u>Ejemplo F5: Polvos humectables</u>	a)	b)	c)
Ingrediente activo	25 %	50 %	75 %
Lignosulfonato sódico	5 %	5 %	-
Laurilsulfato sódico	3 %	-	5 %
Dilsobutilnaftalensulfonato sódico	-	6 %	10 %
Octilfenoxipolyetilenglicol	-	2 %	-
Éter (7-8 moles deOE)	-	2 %	-
Silice altamente dispersada	5 %	10 %	10 %
Caolín	62 %	27 %	-

El ingrediente activo es mezclado con los aditivos y la mezcla es molida vigorosamente en un molino adecuado. Esto da polvos humectables, los cuales pueden ser diluidos con agua para proporcionar suspensiones de cualquier concentración deseada.

<u>Ejemplo F6: Gránulos de extrusora</u>	
Ingrediente activo	10 %
Lignosulfonato sódico	2 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Caolín	87 %

El ingrediente activo es mezclado con los aditivos y la mezcla es molida, humedecida con agua, extruida, granulada y secada en una corriente de aire.

<u>Ejemplo F7: Gránulos revestidos</u>	
Ingrediente activo	3 %
Polietilenglicol (PM 200)	3 %
Caolín	94 %

En una mezcladora, el ingrediente activo finamente molido es aplicado uniformemente al caolín, el cual ha sido humedecido con el polietilenglicol. Esto proporciona gránulos revestidos libres de polvo.

<u>Ejemplo F8: Concentrado en Suspensión</u>	
Ingrediente activo	40 %
Etilenglicol	10 %
Nonilfenoxipolietilenglicoléter (15 mol de OE)	6 %

Lignosulfonato sódico	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Solución de formaldehído acuoso al 37%	0,2 %
Aceite de silicona (emulsión acuosa al 75%)	0,8 %
Agua	32 %

El ingrediente activo finamente molido es mezclado íntimamente con los aditivos. Las suspensiones de cualquier concentración deseada pueden prepararse a partir del concentrado en suspensión así resultante mediante dilución con agua.

Ejemplos Biológicos (% = por ciento en peso, a menos que se indique lo contrario)

Ejemplo B1: Actividad contra Aphis craccivora

Plántulas de alverjas son infectadas con *Aphis craccivora*, posteriormente pulverizadas con una mezcla para pulverizar que comprende 400 ppm de ingrediente activo y luego se incuban a 20°C. 3 y 6 días después, el porcentaje de reducción en la población (% de actividad) se determina comparando la cantidad de áfidos muertos entre las plantas tratadas y no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad.

Ejemplo B2: Actividad contra Diabrotica balteata

Se pulverizan plántulas de maíz con una mezcla para pulverizar de emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo y, después de que el revestimiento para pulverizar se ha secado, se pobló con 10 larvas (2da crisálida) de *Diabrotica balteata* y se introdujeron en un recipiente de plástico. Seis días después, se determina el porcentaje de reducción en la población (% de actividad) comparando la cantidad de larvas muertas entre las plantas tratadas y las no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1, T1.3, T7.1 y T7.3 tienen una actividad de más del 80%.

Ejemplo B3: Actividad contra Heliothis virescens (aplicación foliar)

Se pulverizan plantas de soja jóvenes con una mezcla para pulverizar de emulsión acuosa que comprende 400 ppm de Ingrediente activo y, después de que el revestimiento para pulverizar se ha secado, se pobló con 10 orugas (1ra crisálida) de *Heliothis virescens* y se introdujeron en un recipiente de plástico. Seis días más tarde, se determinan el porcentaje de reducción en la población y en el daño por alimentación (% de actividad) comparando la cantidad de orugas muertas y el daño por alimentación entre las plantas tratadas y las no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T79.1, T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 y T9.2 tienen una actividad de más del 80 %.

Ejemplo B4: Actividad contra *Heliothis virescens* (aplicación a los huevos)

Se pulverizan huevos de *Heliothis virescens*, los cuales han sido depositados sobre algodón, con una mezcla para pulverizar de emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Después de 8 días, se evalúan el porcentaje del Índice de Incubación de los huevos y la tasa de supervivencia de las orugas (% de actividad), en comparación con las tandas control no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 to 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T79.1, T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 y T9.2 tienen una actividad de más del 80%.

Ejemplo B5: Actividad contra *Myzus persicae* (aplicación foliar)

Se infectan plántulas de alverjas con *Myzus persicae*, posteriormente se pulverizan con una mezcla para pulverizar que comprende 400 ppm de ingrediente activo y luego se incuban a 20°. 3 y 6 días más tarde, se determina el porcentaje de reducción en la población (% de actividad) comparando la cantidad de áfidos muertos entre las plantas tratadas y no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 to 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1 y T7.1 tienen una actividad de más del 80%.

Ejemplo B6: Actividad contra Myzus persicae (aplicación sistémica)

Se infectan las plántulas de alverjas con *Myzus persicae*, y las raíces son posteriormente colocadas en una mezcla para pulverizar que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Luego, las plántulas son incubadas a 20°. 3 y 6 días más tarde, se determina el porcentaje de reducción en la población (% de actividad) comparando la cantidad de áfidos muertos entre las plantas tratadas y las no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad.

Ejemplo B7: Actividad contra Plutella xylostella

Se pulverizan plantas de col jóvenes con una mezcla para pulverizar de emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo y, luego de haberse secado el revestimiento de la pulverización, se pobló con 10 orugas (3ra crisálida) de *Plutella xylostella* y se introducen en un recipiente de plástico. 3 días más tarde, se determinan el porcentaje de reducción en la población y en el daño por alimentación (% de actividad) comparando la cantidad de orugas muertas y el daño por alimentación entre las plantas tratadas y las no tratadas.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T22.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T78.1, T79.1, T81.1, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 y T9.2 tienen una actividad de más del 80%.

Ejemplo B8: Actividad contra Spodoptera littoralis

Se pulverizan plantas de soja jóvenes con una mezcla para pulverizar en emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo y, después, de

se

haberse secado el revestimiento de la pulverización, se poblaron con 10 orugas (1ra crisálida) de *Spodoptera littoralis* y se introdujeron en un recipiente de plástico. 3 días más tarde, se determinaron el porcentaje de reducción en la población y en el daño por alimentación (% de actividad) comparando la cantidad de orugas muertas y el daño por alimentación entre las plantas tratadas y las no tratadas.

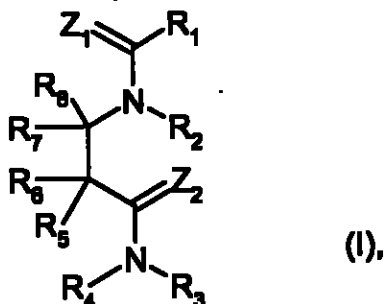
En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas 1 a 85 muestran buena actividad. En particular, los compuestos T1.1, T1.3, T2.1, T7.1, T7.3, T75.1, T75.3, T76.1, T76.3, T2.2, T8.1, T5.1, T5.3, T20.1, T20.3, T9.1, T9.3 y T9.2 tienen una actividad de más del 80%.

(1ra
lias
..
or
..
..
..
..

T75
T76
.
..
..
..
..

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula



en la cual

Z_1 es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

Z_2 es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

R_1 es un grupo arilo o heteroarilo, el cual no está sustituido o está sustituido;

R_2 es hidrógeno o un sustituyente orgánico;

R_3 es hidrógeno o un sustituyente orgánico;

R_4 es hidrógeno o un sustituyente orgánico;

o R_3 y R_4 , tomados en forma conjunta forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están unidos, un anillo, el cual no está sustituido o está sustituido;

R_5 es hidrógeno o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, junto con R_6 o con un sustituyente monovalente unido a ese átomo de R_6 , por medio del cual R_6 está conectado directamente con el átomo de carbono, que se muestra en la fórmula I, el cual porta R_5 , un enlace adicional;

R_6 y R_7 , tomados en forma conjunta forman, junto con los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a los cuales están unidos, un sistema de anillos bicíclico, dicho sistema de anillos es carbocíclico o heterocíclico, dicho sistema de anillo está sustituido, de la manera que se muestra en la fórmula I, con los cuatro sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$, $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$, R_5 y R_6 , y donde el sistema de anillos está opcional y adicionalmente sustituido;

y R_8 es hidrógeno; o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, tomado juntamente con R_5 o con un sustituyente monovalente unido a ese átomo de R_7 , por medio del cual R_7 está conectado directamente con el átomo de carbono, mostrado en la fórmula I, el cual porta R_8 , un enlace adicional,

o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma de sal.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual Z_1 es un átomo de oxígeno, o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual Z_2 es un átomo de oxígeno, o, cuando fuese apropiado, un tautómero del mismo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual R_1 es un grupo fenilo, piridilo o pirazolilo, el cual no está sustituido o está sustituido, o donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 de la fórmula I, en la cual R_1 es un grupo pirazol-5-ilo, el cual está sustituido en la posición 3 con halógeno, halo-alquilo- C_1-C_6 o halo-alcoxi- C_1-C_6 y en la posición 1 con un grupo pirid-2-ilo, el cual está sustituido en la posición 3 con cloro o bromo, o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual R_2 es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 , o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual R_3 es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 , o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual R_4 es alquilo- C_1-C_6 , o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual R_5 y R_6 , tomados en forma conjunta, son un enlace, o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I, en la cual los dos átomos de carbono, que se muestran en la fórmula I, a los cuales R_6 y R_7 están unidos, son dos miembros en el anillo de un anillo aromático, o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo.

11. Una composición pesticida, la cual comprende por lo menos un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula I o, donde fuese apropiado, un tautómero del mismo, en cada caso en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, como ingrediente activo y por lo menos un auxiliar.

12. Una composición de acuerdo con la reivindicación 11 para controlar insectos o representantes del orden Acarina.

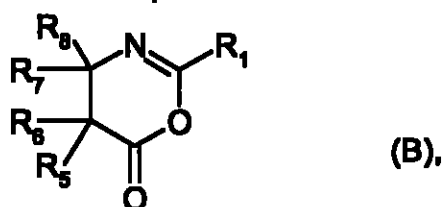
13. Un método para controlar pestes, el cual comprende aplicar una composición de acuerdo con la reivindicación 11 a las pestes o su medio ambiente.

14. Un método de acuerdo con la reivindicación 13 para controlar insectos o representantes del orden Acarina.

15. Un método de acuerdo con la reivindicación 13 para la protección de material de propagación de plantas del ataque por pestes, el cual comprende tratar el material de propagación o el sitio donde el material de propagación es plantado.

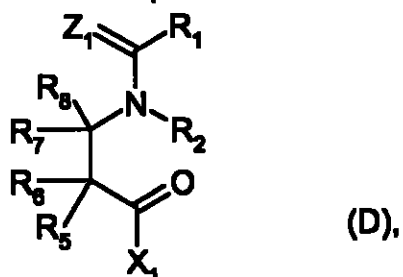
16. El material de propagación de plantas tratado de conformidad con el método descrito en la reivindicación 15.

17. Un compuesto de la fórmula B



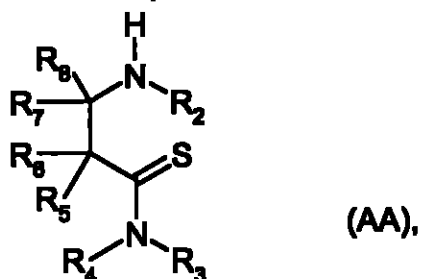
en la cual R_1 , R_5 , R_6 , R_7 y R_8 tienen los significados proporcionados en la reivindicación 1 para la fórmula I, o, donde fuese apropiado, su tautómero, en cada caso en forma libre o en forma de sal.

18. Un compuesto de la fórmula D



en la cual Z_1 , R_1 , R_2 , R_5 , R_6 , R_7 y R_8 tienen los significados proporcionados en la reivindicación 1 para la fórmula I; y R es OH, alcoxi- C_1 - C_4 o Cl, o, donde fuese apropiado, su tautómero, en cada caso en forma libre o en forma de sal.

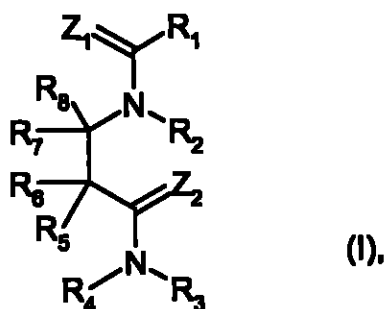
19. Un compuesto de la fórmula AA



en la cual R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 y R_8 tienen los significados proporcionados en la reivindicación 1 para la fórmula I, o, donde fuese apropiado, su tautómero, en cada caso en forma libre o en forma de sal.

Resumen

Los compuestos de la fórmula



en la cual

Z_1 es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

Z_2 es un átomo de oxígeno; o un átomo de azufre;

R_1 es un grupo arilo o heteroarilo, el cual está no sustituido o sustituido;

R_2 es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

R_3 es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

R_4 es hidrógeno; o un sustituyente orgánico;

o R_3 y R_4 , tomados en forma conjunta, forman, junto con el átomo de nitrógeno, al cual están unidos, un anillo, el cual está no sustituido o sustituido;

R_5 es hidrógeno; o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, junto con R_6 o con un sustituyente monovalente unido a ese átomo de R_6 , por medio del cual R_6 está conectado directamente con el átomo de carbono, que se muestra en la fórmula I, el cual porta R_5 , un enlace adicional;

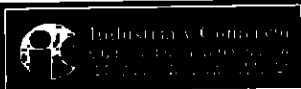
R_6 y R_7 , tomados en forma conjunta, forman, junto con los dos átomos de carbono, mostrados en la fórmula I, a los cuales están unidos, un sistema de anillos bicíclico, dicho sistema de anillos es carbocíclico o heterocíclico, dicho sistema de anillo está sustituido, de la manera que se muestra en la fórmula I, con los cuatro sustituyentes $-N(R_2)-C(=Z_1)-R_1$, $-C(=Z_2)-N(R_3)-R_4$, R_5 y R_6 , y sistema de anillos el cual está opcionalmente adicionalmente sustituido;

y R_8 es hidrógeno; o un grupo alquilo no sustituido o sustituido; o forma, tomado juntamente con R_5 o con un sustituyente monovalente unido a ese átomo

de R_7 , por medio del cual R_7 está conectado directamente con el átomo de carbono, mostrado en la fórmula I, el cual porta R_8 , un enlace adicional,

y, donde fuese apropiado, sus tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden utilizarse como ingredientes activos agroquímicos y se pueden preparar de manera conocida per se.

Refilio Edilio 432, 433, 434 y 436
Tajetos
Extiatoros



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Bogotá, Colombia

432

Expediente No		No de Folio
06087361		
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	1
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	
10	OTROS:	
Observaciones: contiene 1 disquete		

438
433

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-087361- -00000-0000
Fec: 2008-08-01 14:41:28 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Evs: 379 FASENACIONALII
Act 411 PRESENTACION
Folios: 437
Comercio
INDENCIA

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

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 presenta la solicitud ☒
- ◆ Descripción de la invención ☒
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☒

COMPLETA ☐ INCOMPLETA ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

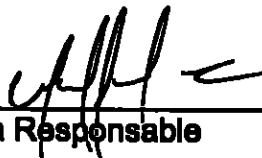
- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial ☐
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☐
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☐

COMPLETA ☐ INCOMPLETA ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado ☐
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☐
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☐

COMPLETA ☐ INCOMPLETA ☐


Firma Responsable

Fecha 01 de Sep

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia