



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

- PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL -

21. EXPEDIENTE No.

06-119543

54. TÍTULO

DERIVADOS DE PIPERAZINA Y SU USO EN EL CONTROL DE PESTICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO

Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA

74. APODERADO

DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

22. BOGOTÁ, D. C.,

27 NOV. 2006

Certificación
F.N. 28-12-2006

(FORMA P-10j)

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

Dirección: Schwarzwaldallee 215, CH-4058

Basilea - SUIZA

Nacionalidad o Domicilio: Basilea - SUIZA

Lugar de Constitución: Basilea - SUIZA

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: 810 7420 Fax: 810 0706

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

39779.854 TPA 70.819

④

INVENTOR (ES) (72)

Nombre: LOUIS-PIERRE MOLLEYRES, FREDRIK CEDERBAUM, JEROME CASSAYRE,
PETER MAIENFISCH, THOMAS PITTEINA, CAMILLA CORSIDirección: Syngenta Crop Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215,
CH-4058 Basilea, SUIZA

Nacionalidad o Domicilio: SUIZA, SUECA, FRANCESA, SUIZA, AUSTRIACA, ITALIANA

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No.

PCT/IB2006/001468

Fecha:

12/05/2005

Publicación Internacional No.

WO 2006/116146

Fecha:

06/12/2006

⑥

Título (84)

DERIVADOS DE PIPERAZINA Y SU USO EN EL CONTROL DE PESTICIDAS

⑦

Clasificación Internacional (51)

A01N 43/60, 47/30, 47/20, C07D 401/00, 295/00

⑧

Prioridad

SI ☒NO ☐

(33) País de Origen

GB

(32) Fecha

28/05/2004

(31) Número de Solicitud

0412072.1

⑨

Comprobante de pago No.

08-85.519

Fecha

Noviembre 3 de 2006

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

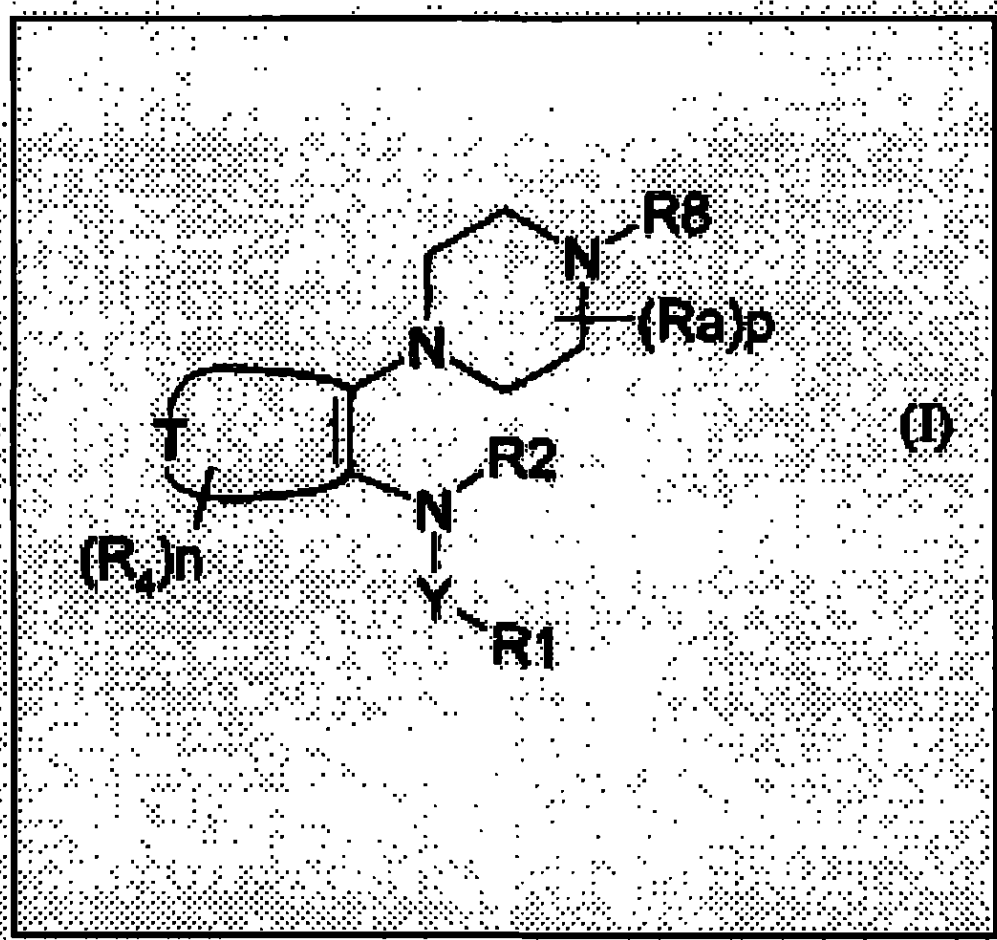
10

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 Propietario, Tarjeta Temática y Extracto para la Publicación y disquet con el extracto final para la publicación.

11

FIGURA CARACTERISTICA:



12

Solicito la concesión de la patente.

NOMBRE: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA: *Margarita Castellanos Abondano*

C.C. No. 38.779.854 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

27 NOV. 2006

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
 Rad: 08-119543-00000-0000
 Psc: 2008-11-27 14:17:20 Usp. 2008 NOV 27 14:17:20
 TEL 11 PATENTE IYB
 EVO: 370 FASE NACIONAL II
 Act 411 PRESENTACION Folio 289

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 05,519
 FECHA : NOVIEMBRE 3 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	50962544	03/11/2006	5,933,000.00

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

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50003-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	463,000.00

SOM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E. S. D.

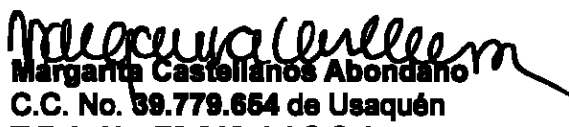
Ref.: PODER conferido por la sociedad SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie 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:

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C.C. No. 39.773.330 de Usaquén
T.P.A. No. 68.236 del C.S.J.
Calle 84 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 84 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
PBX: 6107420

Bogotá, D.C.
XCA/MCA/gcb/8085-FNPCT

COLOMBIA

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 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.

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 página siguiente)

(Notary shall execute on the other side)

(Se requiere legalización consular)

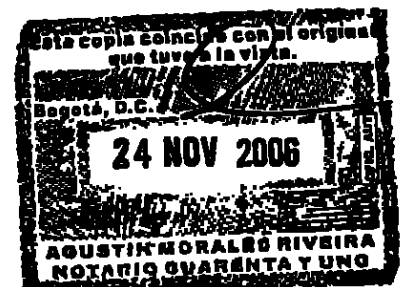
(Consular legalization required)

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 06 - e-mail: avcastan@empresal.net.co

XC/ten



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

Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
EXPERIMENTAL
Identificado con C.C. **372.173.313**
expedida en: **BOGOTÁ** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **58256** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **EXPERIMENTAL** y declaró que la firma puesta en éste escrito es suya.

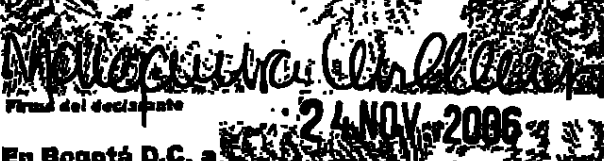

Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **24 NOV 2006**
AUTORIZÓ ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

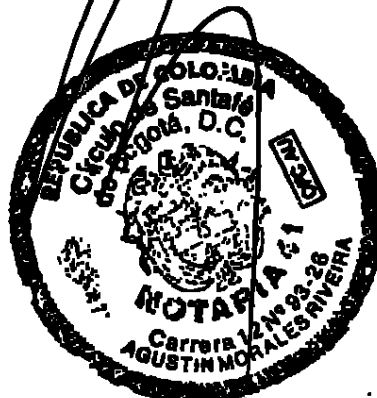


**AUTENTICACIÓN DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:
EXPERIMENTAL
Identificado con C.C. **372.173.313**
expedida en: **BOGOTÁ** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **58256** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **EXPERIMENTAL** y declaró que la firma puesta en éste escrito es suya.


Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **24 NOV 2006**
AUTORIZÓ ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



COLOMBIA

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:

- a) That Syngenta Participations AG is a corporation (Company legally constituted and in existence in accordance with the laws of Basel, Switzerland
- b) That the domicile of said Corporation/Company is Basel, Switzerland
- c) 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.
- d) 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

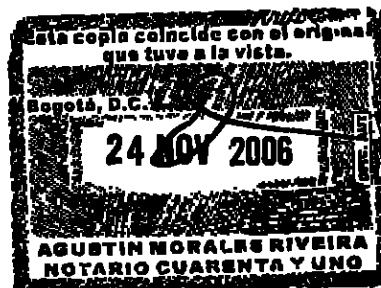
(Notary Public) *Laneisha C. Hayes*
*Documents must be identified with date and origin
3/24/04 - Research Triangle Park, North Carolina 27709 - Syngenta Biotech, Inc.

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 63-06 - P.O. Box 6348 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 619 74 20 / 60 / 60 - Fax (571) 619 07 06 - e-mail: avcaste@impact.net.co

XCen





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

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

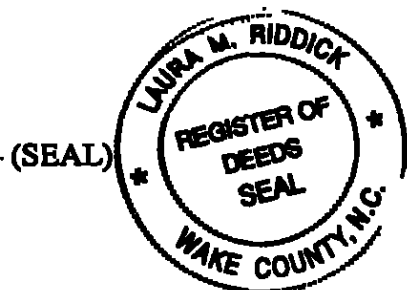
STATE OF NORTH CAROLINA

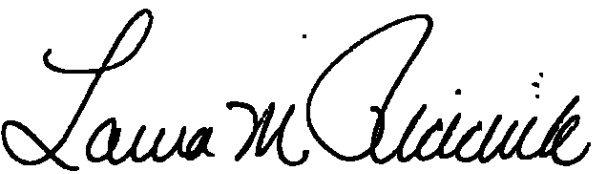
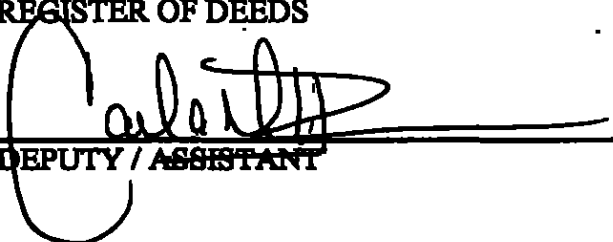
WAKE COUNTY

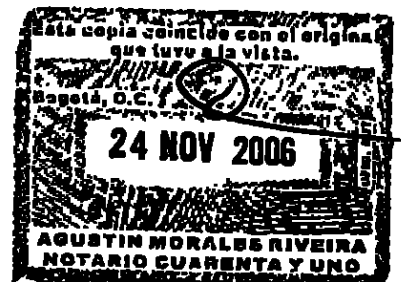
**CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT
NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY
AT TIME OF SIGNATURE**

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.




REGISTER OF DEEDS

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

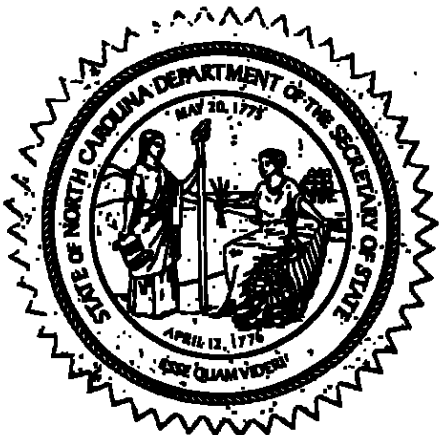
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004

7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8117

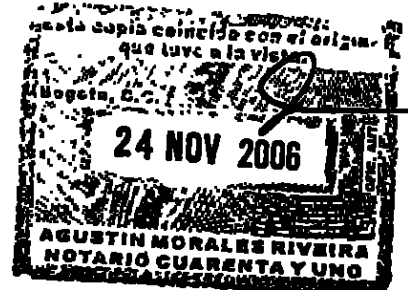
8. No. _____

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 dars plena fe y crédito a

sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia

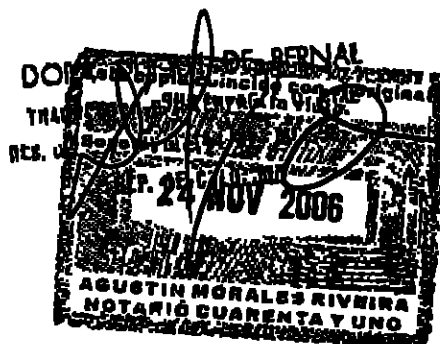
letra.

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)

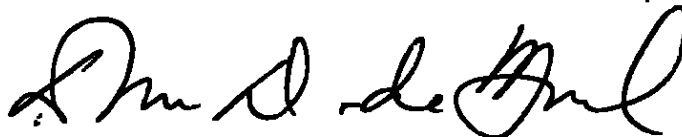
1. País: Estados Unidos de América
 2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN
 3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras
 4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras
- Condado de Wake, Carolina del Norte

CERTIFICADO

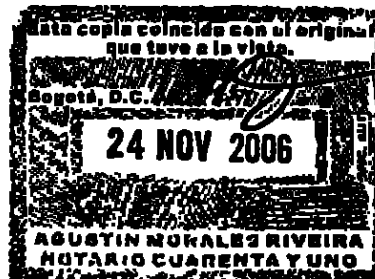
5. En Raleigh. Carolina del Norte
6. el día 1 de Abril de 2004
7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
8. No. 8117
9. Sello: (sello en oblea ocre)
10. Firma
(fdo) Rodney S. Maddox

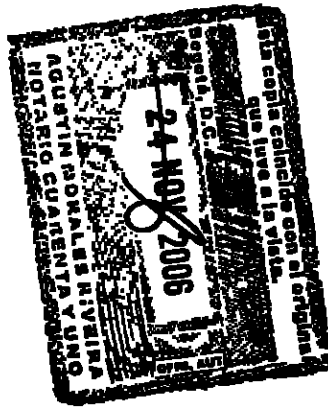
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004



DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
REG. 02753/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA





MUNICIPIO DE
RELACIONES

319992

Dora Duque
CUYA FIRMA AUTORIZA EL
DOCUMENTO DE LA PENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

19 SE
24 NOV 2006
2:42
JUEVES

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
8 December 2005 (08.12.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/115146 A1

(51) International Patent Classification⁷: A01N 43/60,
47/30, 47/20, C07D 401/00, 295/00

Crop Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee
215, CH-4058 Basel (CH).

(21) International Application Number:
PCT/IB2005/001468

(74) Agents: WATERMAN, John, Richard et al.; Intellectual
Property Department, Syngenta Limited, P O Box 3538,
Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell,
Berkshire RG42 6YA (GB).

(22) International Filing Date: 12 May 2005 (12.05.2005)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0412072.1 28 May 2004 (28.05.2004) GB

(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, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, 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.

(71) Applicant (for all designated States except US): SYN-
GENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH]; Schwarzwald-
allee 215, CH-4058 Basel (CH).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): CASSAYRE,
Jerome [FR/CH]; Syngenta Crop Protection AG, Werk
Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).
MOLLEYRES, Louis-Pierre [CH/CH]; Syngenta
Crop Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee
215, CH-4058 Basel (CH). MAIENFISCH, Peter
[CH/CH]; Syngenta Crop Protection AG, Werk Rosental,
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). CEDER-
BAUM, Fredrik [SE/CH]; Syngenta Crop Protection AG,
Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel
(CH). CORSI, Camilla [IT/CH]; Syngenta Crop Protec-
tion AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058
Basel (CH). PITTERNA, Thomas [AT/CH]; Syngenta

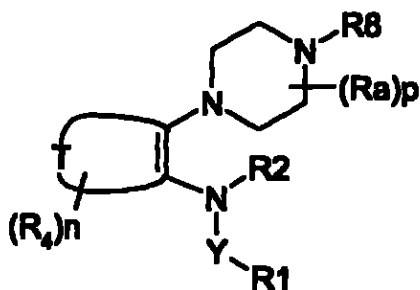
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT,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

— with international search report

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

(54) Title: PIPERAZIN DERIVATIVES AND THEIR USE IN CONTROLLING PESTS



(I)

(57) Abstract: The use of a compound of formula (I) wherein Y
is a single bond, C=O, C=S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2; the ring
is a 6-membered aromatic or is a 5 or 6 membered heteroaromatic
ring; Ra, R¹, R², R⁴ and R⁸ are specified organic groups; n and
p are independently 0-4; or salts or N-oxides thereof or composi-
tions containing them in controlling insects, acarines, nematodes
or molluscs. Novel compounds are also provided.

WO 2005/115146 A1

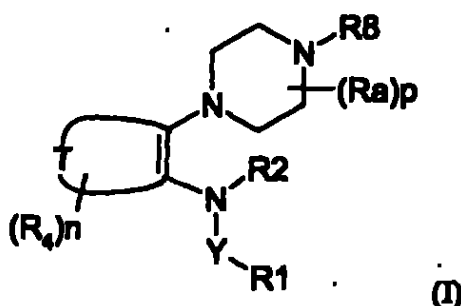
PIPERAZIN DERIVATIVES AND THEIR USE IN CONTROLLING PESTS

The present invention relates to piperazine derivatives, to processes for preparing them, to insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising them and to methods of using them to combat and control insect, acarine, mollusc and nematode pests.

Piperazine derivatives with antiprotazoal properties are disclosed in for example in US331845 and EP103464 discloses pyrimidinyl piperazine compounds with antibacterial properties.

It has now surprisingly been found that certain piperazines have insecticidal properties.

The present invention therefore provides a method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I):



Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2;

the ring



is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

R¹ is hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted alkylcarbonyl, aminocarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heterocycloxy, cyano,

optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted cycloalkenyl, formyl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkylthio, NO or $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ where R^{13} and R^{14} are independently hydrogen, COR^{15} , optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl or R^{13} and R^{14} together with the N atom to which they are attached form a group $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^{16})-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ or R^{13} and R^{14} together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C_{1-6} alkyl groups; R^{15} is H, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy or $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$; R^{16} , R^{17} and R^{18} are each independently H or lower alkyl; R^{19} and R^{20} are independently optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl;

R^2 is H, hydroxy, optionally substituted alkoxy or optionally substituted alkyl; or R^1 and R^2 together with the groups Y and N form a 5-or 6-membered heterocyclic ring which may optionally contain one further heteroatom selected from O, N or S and which may be optionally substituted by C_{1-4} alkyl, C_{1-4} haloalkyl or halogen;

each R^4 is independently halogen, nitro, cyano, optionally substituted C_{1-8} alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C_{3-7} cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio or $\text{R}^{21}\text{R}^{22}\text{N}$ where R^{21} and R^{22} are, independently, hydrogen, C_{1-8} alkyl, C_{3-7} cycloalkyl, C_{3-6} alkenyl, C_{3-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} haloalkyl, C_{1-6} alkoxy(C_{1-6})alkyl, C_{1-6} alkoxycarbonyl or R^{21} and R^{22} together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C_{1-6} alkyl groups, or 2 adjacent groups R^4 together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6, or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen; n is 0, 1, 2, 3 or 4;

R^6 is optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl or optionally substituted alkenylcarbonyl;

5 each R_a is independently halogen, hydroxy, cyano, optionally substituted C_{1-8} alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C_{3-7} cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio, optionally substituted arylthio or $R^{23}R^{24}N$ where R^{23} and R^{24} are, independently, hydrogen, C_{1-8} alkyl, C_{3-7} cycloalkyl, C_{3-6} alkenyl, C_{3-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} haloalkyl, C_{1-6} alkoxy(C_{1-6})alkyl, C_{1-6} alkoxycarbonyl or R^{23} and R^{24} together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C_{1-6} alkyl groups, or two R_a groups attached to the same carbon atom are $=O$, $=S$, $=NR_b$, $=CR_cR_d$ where R_b , R_c and R_d are independently H or optionally substituted alkyl; p is 0, 1, 2, 3 or 4 or salts or N-oxides thereof.

20 The compounds of formula (I) may exist in different geometric or optical isomers or tautomeric forms. This invention covers all such isomers and tautomers and mixtures thereof in all proportions as well as isotopic forms such as deuterated compounds.

Each alkyl moiety either alone or as part of a larger group (such as alkoxy, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl) is a straight or branched chain and is, for example, methyl, ethyl, n-propyl, n-butyl, n-pentyl, n-hexyl, isopropyl, n-butyl, sec-butyl, iso-butyl, tert-butyl or neo-pentyl. The alkyl groups are suitably C_1 to C_{12} alkyl groups, but are preferably C_1 - C_{10} , more preferably C_1 - C_8 , even more preferably preferably C_1 - C_6 and most preferably C_1 - C_4 alkyl groups.

When present, the optional substituents on an alkyl moiety (alone or as part of a larger group such as alkoxy, alkoxycarbonyl, alkylcarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl) include one or more of halogen, nitro, cyano, NCS-, C_{3-7} cycloalkyl (itself optionally substituted with C_{1-6} alkyl or halogen), C_{3-7} cycloalkenyl (itself optionally

substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), hydroxy, C₁₋₁₀ alkoxy, C₁₋₁₀ alkoxy(C₁₋₁₀)alkoxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyl(C₁₋₆)alkoxy, C₁₋₆ alkoxycarbonyl(C₁₋₁₀)alkoxy, C₁₋₁₀ haloalkoxy, aryl(C₁₋₄)alkoxy (where the aryl group is optionally substituted), C₃₋₇ cycloalkyloxy (where the cycloalkyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), C₂₋₁₀ alkenyloxy, C₂₋₁₀ alkynyloxy, SH, C₁₋₁₀ alkylthio, C₁₋₁₀ haloalkylthio, aryl(C₁₋₄)alkylthio (where the aryl group is optionally substituted), C₃₋₇ cycloalkylthio (where the cycloalkyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), tri(C₁₋₄)alkylsilyl(C₁₋₆)alkylthio, arylthio (where the aryl group is optionally substituted), C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, arylsulfonyl (where the aryl group may be optionally substituted), tri(C₁₋₄)alkylsilyl, aryldi(C₁₋₄)alkylsilyl, (C₁₋₄)alkyldiarylsilyl, triarylsilyl, C₁₋₁₀ alkylcarbonyl, HO₂C, C₁₋₁₀ alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl, di(C₁₋₆ alkyl)aminocarbonyl, N-(C₁₋₃ alkyl)-N-(C₁₋₃ alkoxy)aminocarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonyloxy, arylcarbonyloxy (where the aryl group is optionally substituted), di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyloxy, oximes such as =NOalkyl, =NOhaloalkyl and =NOaryl (itself optionally substituted), aryl (itself optionally substituted), heteroaryl (itself optionally substituted), heterocyclyl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), aryloxy (where the aryl group is optionally substituted), heteroaryloxy, (where the heteroaryl group is optionally substituted), heterocyclyloxy (where the heterocyclyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), amino, C₁₋₆ alkylamino, di(C₁₋₆)alkylamino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, N-(C₁₋₆)alkylcarbonyl-N-(C₁₋₆)alkylamino, C₂₋₆ alkenylcarbonyl, C₂₋₆ alkynylcarbonyl, C₃₋₆ alkenyloxycarbonyl, C₃₋₆ alkynyloxycarbonyl, aryloxycarbonyl (where the aryl group is optionally substituted) and arylcarbonyl (where the aryl group is optionally substituted).

Alkenyl and alkynyl moieties can be in the form of straight or branched chains, and the alkenyl moieties, where appropriate, can be of either the (E)- or (Z)-configuration. Examples are vinyl, allyl and propargyl.

When present, the optional substituents on alkenyl or alkynyl include those optional substituents given above for an alkyl moiety.

In the context of this specification acyl is optionally substituted C₁₋₆ alkylcarbonyl (for example acetyl), optionally substituted C₂₋₆ alkenylcarbonyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynylcarbonyl, optionally substituted arylcarbonyl (for example benzoyl) or optionally substituted heteroarylcarbonyl.

Halogen is fluorine, chlorine, bromine or iodine.

Haloalkyl groups are alkyl groups which are substituted with one or more of the same or different halogen atoms and are, for example, CF_3 , CF_2Cl , CF_3CH_2 or CHF_2CH_2 .

In the context of the present specification the terms "aryl", "aromatic ring" and "aromatic ring system" refer to ring systems which may be mono-, bi- or tricyclic. Examples of such rings include phenyl, naphthalenyl, anthracenyl, indenyl or phenanthrenyl. A preferred aryl group is phenyl. In addition, the terms "heteroaryl", "heteroaromatic ring" or "heteroaromatic ring system" refer to an aromatic ring system containing at least one heteroatom and consisting either of a single ring or of two or more fused rings. Preferably, single rings will contain up to three and bicyclic systems up to four heteroatoms which will preferably be chosen from nitrogen, oxygen and sulphur. Examples of such groups include furyl, thienyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,3-triazolyl, 1,2,4-triazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,2,3-oxadiazolyl, 1,2,4-oxadiazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, 1,2,5-oxadiazolyl, 1,2,3-thiadiazolyl, 1,2,4-thiadiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, 1,2,5-thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, 1,2,3-triazinyl, 1,2,4-triazinyl, 1,3,5-triazinyl, benzofuryl, benzisofuryl, benzothienyl, benzisothienyl, indolyl, isoindolyl, indazolyl, benzothiazolyl, benzisothiazolyl, benzoxazolyl, benzisoxazolyl, benzimidazolyl, 2,1,3-benzoxadiazole quinoliny, isoquinoliny, cinnoliny, phthalazinyl, quinazolinyl, quinoxaliny, naphthyridinyl, benzotriazinyl, purinyl, pteridinyl and indoliziny. Preferred examples of heteroaromatic radicals include pyridyl, pyrimidyl, triazinyl, thienyl, furyl, oxazolyl, isoxazolyl, 2,1,3-benzoxadiazole and thiazolyl.

The terms heterocycle and heterocyclyl refer to a non-aromatic ring containing up to 10 atoms including one or more (preferably one or two) heteroatoms selected from O, S and N. Examples of such rings include 1,3-dioxolane, tetrahydrofuran and morpholine.

When present, the optional substituents on heterocyclyl include C_{1-6} alkyl and C_{1-6} haloalkyl as well as those optional substituents given above for an alkyl moiety.

Cycloalkyl includes cyclopropyl, cyclopentyl and cyclohexyl.

Cycloalkenyl includes cyclopentenyl and cyclohexenyl.

When present, the optional substituents on cycloalkyl or cycloalkenyl include C_{1-3} alkyl as well as those optional substituents given above for an alkyl moiety.

Carbocyclic rings include aryl, cycloalkyl and cycloalkenyl groups.

When present, the optional substituents on aryl or heteroaryl are selected independently, from halogen, nitro, cyano, NCS-, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy-(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆ haloalkenyl, C₂₋₆ alkynyl, C₃₋₇ cycloalkyl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), C₃₋₇ cycloalkenyl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), hydroxy, C₁₋₁₀ alkoxy, C₁₋₁₀ alkoxy(C₁₋₁₀)alkoxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyl(C₁₋₆)alkoxy, C₁₋₆ alkoxycarbonyl(C₁₋₁₀)alkoxy, C₁₋₁₀ haloalkoxy, aryl(C₁₋₄)alkoxy (where the aryl group is optionally substituted with halogen or C₁₋₆ alkyl), C₃₋₇ cycloalkyloxy (where the cycloalkyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), C₂₋₁₀ alkenyloxy, C₂₋₁₀ alkynyloxy, SH, C₁₋₁₀ alkylthio, C₁₋₁₀ haloalkylthio, aryl(C₁₋₄)alkylthio C₃₋₇ cycloalkylthio (where the cycloalkyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), tri(C₁₋₄)-alkylsilyl(C₁₋₆)alkylthio, arylthio, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, arylsulfonyl, tri(C₁₋₄)alkylsilyl, aryl-di(C₁₋₄)-alkylsilyl, (C₁₋₄)alkyldiarylsilyl, triarylsilyl, C₁₋₁₀ alkylcarbonyl, HO₂C, C₁₋₁₀ alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl, di(C₁₋₆ alkyl)-aminocarbonyl, N-(C₁₋₃ alkyl)-N-(C₁₋₃ alkoxy)aminocarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonyloxy, arylcarbonyloxy, di(C₁₋₆)alkylamino-carbonyloxy, aryl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), heteroaryl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), heterocyclyl (itself optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), aryloxy (where the aryl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), heteroaryloxy (where the heteroaryl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), heterocyclyloxy (where the heterocyclyl group is optionally substituted with C₁₋₆ alkyl or halogen), amino, C₁₋₆ alkylamino, di(C₁₋₆)alkylamino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, N-(C₁₋₆)alkylcarbonyl-N-(C₁₋₆)alkylamino, arylcarbonyl, (where the aryl group is itself optionally substituted with halogen or C₁₋₆ alkyl) or two adjacent positions on an aryl or heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen or C₁₋₆ alkyl. Further substituents for aryl or heteroaryl include aryl carbonyl amino (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), (C₁₋₆)alkyloxycarbonylamino (C₁₋₆)alkyloxycarbonyl-N-(C₁₋₆)alkylamino, aryloxycarbonylamino (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), aryloxycarbonyl-N-(C₁₋₆)alkylamino, (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), arylsulphonylamino (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), arylsulphonyl-N-(C₁₋₆)alkylamino (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), aryl-N-(C₁₋₆)alkylamino (where the aryl group is

substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), arylamino (where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), heteroaryl amino (where the heteroaryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), heterocyclylamino (where the heterocyclyl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), aminocarbonylamino, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl amino, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl amino, arylaminocarbonyl amino where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), aryl-N-(C₁₋₆)alkylaminocarbonylamino where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen), C₁₋₆ alkylaminocarbonyl-N-(C₁₋₆)alkyl amino, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl-N-(C₁₋₆)alkyl amino, arylaminocarbonyl-N-(C₁₋₆)alkyl amino where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen) and aryl-N-(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl-N-(C₁₋₆)alkyl amino where the aryl group is substituted by C₁₋₆ alkyl or halogen).

For substituted phenyl moieties, heterocyclyl and heteroaryl groups it is preferred that one or more substituents are independently selected from halogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆ haloalkenyl, C₂₋₆ alkynyl, C₃₋₇ cycloalkyl, nitro, cyano, CO₂H, C₁₋₆ alkylcarbonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, R²⁵R²⁶N or R²⁷R²⁸NC(O); wherein R²⁵, R²⁶, R²⁷ and R²⁸ are, independently, hydrogen or C₁₋₆ alkyl. Further preferred substituents are aryl and heteroaryl groups.

Haloalkenyl groups are alkenyl groups which are substituted with one or more of the same or different halogen atoms.

It is to be understood that dialkylamino substituents include those where the dialkyl groups together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which is optionally substituted by one or two independently selected (C₁₋₆)alkyl groups. When heterocyclic rings are formed by joining two groups on an N atom, the resulting rings are suitably pyrrolidine, piperidine, thiomorpholine and morpholine each of which may be substituted by one or two independently selected (C₁₋₆) alkyl groups.

Preferably the optional substituents on an alkyl moiety include one or more of halogen, nitro, cyano, HO₂C, C₁₋₁₀ alkoxy (itself optionally substituted by C₁₋₁₀ alkoxy), aryl(C₁₋₄)alkoxy, C₁₋₁₀ alkylthio, C₁₋₁₀ alkylcarbonyl, C₁₋₁₀ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl, di(C₁₋₆ alkyl)aminocarbonyl, (C₁₋₆)alkylcarbonyloxy, optionally substituted phenyl, heteroaryl, aryloxy, arylcarbonyloxy, heteroaryloxy, heterocyclyl, heterocycliloxy, C₃₋₇ cycloalkyl (itself optionally substituted with (C₁₋₆)alkyl or halogen), C₃₋

cycloalkyloxy, C₃₋₇ cycloalkenyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, tri(C₁₋₄)alkylsilyl, tri(C₁₋₄)alkylsilyl(C₁₋₆)alkoxy, aryl-di(C₁₋₄)alkylsilyl, (C₁₋₄)alkyldiarylsilyl and triarylsilyl.

Preferably the optional substituents on alkenyl or alkynyl include one or more of halogen, aryl and C₃₋₇ cycloalkyl.

5 A preferred optional substituent for heterocyclyl is C₁₋₆ alkyl.

Preferably the optional substituents for cycloalkyl include halogen, cyano and C₁₋₃ alkyl.

Preferably the optional substituents for cycloalkenyl include C₁₋₃ alkyl, halogen and cyano.

10 Preferred groups for T, Y, R_a, R¹, R², R⁴ and R⁸ in any combination thereof are set out below.

Preferably Y is a single bond, C=O or C=S.

More preferably Y is a single bond or C=O.

Most preferably Y is C=O.

15 Preferably R¹ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ cyanoalkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the

20 heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), aryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be

25 cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkylcarbonylamino(C₁₋₆)alkyl, aryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7

30 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio,

C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heterocyclyloxy (optionally substituted by halo, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), cyano, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₇ cycloalkenyl, heterocyclyl (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ haloalkylthio or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, phenyl (which may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino or C₁₋₄ alkoxycarbonyl), phenyl (C₁₋₆)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen) or heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, phenyloxycarbonylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), amino, C₁₋₆ alkylamino or phenylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino)).

More preferably R¹ is C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or

two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), phenyl(C₁₋₃)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), phenyl (which may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₂₋₆ alkenyl, heterocyclyl (optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ haloalkylthio or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkylcarbonyl, phenylcarbonyl, (where the phenyl is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), phenyl(C₁₋₃)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen) or heteroaryl(C₁₋₃)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen).

Even more preferably R¹ is C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, heteroaryl(C₁₋₃)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl

and where the heteroaryl group is a thiazole, pyridine, pyrimidine, pyrazine or pyridazine ring), heteroaryl (optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl and where the heteroaryl group is a pyridine, pyrimidine, 2,1,3-benzoxadiazole, pyrazine or pyridazine ring), C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylamino, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkylamino or heteroaryl(C₁₋₃)alkylamino (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl and where the heteroaryl group is a thiazole, pyridine, pyrimidine, pyrazine or pyridazine ring).

Most preferably R¹ is pyridyl (optionally substituted by halo, C₁₋₃ alkyl or C₁₋₃ haloalkyl) especially halo-substituted pyridyl.

10 It is preferred that R² is hydrogen, hydroxy, C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl.

More preferably R² is hydrogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl.

Even more preferably R² is hydrogen or C₁₋₄ alkyl.

Yet more preferably R² is independently hydrogen or methyl.

Most preferably R² is hydrogen.

15 Preferably each R⁴ is independently halogen, cyano, C₁₋₈ alkyl, C₁₋₈ haloalkyl, C₁₋₆ cyanoalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkenyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkenyloxy(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkynyloxy(C₁₋₆)alkyl, aryloxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ carboxyalkyl, C₁₋₆ alkylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkenylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkynylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkoxy carbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkenyloxy carbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkynyloxy carbonyl(C₁₋₆)alkyl, aryloxy carbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylthio(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl(C₁₋₆)alkyl, aminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, phenyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino),

20 heteroaryl(C₁₋₄)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heterocyclyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the heterocyclyl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₂₋₆ alkenyl, aminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, phenyl(C₂₋₄)alkenyl, (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino),

30 C₂₋₆ alkynyl, trimethylsilyl(C₂₋₆)alkynyl, aminocarbonyl(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆

substituted by C₁₋₆ alkyl), C₁₋₈ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₃ alkyl or C₁₋₃ haloalkyl), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, cyano, C₁₋₃ alkyl or C₁₋₃ haloalkyl), di(C₁₋₈)alkylamino or 2 adjacent groups R⁴ together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen; n is 0, 1, 2 or 3.

Yet more preferably each R⁴ is independently fluoro, chloro, bromo, cyano, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ cyanoalkyl or C₁₋₃ alkoxy(C₁₋₃)alkyl; n is 0, 1, 2 or 3, preferably 0, 1 or 2.

Most preferably each R⁴ is independently fluoro, chloro, bromo, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl; n is 1, 2 or 3, preferably 1 or 2.

Preferably R⁸ is C₁₋₁₀ alkyl, C₁₋₁₀ haloalkyl, aryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), arylcarbonyl-(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino and the alkyl group may be optionally substituted by aryl), C₂₋₈ alkenyl, C₂₋₈ haloalkenyl, aryl(C₂₋₆)-alkenyl (wherein the aryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), heteroaryl(C₂₋₆)-alkenyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), C₂₋₆ alkynyl, phenyl(C₂₋₆)alkynyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), C₃₋₇ cycloalkyl, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonyl, C₁₋₆ haloalkylcarbonyl or aryl(C₂₋₆)alkenylcarbonyl (wherein the aryl group may be optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), or -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ where z is 1 or 2, R⁵¹ and R⁵² are each independently H, halo or C₁₋₃ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently

H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.

More preferably R⁸ is phenyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), phenyl(C₂₋₆)alkenyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C₂₋₆)alkenyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino) or phenyl(C₂₋₆)alkynyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, or - C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ where z is 1 or 2, R⁵¹ and R⁵² are each independently H, halo or C₁₋₂ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.

Most preferably R⁸ is -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ where z is 1 or 2, preferably 1, R⁵¹ and R⁵² are each independently H or C₁₋₂ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is phenyl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino.

R⁵¹ and R⁵² are preferably hydrogen.

R⁵³ and R⁵⁴ are preferably hydrogen or halogen, especially hydrogen.

R⁵⁵ is preferably phenyl substituted with one to three substituents selected from halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino.

Preferably each R_a is independently halo, cyano, C₁₋₃ alkyl, hydroxy or two R_a groups together with the carbon atom to which they are attached form =O, =S, =NR_b, =CR_cR_d where R_b, R_c and R_d are independently H or optionally substituted alkyl, and p is 0, 1 or 2.

More preferably each R_a is independently fluoro, methyl, hydroxy or two R_a groups together with the carbon atom to which they are attached form a carbonyl group and p is 0, 1 or 2.

Most preferably p is 0.

5 It is preferred that that ring



10 is a 6-membered aromatic ring or is 5 or 6 membered heteroaromatic ring wherein the ring members are each independently CH, S, N, NR^4 , O, or CR^4 provided that at least one ring member is other than CH or CR^4 and that there are no more than one O or S atoms present in the ring.

More preferably the ring



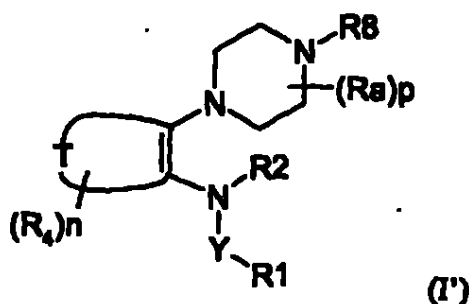
15 is a benzene, pyridine, pyrimidine, pyrazine, pyridazine, triazine, furan, thiophene, pyrrole, imidazole, pyrazole, oxazole, thiazole, isoxazole, isothiazole, [1,2,3]triazole, [1,2,3]oxadiazole or [1,2,3]thiadiazole.

Most preferably the ring



is a benzene or pyridine ring.

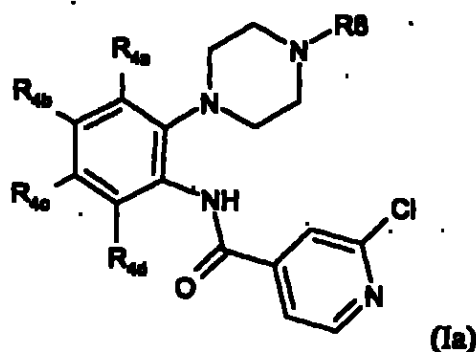
20 Certain compounds of formula (I) are novel and as such form a further aspect of the invention. One group of novel compounds are compounds of formula I'



wherein $R^1, R^2, R^4, R_a, T, Y, n$ and p are as defined in relation to formula I and R^8 is $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ where z is 1 or 2, preferably 1, R^{51} and R^{52} are each independently H or C_{1-2} alkyl, R^{53} and R^{54} are each independently H, halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} haloalkyl and R^{55} is phenyl substituted by halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} haloalkoxy, CN, NO_2 , aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} haloalkoxy, CN, NO_2 , aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino.

The compounds in Tables I to XXV below illustrate the compounds of the invention.

Table I provides 897 compounds of formula Ia



wherein the values of $R^8, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}$ and R^{4d} are given in Table 1.

Table 1

Compound No	R^8	R^{4a}	R^{4b}	R^{4c}	R^{4d}
I-1	4-chlorobenzyl	H	H	H	H
I-2	Cinnamyl	H	H	H	H
I-3	4-chlorocinnamyl	H	H	H	H
I-4	4-fluorocinnamyl	H	H	H	H
I-5	4-bromocinnamyl	H	H	H	H
I-6	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	H	H
I-7	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	H	H
I-8	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	H	H
I-9	4-methoxycinnamyl	H	H	H	H

I-10	4-ethoxycinnamyl	H	H	H	H
I-11	4-cyanocinnamyl	H	H	H	H
I-12	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	H	H
I-13	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	H	H
I-14	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	H	H
I-15	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	H	H
I-16	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	H	H
I-17	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	H	H
I-18	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	H	H
I-19	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	H	H
I-20	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	H	H
I-21	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	H	H
I-22	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	H	H
I-23	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	H	H
I-24	4-chlorobenzyl	H	F	H	H
I-25	Cinnamyl	H	F	H	H
I-26	4-chlorocinnamyl	H	F	H	H
I-27	4-fluorocinnamyl	H	F	H	H
I-28	4-bromocinnamyl	H	F	H	H
I-29	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	H	H
I-30	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	H	H
I-31	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	H	H
I-32	4-methoxycinnamyl	H	F	H	H
I-33	4-ethoxycinnamyl	H	F	H	H
I-34	4-cyanocinnamyl	H	F	H	H
I-35	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	H	H
I-36	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	H	H
I-37	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-	H	F	H	H

	allyl				
I-38	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	H	H
I-39	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	H	H
I-40	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	H	H
I-41	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	H	H
I-42	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	H	H
I-43	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	H
I-44	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	H
I-45	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	H	H
I-46	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	H	H
I-47	4-chlorobenzyl	H	Cl	H	H
I-48	Cinnamyl	H	Cl	H	H
I-49	4-chlorocinnamyl	H	Cl	H	H
I-50	4-fluorocinnamyl	H	Cl	H	H
I-51	4-bromocinnamyl	H	Cl	H	H
I-52	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	H	H
I-53	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	H	H
I-54	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	H	H
I-55	4-methoxycinnamyl	H	Cl	H	H
I-56	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	H	H
I-57	4-cyanocinnamyl	H	Cl	H	H
I-58	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	H	H
I-59	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	H	H
I-60	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	H	H
I-61	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	H	H
I-62	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	H	H
I-63	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	H	H
I-64	4-isopropylexycarbonylamino-	H	Cl	H	H

	cinnamyl				
I-65	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	H	H
I-66	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	H
I-67	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	H
I-68	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	H	H
I-69	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	H	H
I-70	4-chlorobenzyl	H	H	F	H
I-71	Cinnamyl	H	H	F	H
I-72	4-chlorocinnamyl	H	H	F	H
I-73	4-fluorocinnamyl	H	H	F	H
I-74	4-bromocinnamyl	H	H	F	H
I-75	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	F	H
I-76	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	F	H
I-77	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	F	H
I-78	4-methoxycinnamyl	H	H	F	H
I-79	4-ethoxycinnamyl	H	H	F	H
I-80	4-cyanocinnamyl	H	H	F	H
I-81	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	F	H
I-82	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	F	H
I-83	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	F	H
I-84	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	F	H
I-85	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	F	H
I-86	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	F	H
I-87	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	F	H
I-88	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	F	H
I-89	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	H
I-90	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	H

I-91	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	F	H
I-92	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	F	H
I-93	4-chlorobenzyl	H	H	Cl	H
I-94	Cinnamyl	H	H	Cl	H
I-95	4-chlorocinnamyl	H	H	Cl	H
I-96	4-fluorocinnamyl	H	H	Cl	H
I-97	4-bromocinnamyl	H	H	Cl	H
I-98	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	Cl	H
I-99	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	Cl	H
I-100	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	Cl	H
I-101	4-methoxycinnamyl	H	H	Cl	H
I-102	4-ethoxycinnamyl	H	H	Cl	H
I-103	4-cyanocinnamyl	H	H	Cl	H
I-104	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	Cl	H
I-105	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	Cl	H
I-106	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	Cl	H
I-107	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	Cl	H
I-108	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	Cl	H
I-109	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	Cl	H
I-110	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	Cl	H
I-111	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	Cl	H
I-112	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	H
I-113	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	H
I-114	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	Cl	H
I-115	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	Cl	H
I-116	4-chlorobenzyl	Cl	Cl	H	H
I-117	Cinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-118	4-chlorocinnamyl	Cl	Cl	H	H

I-119	4-fluorocinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-120	4-bromocinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-121	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-122	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-123	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-124	4-methoxycinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-125	4-ethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-126	4-cyanocinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-127	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	Cl	H	H
I-128	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	Cl	H	H
I-129	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	Cl	H	H
I-130	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-131	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-132	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	Cl	H	H
I-133	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	Cl	H	H
I-134	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	H	H
I-136	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	H	H
I-137	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	Cl	H	H
I-138	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	Cl	H	H
I-139	4-chlorobenzyl	F	F	H	H
I-140	Cinnamyl	F	F	H	H
I-141	4-chlorocinnamyl	F	F	H	H
I-142	4-fluorocinnamyl	F	F	H	H
I-143	4-bromocinnamyl	F	F	H	H
I-144	4-trifluoromethylcinnamyl	F	F	H	H
I-145	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	F	H	H
I-146	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	F	H	H

I-147	4-methoxycinnamyl	F	F	H	H
I-148	4-ethoxycinnamyl	F	F	H	H
I-149	4-cyanocinnamyl	F	F	H	H
I-150	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	F	H	H
I-151	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	F	H	H
I-152	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro- allyl	F	F	H	H
I-153	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	F	H	H
I-154	3,5-dichloro-cinnamyl	F	F	H	H
I-155	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	F	H	H
I-156	4-isopropoxyloxycarbonylamino- cinnamyl	F	F	H	H
I-157	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	F	H	H
I-158	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2- yl)-allyl	F	F	H	H
I-159	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	H	H
I-160	3-pyridin-4-yl-allyl	F	F	H	H
I-161	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	F	H	H
I-162	4-chlorobenzyl	F	H	F	H
I-163	Cinnamyl	F	H	F	H
I-164	4-chlorocinnamyl	F	H	F	H
I-165	4-fluorocinnamyl	F	H	F	H
I-166	4-bromocinnamyl	F	H	F	H
I-167	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	F	H
I-168	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	F	H
I-169	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	F	H
I-170	4-methoxycinnamyl	F	H	F	H
I-171	4-ethoxycinnamyl	F	H	F	H
I-172	4-cyanocinnamyl	F	H	F	H
I-173	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	F	H
I-174	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	F	H

I-175	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	F	H
I-176	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	F	H
I-177	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	F	H
I-178	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	F	H
I-179	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	F	H
I-180	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	F	H
I-181	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	F	H
I-182	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	F	H
I-183	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	F	H
I-184	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	F	H
I-185	4-chlorobenzyl	F	H	H	F
I-186	Cinnamyl	F	H	H	F
I-187	4-chlorocinnamyl	F	H	H	F
I-188	4-fluorocinnamyl	F	H	H	F
I-189	4-bromocinnamyl	F	H	H	F
I-190	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	H	F
I-191	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	H	F
I-192	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	H	F
I-193	4-methoxycinnamyl	F	H	H	F
I-194	4-ethoxycinnamyl	F	H	H	F
I-195	4-cyanocinnamyl	F	H	H	F
I-196	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	H	F
I-197	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	H	F
I-198	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	H	F
I-199	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	H	F
I-200	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	H	F
I-201	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	H	F

I-202	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	H	F
I-203	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	H	F
I-204	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H	F
I-205	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H	F
I-206	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	H	F
I-207	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	H	F
I-208	4-chlorobenzyl	Cl	H	Cl	H
I-209	Cinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-210	4-chlorocinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-211	4-fluorocinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-212	4-bromocinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-213	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-214	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-215	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-216	4-methoxycinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-217	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-218	4-cyanocinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-219	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	Cl	H
I-220	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	Cl	H
I-221	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	Cl	H
I-222	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-223	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-224	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	Cl	H
I-225	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	Cl	H
I-226	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	Cl	H
I-227	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	Cl	H

I-228	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	Cl	H
I-229	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	Cl	H
I-230	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	Cl	H
I-231	4-chlorobenzyl	Cl	H	H	Cl
I-232	Cinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-233	4-chlorocinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-234	4-fluorocinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-235	4-bromocinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-236	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-237	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-238	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-239	4-methoxycinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-240	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-241	4-cyanocinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-242	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	H	Cl
I-243	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	H	Cl
I-244	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	H	Cl
I-245	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-246	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-247	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	H	Cl
I-248	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	H	Cl
I-249	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	H	Cl
I-250	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H	Cl
I-251	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H	Cl
I-252	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	H	Cl
I-253	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	H	Cl
I-254	4-chlorobenzyl	F	Cl	H	H
I-255	Cinnamyl	F	Cl	H	H

I-256	4-chlorocinnamyl	F	Cl	H	H
I-257	4-fluorocinnamyl	F	Cl	H	H
I-258	4-bromocinnamyl	F	Cl	H	H
I-259	4-trifluoromethylcinnamyl	F	Cl	H	H
I-260	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	Cl	H	H
I-261	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	Cl	H	H
I-262	4-methoxycinnamyl	F	Cl	H	H
I-263	4-ethoxycinnamyl	F	Cl	H	H
I-264	4-cyanocinnamyl	F	Cl	H	H
I-265	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	Cl	H	H
I-266	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	Cl	H	H
I-267	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	Cl	H	H
I-268	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	Cl	H	H
I-269	3,5-dichloro-cinnamyl	F	Cl	H	H
I-270	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	Cl	H	H
I-271	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	Cl	H	H
I-272	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	Cl	H	H
I-273	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	Cl	H	H
I-274	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	Cl	H	H
I-275	3-pyridin-4-yl-allyl	F	Cl	H	H
I-276	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	Cl	H	H
I-277	4-chlorobenzyl	F	H	Cl	H
I-278	Cinnamyl	F	H	Cl	H
I-279	4-chlorocinnamyl	F	H	Cl	H
I-280	4-fluorocinnamyl	F	H	Cl	H
I-281	4-bromocinnamyl	F	H	Cl	H
I-282	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	Cl	H
I-283	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	Cl	H

I-284	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	Cl	H
I-285	4-methoxycinnamyl	F	H	Cl	H
I-286	4-ethoxycinnamyl	F	H	Cl	H
I-287	4-cyanocinnamyl	F	H	Cl	H
I-288	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	Cl	H
I-289	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	Cl	H
I-290	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	Cl	H
I-291	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	Cl	H
I-292	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	Cl	H
I-293	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	Cl	H
I-294	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	Cl	H
I-295	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	Cl	H
I-296	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	Cl	H
I-297	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	Cl	H
I-298	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	Cl	H
I-299	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	Cl	H
I-300	4-chlorobenzyl	F	H	H	Cl
I-301	Cinnamyl	F	H	H	Cl
I-302	4-chlorocinnamyl	F	H	H	Cl
I-303	4-fluorocinnamyl	F	H	H	Cl
I-304	4-bromocinnamyl	F	H	H	Cl
I-305	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	H	Cl
I-306	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	H	Cl
I-307	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	H	Cl
I-308	4-methoxycinnamyl	F	H	H	Cl
I-309	4-ethoxycinnamyl	F	H	H	Cl
I-310	4-cyanocinnamyl	F	H	H	Cl
I-311	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	H	Cl

I-312	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	H	Cl
I-313	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	H	Cl
I-314	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	H	Cl
I-315	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	H	Cl
I-316	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	H	Cl
I-317	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	H	Cl
I-318	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	H	Cl
I-319	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H	Cl
I-320	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H	Cl
I-321	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	H	Cl
I-322	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	H	Cl
I-323	4-chlorobenzyl	Cl	F	H	H
I-324	Cinnamyl	Cl	F	H	H
I-325	4-chlorocinnamyl	Cl	F	H	H
I-326	4-fluorocinnamyl	Cl	F	H	H
I-327	4-bromocinnamyl	Cl	F	H	H
I-328	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	F	H	H
I-329	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	F	H	H
I-330	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	F	H	H
I-331	4-methoxycinnamyl	Cl	F	H	H
I-332	4-ethoxycinnamyl	Cl	F	H	H
I-333	4-cyanocinnamyl	Cl	F	H	H
I-334	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	F	H	H
I-335	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	F	H	H
I-336	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	F	H	H
I-337	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	F	H	H
I-338	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	F	H	H

I-339	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	F	H	H
I-340	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	F	H	H
I-341	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	F	H	H
I-342	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	F	H	H
I-343	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	F	H	H
I-344	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	F	H	H
I-345	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	F	H	H
I-346	4-chlorobenzyl	H	F	Cl	H
I-347	Cinnamyl	H	F	Cl	H
I-348	4-chlorocinnamyl	H	F	Cl	H
I-349	4-fluorocinnamyl	H	F	Cl	H
I-350	4-bromocinnamyl	H	F	Cl	H
I-351	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	Cl	H
I-352	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	Cl	H
I-353	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	Cl	H
I-354	4-methoxycinnamyl	H	F	Cl	H
I-355	4-ethoxycinnamyl	H	F	Cl	H
I-356	4-cyanocinnamyl	H	F	Cl	H
I-357	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	Cl	H
I-358	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	Cl	H
I-359	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	Cl	H
I-360	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	Cl	H
I-361	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	Cl	H
I-362	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	Cl	H
I-363	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	Cl	H
I-364	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	Cl	H
I-365	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-	H	F	Cl	H

	yl)-allyl				
I-366	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	Cl	H
I-367	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	Cl	H
I-368	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	Cl	H
I-369	4-chlorobenzyl	H	F	H	Cl
I-370	Cinnamyl	H	F	H	Cl
I-371	4-chlorocinnamyl	H	F	H	Cl
I-372	4-fluorocinnamyl	H	F	H	Cl
I-373	4-bromocinnamyl	H	F	H	Cl
I-374	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	H	Cl
I-375	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	H	Cl
I-376	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	H	Cl
I-377	4-methoxycinnamyl	H	F	H	Cl
I-378	4-ethoxycinnamyl	H	F	H	Cl
I-379	4-cyanocinnamyl	H	F	H	Cl
I-380	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	H	Cl
I-381	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	H	Cl
I-382	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	H	Cl
I-383	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	H	Cl
I-384	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	H	Cl
I-385	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	H	Cl
I-386	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	H	Cl
I-387	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	H	Cl
I-388	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	Cl
I-389	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	Cl
I-390	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	H	Cl
I-391	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	H	Cl
I-392	4-chlorobenzyl	Cl	H	F	H

I-393	Cinnamyl	Cl	H	F	H
I-394	4-chlorocinnamyl	Cl	H	F	H
I-395	4-fluorocinnamyl	Cl	H	F	H
I-396	4-bromocinnamyl	Cl	H	F	H
I-397	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	F	H
I-398	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	F	H
I-399	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	F	H
I-400	4-methoxycinnamyl	Cl	H	F	H
I-401	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	F	H
I-402	4-cyanocinnamyl	Cl	H	F	H
I-403	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	F	H
I-404	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	F	H
I-405	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	F	H
I-406	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	F	H
I-407	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	F	H
I-408	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	F	H
I-409	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	F	H
I-410	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	F	H
I-411	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	F	H
I-412	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	F	H
I-413	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	F	H
I-414	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	F	H
I-415	4-chlorobenzyl	H	Cl	F	H
I-416	Cinnamyl	H	Cl	F	H
I-417	4-chlorocinnamyl	H	Cl	F	H
I-418	4-fluorocinnamyl	H	Cl	F	H
I-419	4-bromocinnamyl	H	Cl	F	H
I-420	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	F	H

I-421	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	F	H
I-422	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	F	H
I-423	4-methoxycinnamyl	H	Cl	F	H
I-424	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	F	H
I-425	4-cyanocinnamyl	H	Cl	F	H
I-426	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	F	H
I-427	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	F	H
I-428	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	F	H
I-429	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	F	H
I-430	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	F	H
I-431	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	F	H
I-432	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	F	H
I-433	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	F	H
I-434	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	F	H
I-435	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	F	H
I-436	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	F	H
I-437	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	F	H
I-438	4-chlorobenzyl	H	H	F	Cl
I-439	Cinnamyl	H	H	F	Cl
I-440	4-chlorocinnamyl	H	H	F	Cl
I-441	4-fluorocinnamyl	H	H	F	Cl
I-442	4-bromocinnamyl	H	H	F	Cl
I-443	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	F	Cl
I-444	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	F	Cl
I-445	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	F	Cl
I-446	4-methoxycinnamyl	H	H	F	Cl
I-447	4-ethoxycinnamyl	H	H	F	Cl
I-448	4-cyanocinnamyl	H	H	F	Cl

I-449	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	F	Cl
I-450	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	F	Cl
I-451	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	F	Cl
I-452	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	F	Cl
I-453	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	F	Cl
I-454	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	F	Cl
I-455	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	F	Cl
I-456	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	F	Cl
I-457	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	Cl
I-458	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	Cl
I-459	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	F	Cl
I-460	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	F	Cl
I-461	4-chlorobenzyl	Cl	H	H	F
I-462	Cinnamyl	Cl	H	H	F
I-463	4-chlorocinnamyl	Cl	H	H	F
I-464	4-fluorocinnamyl	Cl	H	H	F
I-465	4-bromocinnamyl	Cl	H	H	F
I-466	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	H	F
I-467	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	H	F
I-468	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	H	F
I-469	4-methoxycinnamyl	Cl	H	H	F
I-470	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	H	F
I-471	4-cyanocinnamyl	Cl	H	H	F
I-472	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	H	F
I-473	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	H	F
I-474	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	H	F
I-475	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	H	F

I-476	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	H	F
I-477	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	H	F
I-478	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	H	F
I-479	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	H	F
I-480	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H	F
I-481	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H	F
I-482	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	H	F
I-483	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	H	F
I-484	4-chlorobenzyl	H	Cl	H	F
I-485	Cinnamyl	H	Cl	H	F
I-486	4-chlorocinnamyl	H	Cl	H	F
I-487	4-fluorocinnamyl	H	Cl	H	F
I-488	4-bromocinnamyl	H	Cl	H	F
I-489	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	H	F
I-490	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	H	F
I-491	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	H	F
I-492	4-methoxycinnamyl	H	Cl	H	F
I-493	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	H	F
I-494	4-cyanocinnamyl	H	Cl	H	F
I-495	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	H	F
I-496	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	H	F
I-497	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	H	F
I-498	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	H	F
I-499	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	H	F
I-500	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	H	F
I-501	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	H	F
I-502	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	H	F

I-503	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	F
I-504	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	F
I-505	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	H	F
I-506	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	H	F
I-507	4-chlorobenzyl	H	H	Cl	F
I-508	Cinnamyl	H	H	Cl	F
I-509	4-chlorocinnamyl	H	H	Cl	F
I-510	4-fluorocinnamyl	H	H	Cl	F
I-511	4-bromocinnamyl	H	H	Cl	F
I-512	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	Cl	F
I-513	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	Cl	F
I-514	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	Cl	F
I-515	4-methoxycinnamyl	H	H	Cl	F
I-516	4-ethoxycinnamyl	H	H	Cl	F
I-517	4-cyanocinnamyl	H	H	Cl	F
I-518	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	Cl	F
I-519	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	Cl	F
I-520	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	Cl	F
I-521	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	Cl	F
I-522	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	Cl	F
I-523	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	Cl	F
I-524	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	Cl	F
I-525	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	Cl	F
I-526	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	F
I-527	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	F
I-528	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	Cl	F
I-529	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	Cl	F

I-530	4-chlorobenzyl	H	F	F	F
I-531	Cinnamyl	H	F	F	F
I-532	4-chlorocinnamyl	H	F	F	F
I-533	4-fluorocinnamyl	H	F	F	F
I-534	4-bromocinnamyl	H	F	F	F
I-535	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	F	F
I-536	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	F	F
I-537	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	F	F
I-538	4-methoxycinnamyl	H	F	F	F
I-539	4-ethoxycinnamyl	H	F	F	F
I-540	4-cyanocinnamyl	H	F	F	F
I-541	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	F	F
I-542	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	F	F
I-543	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	F	F
I-544	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	F	F
I-545	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	F	F
I-546	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	F	F
I-547	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	F	F
I-548	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	F	F
I-549	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	F	F
I-550	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	F	F
I-551	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	F	F
I-552	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	F	F
I-553	4-chlorobenzyl	F	H	F	F
I-554	Cinnamyl	F	H	F	F
I-555	4-chlorocinnamyl	F	H	F	F
I-556	4-fluorocinnamyl	F	H	F	F
I-557	4-bromocinnamyl	F	H	F	F

I-558	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	F	F
I-559	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	F	F
I-560	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	F	F
I-561	4-methoxycinnamyl	F	H	F	F
I-562	4-ethoxycinnamyl	F	H	F	F
I-563	4-cyanocinnamyl	F	H	F	F
I-564	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	F	F
I-565	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	F	F
I-566	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	F	F
I-567	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	F	F
I-568	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	F	F
I-569	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	F	F
I-570	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	F	F
I-571	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	F	F
I-572	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	F	F
I-573	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	F	F
I-574	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	F	F
I-575	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	F	F
I-576	4-chlorobenzyl	F	F	H	F
I-577	Cinnamyl	F	F	H	F
I-578	4-chlorocinnamyl	F	F	H	F
I-579	4-fluorocinnamyl	F	F	H	F
I-580	4-bromocinnamyl	F	F	H	F
I-581	4-trifluoromethylcinnamyl	F	F	H	F
I-582	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	F	H	F
I-583	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	F	H	F
I-584	4-methoxycinnamyl	F	F	H	F
I-585	4-ethoxycinnamyl	F	F	H	F

I-586	4-cyanocinnamyl	F	F	H	F
I-587	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	F	H	F
I-588	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	F	H	F
I-589	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	F	H	F
I-590	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	F	H	F
I-591	3,5-dichloro-cinnamyl	F	F	H	F
I-592	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	F	H	F
I-593	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	F	H	F
I-594	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	F	H	F
I-595	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	H	F
I-596	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	H	F
I-597	3-pyridin-4-yl-allyl	F	F	H	F
I-598	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	F	H	F
I-599	4-chlorobenzyl	F	F	F	H
I-600	Cinnamyl	F	F	F	H
I-601	4-chlorocinnamyl	F	F	F	H
I-602	4-fluorocinnamyl	F	F	F	H
I-603	4-bromocinnamyl	F	F	F	H
I-604	4-trifluoromethylcinnamyl	F	F	F	H
I-605	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	F	F	H
I-606	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	F	F	H
I-607	4-methoxycinnamyl	F	F	F	H
I-608	4-ethoxycinnamyl	F	F	F	H
I-609	4-cyanocinnamyl	F	F	F	H
I-610	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	F	F	H
I-611	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	F	F	H
I-612	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	F	F	H

I-613	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	F	F	H
I-614	3,5-dichloro-cinnamyl	F	F	F	H
I-615	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	F	F	H
I-616	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	F	F	H
I-617	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	F	F	H
I-618	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	F	H
I-619	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	F	H
I-620	3-pyridin-4-yl-allyl	F	F	F	H
I-621	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	F	F	H
I-622	4-chlorobenzyl	H	Cl	Cl	Cl
I-623	Cinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-624	4-chlorocinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-625	4-fluorocinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-626	4-bromocinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-627	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-628	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-629	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-630	4-methoxycinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-631	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-632	4-cyanocinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-633	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-634	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	Cl	Cl
I-635	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-636	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-637	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	Cl	Cl
I-638	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	Cl	Cl
I-639	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	Cl	Cl

I-640	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-641	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-642	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-643	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-644	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	Cl	Cl
I-645	4-chlorobenzyl	Cl	H	Cl	Cl
I-646	Cinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-647	4-chlorocinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-648	4-fluorocinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-649	4-bromocinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-650	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-651	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-652	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-653	4-methoxycinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-654	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-655	4-cyanocinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-656	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-657	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	Cl	Cl
I-658	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-659	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-660	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-661	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	Cl	Cl
I-662	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	Cl	Cl
I-663	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-664	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-665	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-666	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	Cl	Cl

I-667	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	Cl	Cl
I-668	4-chlorobenzyl	Cl	Cl	H	Cl
I-669	Cinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-670	4-chlorocinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-671	4-fluorocinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-672	4-bromocinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-673	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-674	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-675	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-676	4-methoxycinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-677	4-ethoxycinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-678	4-cyanocinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-679	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-680	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	Cl	H	Cl
I-681	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-682	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-683	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-684	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	Cl	H	Cl
I-685	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	Cl	H	Cl
I-686	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-687	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-688	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-689	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-690	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	Cl	H	Cl
I-691	4-chlorobenzyl	Cl	Cl	Cl	H
I-692	Cinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-693	4-chlorocinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-694	4-fluorocinnamyl	Cl	Cl	Cl	H

I-695	4-bromocinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-696	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-697	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-698	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-699	4-methoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-700	4-ethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-701	4-cyanocinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-702	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-703	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	Cl	Cl	H
I-704	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-705	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-706	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-707	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	Cl	Cl	H
I-708	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	H
I-709	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-710	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-711	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-712	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-713	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	H
I-714	4-chlorobenzyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-715	Cinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-716	4-chlorocinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-717	4-fluorocinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-718	4-bromocinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-719	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-720	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-721	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-722	4-methoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl

I-723	4-ethoxycinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-724	4-cyanocinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-725	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-726	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-727	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-728	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-729	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-730	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-731	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-732	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-733	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-734	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-735	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-736	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	Cl	Cl	Cl
I-737	4-chlorobenzyl	F	F	F	F
I-738	Cinnamyl	F	F	F	F
I-739	4-chlorocinnamyl	F	F	F	F
I-740	4-fluorocinnamyl	F	F	F	F
I-741	4-bromocinnamyl	F	F	F	F
I-742	4-trifluoromethylcinnamyl	F	F	F	F
I-743	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	F	F	F
I-744	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	F	F	F
I-745	4-methoxycinnamyl	F	F	F	F
I-746	4-ethoxycinnamyl	F	F	F	F
I-747	4-cyanocinnamyl	F	F	F	F
I-748	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	F	F	F
I-749	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	F	F	F

I-750	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	F	F	F
I-751	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	F	F	F
I-752	3,5-dichloro-cinnamyl	F	F	F	F
I-753	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	F	F	F
I-754	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	F	F	F
I-755	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	F	F	F
I-756	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	F	F
I-757	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	F	F	F
I-758	3-pyridin-4-yl-allyl	F	F	F	F
I-759	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	F	F	F
I-760	4-chlorobenzyl	H	F	H	F
I-761	Cinnamyl	H	F	H	F
I-762	4-chlorocinnamyl	H	F	H	F
I-763	4-fluorocinnamyl	H	F	H	F
I-764	4-bromocinnamyl	H	F	H	F
I-765	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	H	F
I-766	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	H	F
I-767	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	H	F
I-768	4-methoxycinnamyl	H	F	H	F
I-769	4-ethoxycinnamyl	H	F	H	F
I-770	4-cyanocinnamyl	H	F	H	F
I-771	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	H	F
I-772	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	H	F
I-773	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	H	F
I-774	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	H	F
I-775	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	H	F

I-776	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	H	F
I-777	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	H	F
I-778	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	H	F
I-779	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	F
I-780	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H	F
I-781	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	H	F
I-782	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	H	F
I-783	4-chlorobenzyl	H	F	F	H
I-784	Cinnamyl	H	F	F	H
I-785	4-chlorocinnamyl	H	F	F	H
I-786	4-fluorocinnamyl	H	F	F	H
I-787	4-bromocinnamyl	H	F	F	H
I-788	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	F	H
I-789	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	F	H
I-790	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	F	H
I-791	4-methoxycinnamyl	H	F	F	H
I-792	4-ethoxycinnamyl	H	F	F	H
I-793	4-cyanocinnamyl	H	F	F	H
I-794	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	F	H
I-795	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	F	H
I-796	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	F	H
I-797	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	F	H
I-798	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	F	H
I-799	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	F	H
I-800	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	F	H
I-801	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	F	H

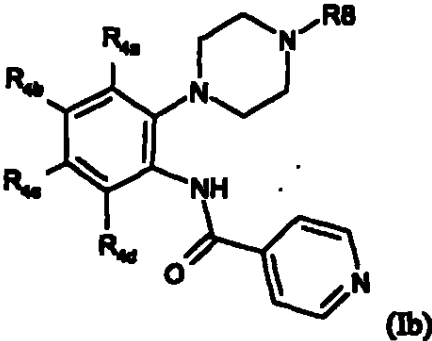
I-802	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	F	H
I-803	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	F	H
I-804	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	F	H
I-805	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	F	H
I-806	4-chlorobenzyl	H	F	F	H
I-807	Cinnamyl	H	H	F	F
I-808	4-chlorocinnamyl	H	H	F	F
I-809	4-fluorocinnamyl	H	H	F	F
I-810	4-bromocinnamyl	H	H	F	F
I-811	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	F	F
I-812	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	F	F
I-813	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	F	F
I-814	4-methoxycinnamyl	H	H	F	F
I-815	4-ethoxycinnamyl	H	H	F	F
I-816	4-cyanocinnamyl	H	H	F	F
I-817	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	F	F
I-818	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	F	F
I-819	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	F	F
I-820	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	F	F
I-821	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	F	F
I-822	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	F	F
I-823	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	F	F
I-824	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	F	F
I-825	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	F
I-826	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	F	F
I-827	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	F	F

I-828	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	F	F
I-829	4-chlorobenzyl	H	H	Cl	Cl
I-830	Cinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-831	4-chlorocinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-832	4-fluorocinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-833	4-bromocinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-834	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-835	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-836	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-837	4-methoxycinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-838	4-ethoxycinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-839	4-cyanocinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-840	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	Cl	Cl
I-841	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	Cl	Cl
I-842	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	Cl	Cl
I-843	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-844	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-845	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	Cl	Cl
I-846	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	Cl	Cl
I-847	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	Cl	Cl
I-848	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	Cl
I-849	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	Cl	Cl
I-850	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	Cl	Cl
I-851	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	Cl	Cl
I-852	4-chlorobenzyl	H	Cl	Cl	H
I-853	Cinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-854	4-chlorocinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-855	4-fluorocinnamyl	H	Cl	Cl	H

I-856	4-bromocinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-857	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-858	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-859	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-860	4-methoxycinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-861	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-862	4-cyanocinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-863	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	Cl	H
I-864	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	Cl	H
I-865	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	Cl	H
I-866	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-867	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-868	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	Cl	H
I-869	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	Cl	H
I-870	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	Cl	H
I-871	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	Cl	H
I-872	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	Cl	H
I-873	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	Cl	H
I-874	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	Cl	H
I-875	4-chlorobenzyl	H	Cl	H	Cl
I-876	Cinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-877	4-chlorocinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-878	4-fluorocinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-879	4-bromocinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-880	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-881	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-882	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-883	4-methoxycinnamyl	H	Cl	H	Cl

I-884	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-885	4-cyanocinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-886	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	H	Cl
I-887	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	H	Cl
I-888	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	Cl	H	Cl
I-889	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-890	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-891	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	H	Cl
I-892	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	H	Cl
I-893	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	H	Cl
I-894	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	Cl
I-895	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H	Cl
I-896	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	H	Cl
I-897	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	H	Cl

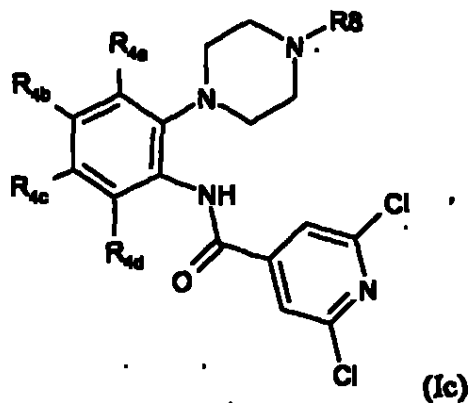
Table II provides 897 compounds of formula Ib



wherein the values of R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

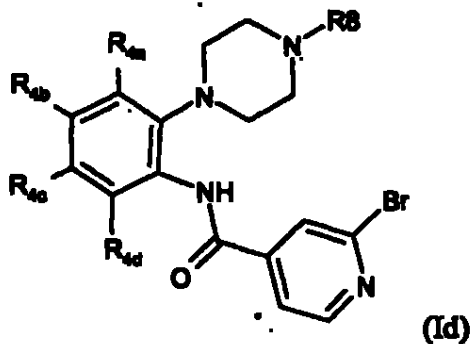
Table III provides 897 compounds of formula Ic

- 50 -



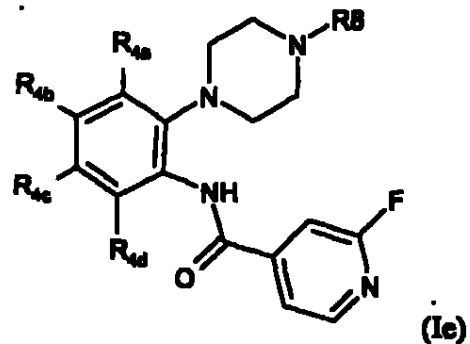
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1

Table IV provides 897 compounds of formula Id



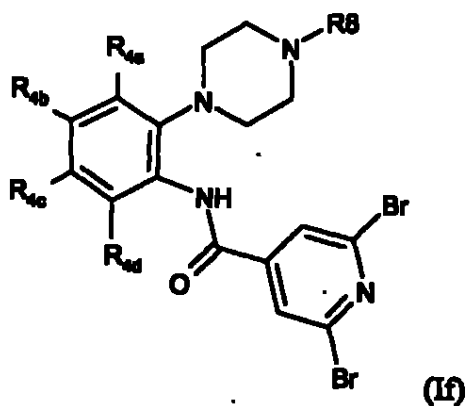
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1

Table V provides 897 compounds of formula Ie



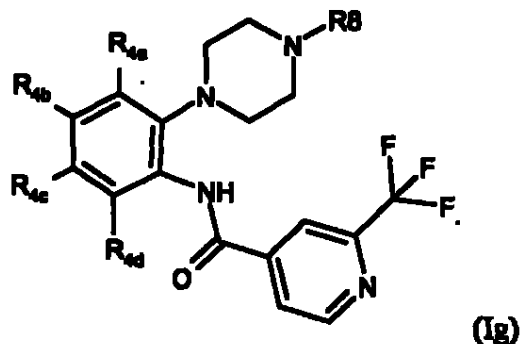
wherein and the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1

Table VI provides 897 compounds of formula If



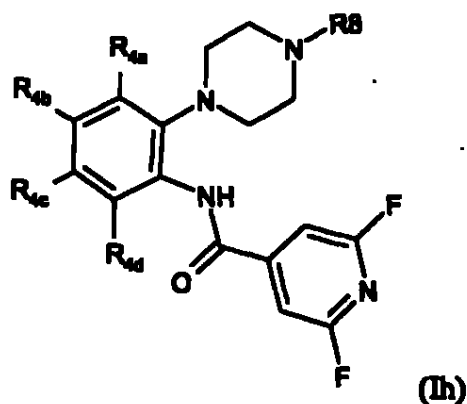
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1

Table VII provides 897 compounds of formula Ig



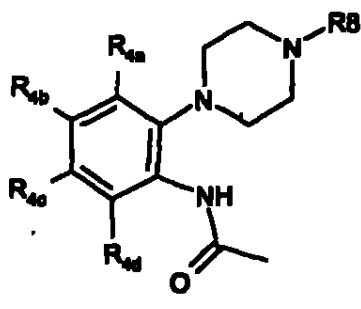
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table VIII provides 897 compounds of formula Ih



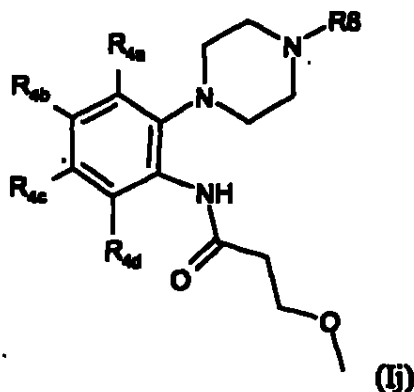
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1

Table IX provides 897 compounds of formula Ii



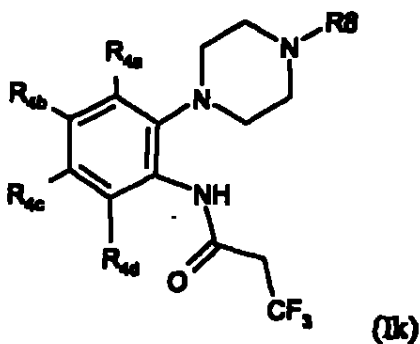
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table X provides 897 compounds of formula Ij



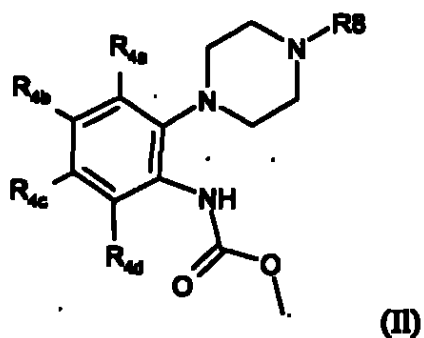
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XI provides 897 compounds of formula Ik



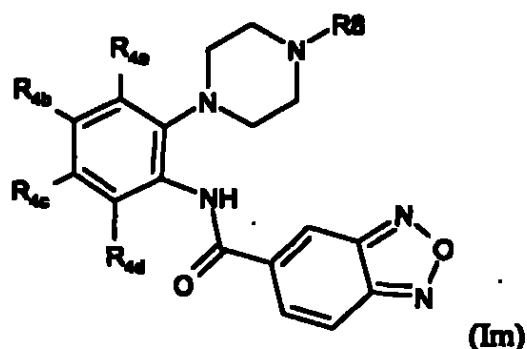
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XII provides 897 compounds of formula Il



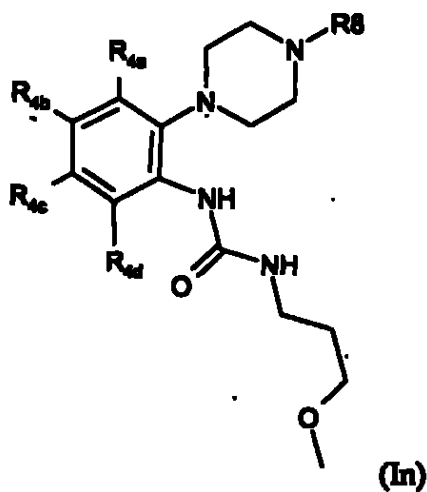
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XIII provides 897 compounds of formula Im



wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

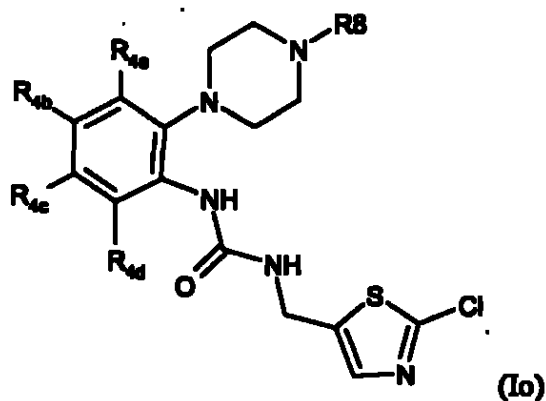
Table XIV provides 897 compounds of formula In



wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

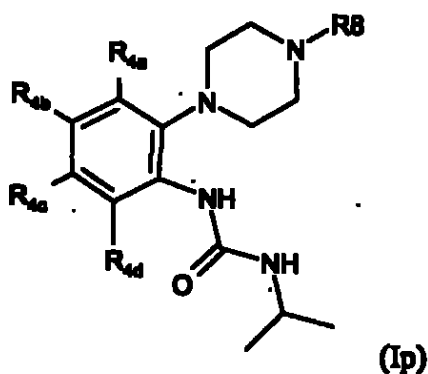
Table XV provides 897 compounds of formula Io

- 54 -



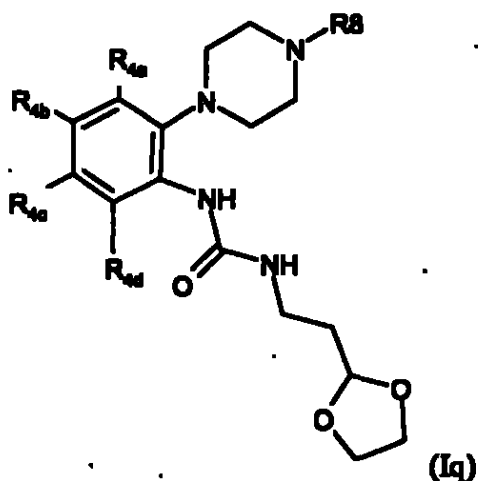
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XVI provides 897 compounds of formula Ip



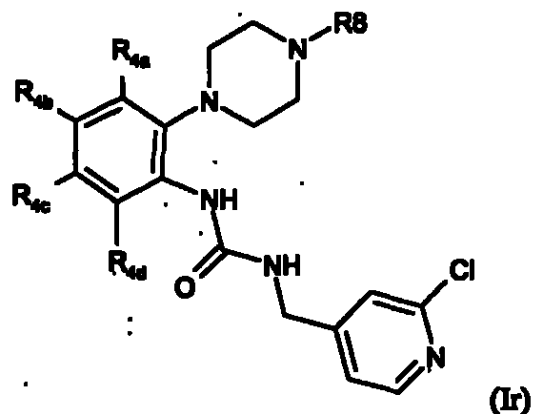
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XVII provides 897 compounds of formula Iq



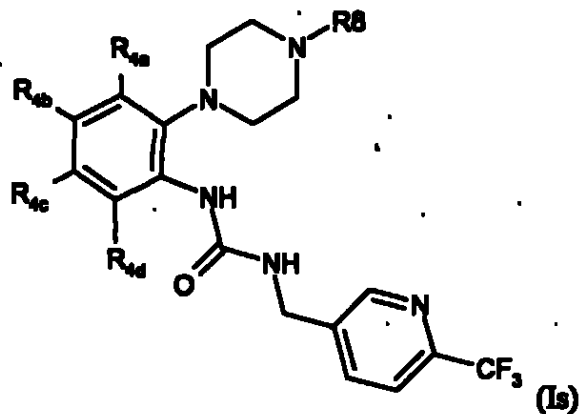
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XVIII provides 897 compounds of formula Ir



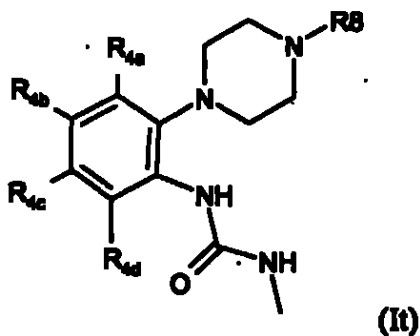
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XIX provides 897 compounds of formula Is



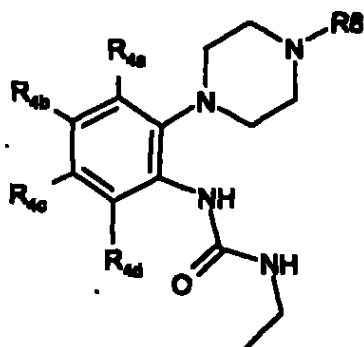
wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XX provides 897 compounds of formula It



wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

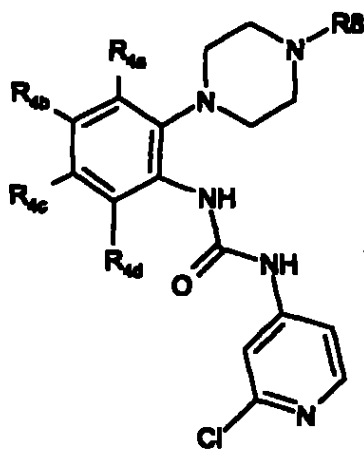
Table XXI provides 897 compounds of formula Iu



(Iu)

wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

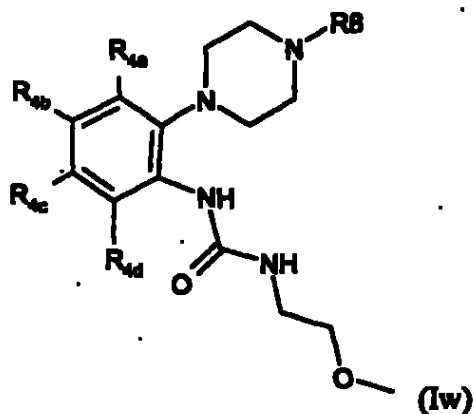
Table XXII provides 897 compounds of formula Iv



(Iv)

wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

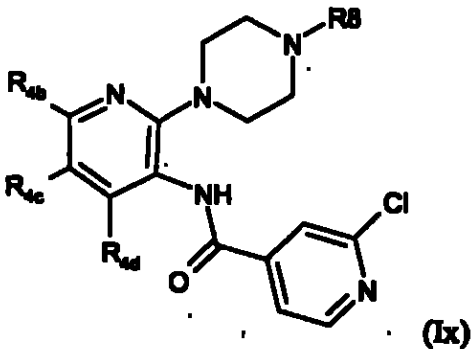
Table XXIII provides 897 compounds of formula Iw



(Iw)

wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

Table XXIV provides 110 compounds of formula Ix



wherein the values of R⁸, R^{4b}, R^{4c} and R^{4d} are given in Table 24.

Table 24

5

Compound No	R ⁸	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
XXIV-1	Cinnamyl	H	H	H
XXIV-2	4-chlorocinnamyl	H	H	H
XXIV-3	4-fluorocinnamyl	H	H	H
XXIV-4	4-bromocinnamyl	H	H	H
XXIV-5	4-trifluoromethylcinnamyl	H	H	H
XXIV-6	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	H	H
XXIV-7	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	H	H
XXIV-8	4-methoxycinnamyl	H	H	H
XXIV-9	4-ethoxycinnamyl	H	H	H
XXIV-10	4-cyanocinnamyl	H	H	H
XXIV-11	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	H	H
XXIV-12	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	H	H
XXIV-13	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	H	H
XXIV-14	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	H	H
XXIV-15	3,5-dichloro-cinnamyl	H	H	H
XXIV-16	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	H	H
XXIV-17	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	H	H	H
XXIV-18	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	H	H

XXIV-19	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	H
XXIV-20	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	H	H
XXIV-21	3-pyridin-4-yl-allyl	H	H	H
XXIV-22	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	H	H
XXIV-23	Cinnamyl	F	H	H
XXIV-24	4-chlorocinnamyl	F	H	H
XXIV-25	4-fluorocinnamyl	F	H	H
XXIV-26	4-bromocinnamyl	F	H	H
XXIV-27	4-trifluoromethylcinnamyl	F	H	H
XXIV-28	4-trifluoromethoxycinnamyl	F	H	H
XXIV-29	4-pentafluoroethoxycinnamyl	F	H	H
XXIV-30	4-methoxycinnamyl	F	H	H
XXIV-31	4-ethoxycinnamyl	F	H	H
XXIV-32	4-cyanocinnamyl	F	H	H
XXIV-33	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	F	H	H
XXIV-34	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	F	H	H
XXIV-35	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	F	H	H
XXIV-36	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	F	H	H
XXIV-37	3,5-dichloro-cinnamyl	F	H	H
XXIV-38	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	F	H	H
XXIV-39	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	F	H	H
XXIV-40	3-naphthalen-2-yl-allyl	F	H	H
XXIV-41	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H
XXIV-42	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	F	H	H
XXIV-43	3-pyridin-4-yl-allyl	F	H	H
XXIV-44	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	F	H	H
XXIV-45	Cinnamyl	Cl	H	H

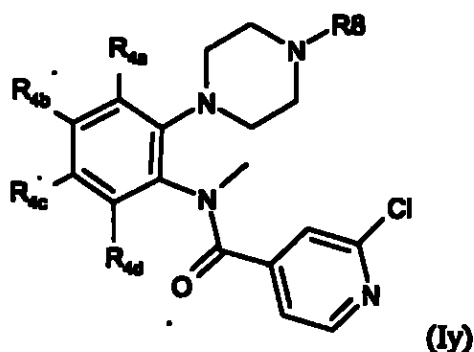
XXIV-46	4-chlorocinnamyl	Cl	H	H
XXIV-47	4-fluorocinnamyl	Cl	H	H
XXIV-48	4-bromocinnamyl	Cl	H	H
XXIV-49	4-trifluoromethylcinnamyl	Cl	H	H
XXIV-50	4-trifluoromethoxycinnamyl	Cl	H	H
XXIV-51	4-pentafluoroethoxycinnamyl	Cl	H	H
XXIV-52	4-methoxycinnamyl	Cl	H	H
XXIV-53	4-ethoxycinnamyl	Cl	H	H
XXIV-54	4-cyanocinnamyl	Cl	H	H
XXIV-55	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	Cl	H	H
XXIV-56	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	Cl	H	H
XXIV-57	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	Cl	H	H
XXIV-58	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	Cl	H	H
XXIV-59	3,5-dichloro-cinnamyl	Cl	H	H
XXIV-60	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	Cl	H	H
XXIV-61	4-isopropylloxycarbonylamino-cinnamyl	Cl	H	H
XXIV-62	3-naphthalen-2-yl-allyl	Cl	H	H
XXIV-63	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H
XXIV-64	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	Cl	H	H
XXIV-65	3-pyridin-4-yl-allyl	Cl	H	H
XXIV-66	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	Cl	H	H
XXIV-67	Cinnamyl	H	F	H
XXIV-68	4-chlorocinnamyl	H	F	H
XXIV-69	4-fluorocinnamyl	H	F	H
XXIV-70	4-bromocinnamyl	H	F	H
XXIV-71	4-trifluoromethylcinnamyl	H	F	H
XXIV-72	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	F	H
XXIV-73	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	F	H

XXIV-74	4-methoxycinnamyl	H	F	H
XXIV-75	4-ethoxycinnamyl	H	F	H
XXIV-76	4-cyanocinnamyl	H	F	H
XXIV-77	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	F	H
XXIV-78	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	F	H
XXIV-79	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-allyl	H	F	H
XXIV-80	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	F	H
XXIV-81	3,5-dichloro-cinnamyl	H	F	H
XXIV-82	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	F	H
XXIV-83	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	F	H
XXIV-84	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	F	H
XXIV-85	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H
XXIV-86	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	F	H
XXIV-87	3-pyridin-4-yl-allyl	H	F	H
XXIV-88	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	F	H
XXIV-89	Cinnamyl	H	Cl	H
XXIV-90	4-chlorocinnamyl	H	Cl	H
XXIV-91	4-fluorocinnamyl	H	Cl	H
XXIV-92	4-bromocinnamyl	H	Cl	H
XXIV-93	4-trifluoromethylcinnamyl	H	Cl	H
XXIV-94	4-trifluoromethoxycinnamyl	H	Cl	H
XXIV-95	4-pentafluoroethoxycinnamyl	H	Cl	H
XXIV-96	4-methoxycinnamyl	H	Cl	H
XXIV-97	4-ethoxycinnamyl	H	Cl	H
XXIV-98	4-cyanocinnamyl	H	Cl	H
XXIV-99	3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-allyl	H	Cl	H
XXIV-100	3-(4-chlorophenyl)-but-2-enyl	H	Cl	H
XXIV-101	3-(4-chlorophenyl)-3-fluoro-	H	Cl	H

	allyl			
XXIV-102	3-chloro-4-fluoro-cinnamyl	H	Cl	H
XXIV-103	3,5-dichloro-cinnamyl	H	Cl	H
XXIV-104	5-phenyl-penta-2,4-dienyl	H	Cl	H
XXIV-105	4-isopropoxyloxycarbonylamino-cinnamyl	H	Cl	H
XXIV-106	3-naphthalen-2-yl-allyl	H	Cl	H
XXIV-107	3-(5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H
XXIV-108	3-(5-chloro-pyridin-2-yl)-allyl	H	Cl	H
XXIV-109	3-pyridin-4-yl-allyl	H	Cl	H
XXIV-110	3-(2-Chloro-pyridin-4-yl)-allyl	H	Cl	H

5

Table XXV provides 897 compounds of formula Iy

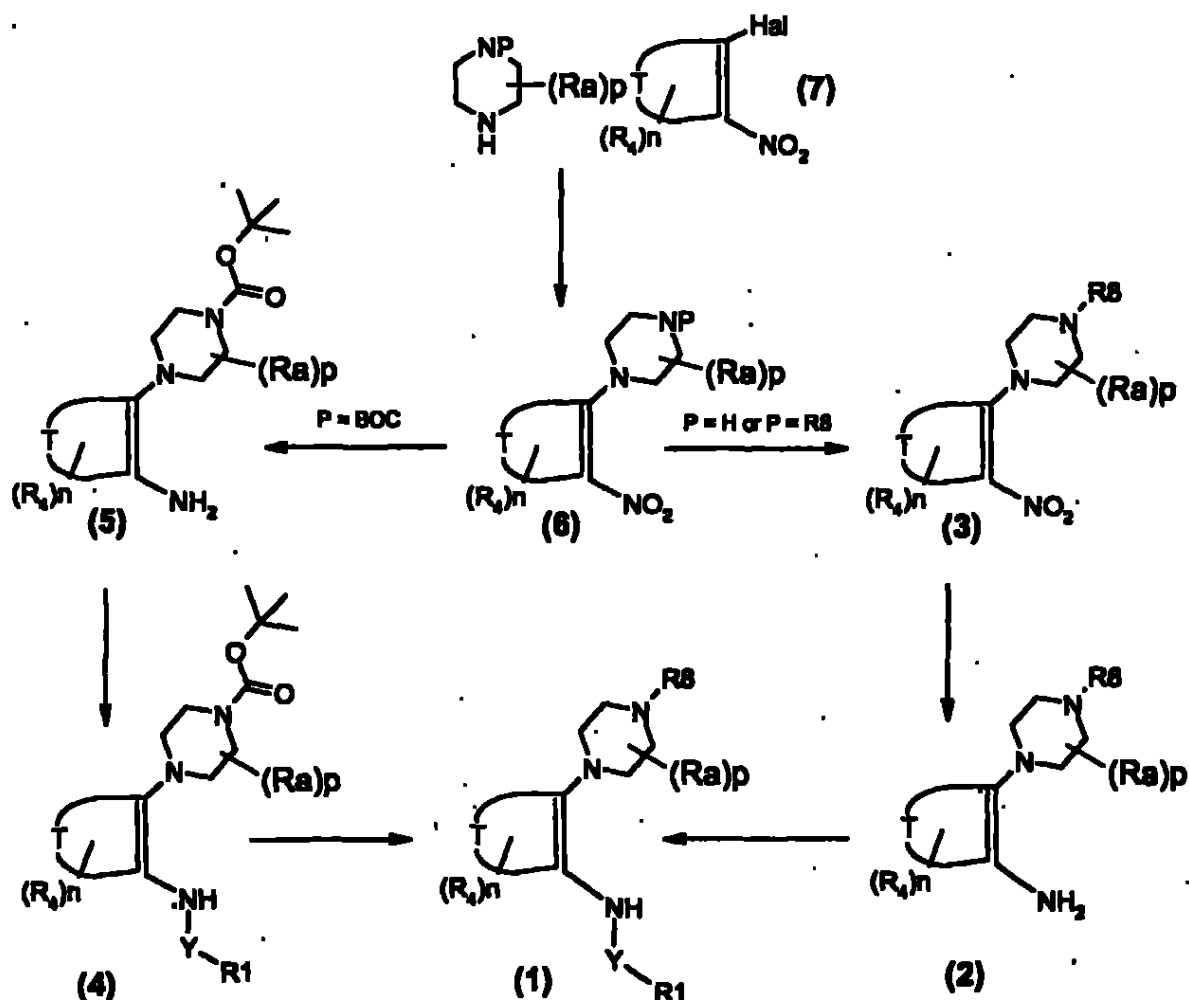


wherein the values of R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are given in Table 1.

10

The compounds of the invention may be made by a variety of methods. For example they may be prepared according to the reactions of Scheme 1.

SCHEME 1



Thus a compound of formula 1 may be obtained from a compound of formula 2 by
 5 reaction with a suitable electrophilic species. Compounds of formula 1 where Y is a
 carbonyl group may be formed by the reaction of compounds of formula 2 with a carboxylic
 acid derivative of formula R₁-C(O)-Z where Z is chloride, hydroxy, alkoxy or acyloxy at a
 temperature between 0°C and 150°C optionally in an organic solvent such as
 dichloromethane, chloroform or 1,2-dichloroethane, optionally in the presence of a tertiary
 amine base such as triethylamine or diisopropylethylamine and optionally in the presence of
 10 a coupling agent such as dicyclohexylcarbodiimide. Compounds of formula 1 where Y is a
 carbonyl group and R₁ is an amino substituent of formula R'-NH- may be formed by the
 reaction of compounds of formula 4 with an isocyanate of formula R'-N=C=O under similar
 conditions. Compounds of formula 1 where Y is a group of formula S(O)_m may be formed

from compounds of formula 2 by treatment with compounds of formula of $R1-S(O)_m-Cl$ under similar conditions. Compounds of formula 1 where Y is a thiocarbonyl group and R1 is an amino substituent of formula $R'-NH-$ may be formed by the reaction of compounds of formula 2 with an isothiocyanate of formula $R'-N=C=S$ under similar conditions.

5 Alternatively compounds of formula 1 where Y is a thiocarbonyl group and R1 is a carbon substituent may be formed by treatment of compounds of formula 1 where Y is a carbonyl group and R1 is a carbon substituent with a suitable thionating agent such as Lawesson's reagent.

In the above procedures, acid derivatives of the formula $R1-C(O)-Z$, isocyanates of
10 formula $R'-N=C=O$, isothiocyanates of formula $R'-N=C=S$ and sulfur electrophiles of formula $R1-S(O)_q-Cl$ are either known compounds or may be formed from known compounds by known methods by a person skilled in the art.

Compounds of formula 2 may be prepared from compounds of formula 3 by reduction of the nitro group, according to known methods by a person skilled in the art.

15 Compounds of formula 3 may be obtained from compounds of formula 6 where P is H by reaction with an alkylating agent of the formula $R8-L$, where L is chloride, bromide, iodide or a sulfonate (e.g. mesylate or tosylate) or similar leaving group at a temperature of between ambient temperature and $100^{\circ}C$, typically $65^{\circ}C$, in an organic solvent such as dichloromethane, chloroform or 1,2-dichloroethane in the presence of a tertiary amine base
20 such as triethylamine or diisopropylethylamine and optionally catalysed by halide salts such as sodium iodide, potassium iodide or tetrabutylammonium iodide. Alternatively, a compound of formula 6 where P is H may be reacted with an aldehyde of the formula $RzCHO$ at a temperature between ambient temperature and $100^{\circ}C$ in an organic solvent such as tetrahydrofuran or ethanol or mixtures of solvents in the presence of a reducing agent such
25 as borane-pyridine complex, sodium borohydride, sodium (triacetoxy)borohydride, sodium cyanoborohydride or such like, to produce a compound of formula 3 where R8 is CH_2-Rz .

Alternatively, a compound of formula 1 may be obtained from a compound of formula 4 by (1) reaction with an acid such as trifluoroacetic acid at ambient temperature in an organic solvent such as dichloromethane, chloroform or 1,2-dichloroethane followed by
30 neutralisation of the reaction mixture with an aqueous solution of an inorganic base such as sodium carbonate, sodium bicarbonate or similar compound; then (2) reaction with an alkylating agent or an aldehyde as described above.

Compounds of formula 4 may be formed by reaction of compounds of formula 5 with a suitable electrophile, as described above in the method for converting compounds of formula 2 to compounds of formula 1.

Compounds of formula 5 may be obtained from compounds of formula 6 where P is t-butoxycarbonyl by reduction of the nitro group according to known methods.

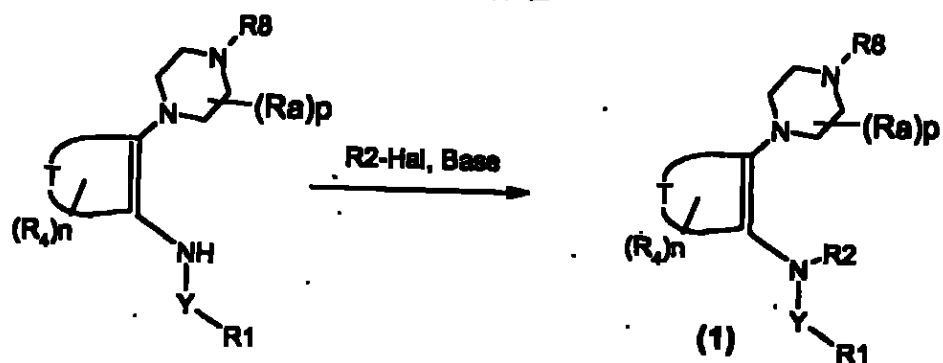
Compounds of formula 6 may be obtained from compounds of formula 7 by reaction with piperazine (P = H) or N-BOC-piperazine (P = t-butoxycarbonyl) at a temperature between 0°C and 180°C, in a solvent such as dichloromethane, 1,2-dichloroethane, acetonitrile, dimethylformamide or dimethylsulfoxide in the presence of a base such as triethylamine, diisopropylethylamine or potassium carbonate or in the absence of base.

Compounds of formula 5, formula 6 and formula 7 are known compounds or may be made from known compounds by known methods.

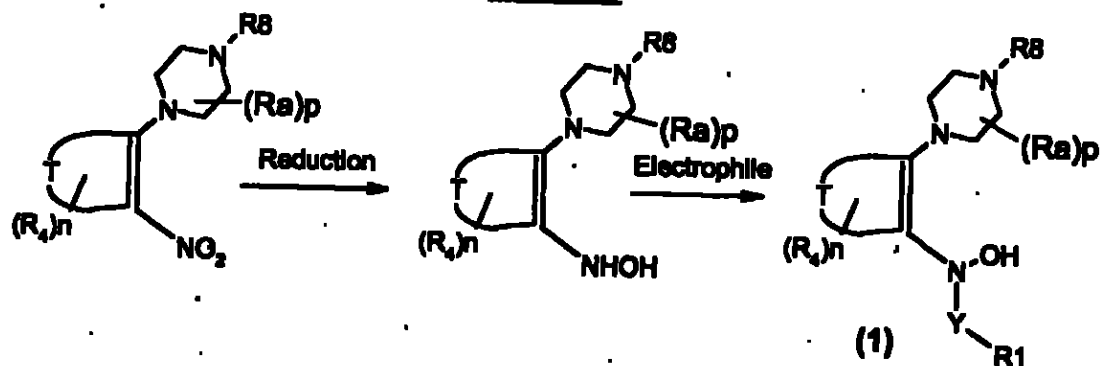
Certain compounds of formula 2, formula 3 and formula 4 are novel and as such form a further aspect of the invention.

The skilled person will readily recognise that it is possible to convert one compound of formula 1 wherein R₂ is H or an intermediate of Scheme 1 to other compounds of formula I. Examples of such transformations are given in Schemes 2, 3 and 4 in which the R groups have the meanings as defined for a compound of formula I above.

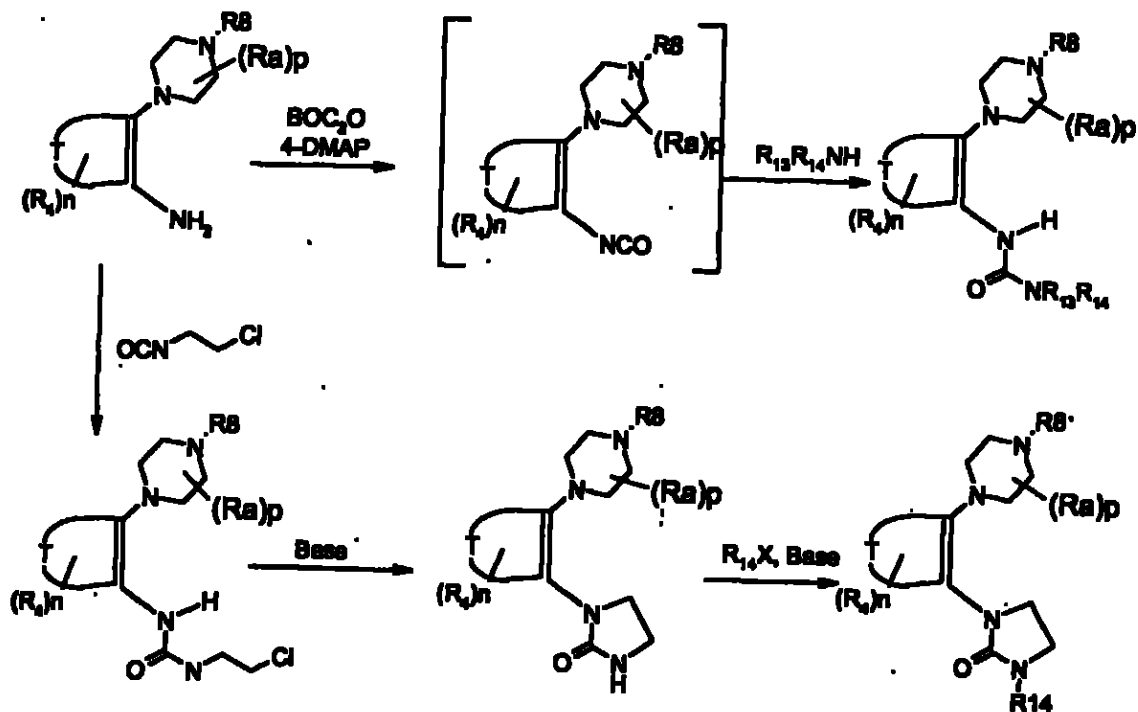
SCHEME 2



SCHEME 3



SCHEME 4



The compounds of formula (I) can be used to combat and control infestations of insect pests such as Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera and Isoptera and also other invertebrate pests, for example, acarine, nematode and mollusc pests. Insects, acarines, nematodes and molluscs are hereinafter collectively referred to as pests. The pests which may be combated and controlled by the use of the invention compounds include those pests associated with agriculture (which term includes the growing of crops for food and fibre products), horticulture and animal husbandry, companion animals, forestry and the storage of products of vegetable origin (such as fruit, grain and timber); those pests associated with the damage of man-made structures and the transmission of diseases of man and animals; and also nuisance pests (such as flies).

Examples of pest species which may be controlled by the compounds of formula (I) include: *Myzus persicae* (aphid), *Aphis gossypii* (aphid), *Aphis fabae* (aphid), *Lygus* spp. (capsids), *Dysdercus* spp. (capsids), *Nilaparvata lugens* (planthopper), *Nephotettix inciticeps* (leafhopper), *Nezara* spp. (stinkbugs), *Euschistus* spp. (stinkbugs), *Leptocoris* spp. (stinkbugs), *Frankliniella occidentalis* (thrip), *Thrips* spp. (thrips), *Leptinotarsa decemlineata* (Colorado potato beetle), *Anthonomus grandis* (boll weevil), *Aonidiella* spp. (scale insects), *Trialeurodes* spp. (white flies), *Bemisia tabaci* (white fly), *Ostrinia nubilalis* (European corn borer), *Spodoptera littoralis* (cotton leafworm), *Heliothis virescens* (tobacco budworm), *Helicoverpa armigera* (cotton bollworm), *Helicoverpa zea* (cotton bollworm), *Sylepta derogata* (cotton leaf roller), *Pieris brassicae* (white butterfly), *Plutella xylostella* (diamond back moth), *Agrotis* spp. (cutworms), *Chilo suppressalis* (rice stem borer), *Locusta migratoria* (locust), *Chortiocetes terminifera* (locust), *Diabrotica* spp. (rootworms), *Panonychus ulmi* (European red mite), *Panonychus citri* (citrus red mite), *Tetranychus urticae* (two-spotted spider mite), *Tetranychus cinnabarinus* (carmine spider mite), *Phyllocoptruta oleivora* (citrus rust mite), *Polyphagotarsonemus latus* (broad mite), *Brevipalpus* spp. (flat mites), *Boophilus microplus* (cattle tick), *Dermacentor variabilis* (American dog tick), *Ctenocephalides felis* (cat flea), *Liriomyza* spp. (leafminer), *Musca domestica* (housefly), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitoes), *Culex* spp. (mosquitoes), *Lucilia* spp. (blowflies), *Blattella germanica* (cockroach), *Periplaneta americana* (cockroach), *Blatta orientalis* (cockroach), termites of the Mastotermitidae (for example *Mastotermes* spp.), the Kalotermitidae (for example *Neotermes* spp.), the

Rhinotermitidae (for example *Coptotermes formosanus*; *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, and *R. santonensis*) and the Termitidae (for example *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (fire ant), *Monomorium pharaonis* (pharaoh's ant), *Damalinea* spp. and *Linognathus* spp. (biting and sucking lice), *Meloidogyne* spp. (root knot
5 nematodes), *Globodera* spp. and *Heterodera* spp. (cyst nematodes), *Pratylenchus* spp. (lesion nematodes), *Rhizopholus* spp. (banana burrowing nematodes), *Tylenchulus* spp. (citrus nematodes), *Haemonchus contortus* (barber pole worm), *Caenorhabditis elegans* (vinegar eelworm), *Trichostrongylus* spp. (gastro intestinal nematodes) and *Deroceras reticulatum* (slug).

10 The invention therefore provides a method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I), or a composition containing a compound of formula (I), to a pest, a locus of pest, or to a plant susceptible to attack by a pest. The compounds of formula (I) are preferably used against
15 insects, acarines or nematodes.

The term "plant" as used herein includes seedlings, bushes and trees.

In order to apply a compound of formula (I) as an insecticide, acaricide, nematocide or molluscicide to a pest, a locus of pest, or to a plant susceptible to attack by a pest, a compound of formula (I) is usually formulated into a composition which includes, in addition
20 to the compound of formula (I), a suitable inert diluent or carrier and, optionally, a surface active agent (SFA). SFAs are chemicals which are able to modify the properties of an interface (for example, liquid/solid, liquid/air or liquid/liquid interfaces) by lowering the interfacial tension and thereby leading to changes in other properties (for example dispersion, emulsification and wetting). It is preferred that all compositions (both solid and liquid
25 formulations) comprise, by weight, 0.0001 to 95%, more preferably 1 to 85%, for example 5 to 60%, of a compound of formula (I). The composition is generally used for the control of pests such that a compound of formula (I) is applied at a rate of from 0.1g to 10kg per hectare, preferably from 1g to 6kg per hectare, more preferably from 1g to 1kg per hectare.

When used in a seed dressing, a compound of formula (I) is used at a rate of 0.0001g
30 to 10g (for example 0.001g or 0.05g), preferably 0.005g to 10g, more preferably 0.005g to 4g, per kilogram of seed.

In another aspect the present invention provides an insecticidal, acaricidal, nematocidal or molluscicidal composition comprising an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I) and a suitable carrier or diluent therefor. The composition is preferably an insecticidal, acaricidal, nematocidal or molluscicidal composition.

In a still further aspect the invention provides a method of combating and controlling pests at a locus which comprises treating the pests or the locus of the pests with an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a composition comprising a compound of formula (I). The compounds of formula (I) are preferably used against insects, acarines or nematodes.

The compositions can be chosen from a number of formulation types, including dustable powders (DP), soluble powders (SP), water soluble granules (SG), water dispersible granules (WG), wettable powders (WP), granules (GR) (slow or fast release), soluble concentrates (SL), oil miscible liquids (OL), ultra low volume liquids (UL), emulsifiable concentrates (EC), dispersible concentrates (DC), emulsions (both oil in water (EW) and water in oil (EO)), micro-emulsions (ME), suspension concentrates (SC), aerosols, fogging/smoke formulations, capsule suspensions (CS) and seed treatment formulations. The formulation type chosen in any instance will depend upon the particular purpose envisaged and the physical, chemical and biological properties of the compound of formula (I).

Dustable powders (DP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents (for example natural clays, kaolin, pyrophyllite, bentonite, alumina, montmorillonite, kieselguhr, chalk, diatomaceous earths, calcium phosphates, calcium and magnesium carbonates, sulphur, lime, flours, talc and other organic and inorganic solid carriers) and mechanically grinding the mixture to a fine powder.

Soluble powders (SP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more water-soluble inorganic salts (such as sodium bicarbonate, sodium carbonate or magnesium sulphate) or one or more water-soluble organic solids (such as a polysaccharide) and, optionally, one or more wetting agents, one or more dispersing agents or a mixture of said agents to improve water dispersibility/solubility. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water soluble granules (SG).

Wettable powders (WP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents or carriers, one or more wetting agents and, preferably, one or

more dispersing agents and, optionally, one or more suspending agents to facilitate the dispersion in liquids. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water dispersible granules (WG).

Granules (GR) may be formed either by granulating a mixture of a compound of formula (I) and one or more powdered solid diluents or carriers, or from pre-formed blank granules by absorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) in a porous granular material (such as pumice, attapulgite clays, fuller's earth, kiesselguhr, diatomaceous earths or ground corn cobs) or by adsorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) on to a hard core material (such as sands, silicates, mineral carbonates, sulphates or phosphates) and drying if necessary. Agents which are commonly used to aid absorption or adsorption include solvents (such as aliphatic and aromatic petroleum solvents, alcohols, ethers, ketones and esters) and sticking agents (such as polyvinyl acetates, polyvinyl alcohols, dextrans, sugars and vegetable oils). One or more other additives may also be included in granules (for example an emulsifying agent, wetting agent or dispersing agent).

Dispersible Concentrates (DC) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in water or an organic solvent, such as a ketone, alcohol or glycol ether. These solutions may contain a surface active agent (for example to improve water dilution or prevent crystallisation in a spray tank).

Emulsifiable concentrates (EC) or oil-in-water emulsions (EW) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in an organic solvent (optionally containing one or more wetting agents, one or more emulsifying agents or a mixture of said agents). Suitable organic solvents for use in ECs include aromatic hydrocarbons (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes, exemplified by SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 and SOLVESSO 200; SOLVESSO is a Registered Trade Mark), ketones (such as cyclohexanone or methylcyclohexanone) and alcohols (such as benzyl alcohol, furfuryl alcohol or butanol), N-alkylpyrrolidones (such as N-methylpyrrolidone or N-octylpyrrolidone), dimethyl amides of fatty acids (such as C₈-C₁₀ fatty acid dimethylamide) and chlorinated hydrocarbons. An EC product may spontaneously emulsify on addition to water, to produce an emulsion with sufficient stability to allow spray application through appropriate equipment. Preparation of an EW involves obtaining a compound of formula (I) either as a liquid (if it is not a liquid at room temperature, it may be melted at a reasonable temperature, typically below 70°C) or in

solution (by dissolving it in an appropriate solvent) and then emulsifying the resultant liquid or solution into water containing one or more SFAs, under high shear, to produce an emulsion. Suitable solvents for use in EWs include vegetable oils, chlorinated hydrocarbons (such as chlorobenzenes), aromatic solvents (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes) and other appropriate organic solvents which have a low solubility in water.

Microemulsions (ME) may be prepared by mixing water with a blend of one or more solvents with one or more SFAs, to produce spontaneously a thermodynamically stable isotropic liquid formulation. A compound of formula (I) is present initially in either the water or the solvent/SFA blend. Suitable solvents for use in MEs include those hereinbefore described for use in in ECs or in EWs. An ME may be either an oil-in-water or a water-in-oil system (which system is present may be determined by conductivity measurements) and may be suitable for mixing water-soluble and oil-soluble pesticides in the same formulation. An ME is suitable for dilution into water, either remaining as a microemulsion or forming a conventional oil-in-water emulsion.

Suspension concentrates (SC) may comprise aqueous or non-aqueous suspensions of finely divided insoluble solid particles of a compound of formula (I). SCs may be prepared by ball or bead milling the solid compound of formula (I) in a suitable medium, optionally with one or more dispersing agents, to produce a fine particle suspension of the compound. One or more wetting agents may be included in the composition and a suspending agent may be included to reduce the rate at which the particles settle. Alternatively, a compound of formula (I) may be dry milled and added to water, containing agents hereinbefore described, to produce the desired end product.

Aerosol formulations comprise a compound of formula (I) and a suitable propellant (for example *n*-butane). A compound of formula (I) may also be dissolved or dispersed in a suitable medium (for example water or a water miscible liquid, such as *n*-propanol) to provide compositions for use in non-pressurised, hand-actuated spray pumps.

A compound of formula (I) may be mixed in the dry state with a pyrotechnic mixture to form a composition suitable for generating, in an enclosed space, a smoke containing the compound.

Capsule suspensions (CS) may be prepared in a manner similar to the preparation of EW formulations but with an additional polymerisation stage such that an aqueous dispersion of oil droplets is obtained, in which each oil droplet is encapsulated by a polymeric shell and

contains a compound of formula (I) and, optionally, a carrier or diluent therefor. The polymeric shell may be produced by either an interfacial polycondensation reaction or by a coacervation procedure. The compositions may provide for controlled release of the compound of formula (I) and they may be used for seed treatment. A compound of formula (I) may also be formulated in a biodegradable polymeric matrix to provide a slow, controlled release of the compound.

A composition may include one or more additives to improve the biological performance of the composition (for example by improving wetting, retention or distribution on surfaces; resistance to rain on treated surfaces; or uptake or mobility of a compound of formula (I)). Such additives include surface active agents, spray additives based on oils, for example certain mineral oils or natural plant oils (such as soy bean and rape seed oil), and blends of these with other bio-enhancing adjuvants (ingredients which may aid or modify the action of a compound of formula (I)).

A compound of formula (I) may also be formulated for use as a seed treatment, for example as a powder composition, including a powder for dry seed treatment (DS), a water soluble powder (SS) or a water dispersible powder for slurry treatment (WS), or as a liquid composition, including a flowable concentrate (FS), a solution (LS) or a capsule suspension (CS). The preparations of DS, SS, WS, FS and LS compositions are very similar to those of, respectively, DP, SP, WP, SC and DC compositions described above. Compositions for treating seed may include an agent for assisting the adhesion of the composition to the seed (for example a mineral oil or a film-forming barrier).

Wetting agents, dispersing agents and emulsifying agents may be surface SFAs of the cationic, anionic, amphoteric or non-ionic type.

Suitable SFAs of the cationic type include quaternary ammonium compounds (for example cetyltrimethyl ammonium bromide), imidazolines and amine salts.

Suitable anionic SFAs include alkali metals salts of fatty acids, salts of aliphatic monoesters of sulphuric acid (for example sodium lauryl sulphate), salts of sulphonated aromatic compounds (for example sodium dodecylbenzenesulphonate, calcium dodecylbenzenesulphonate, butylnaphthalene sulphonate and mixtures of sodium di-*isopropyl*- and tri-*isopropyl*-naphthalene sulphonates), ether sulphates, alcohol ether sulphates (for example sodium laureth-3-sulphate), ether carboxylates (for example sodium laureth-3-carboxylate), phosphate esters (products from the reaction between one or more

fatty alcohols and phosphoric acid (predominately mono-esters) or phosphorus pentoxide (predominately di-esters), for example the reaction between lauryl alcohol and tetraphosphoric acid; additionally these products may be ethoxylated), sulphosuccinamates, paraffin or olefine sulphonates, taurates and lignosulphonates.

5 Suitable SFAs of the amphoteric type include betaines, propionates and glycines.

 Suitable SFAs of the non-ionic type include condensation products of alkylene oxides, such as ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof, with fatty alcohols (such as oleyl alcohol or cetyl alcohol) or with alkylphenols (such as octylphenol, nonylphenol or octylcresol); partial esters derived from long chain fatty acids or hexitol
10 anhydrides; condensation products of said partial esters with ethylene oxide; block polymers (comprising ethylene oxide and propylene oxide); alkanolamides; simple esters (for example fatty acid polyethylene glycol esters); amine oxides (for example lauryl dimethyl amine oxide); and lecithins.

 Suitable suspending agents include hydrophilic colloids (such as polysaccharides,
15 polyvinylpyrrolidone or sodium carboxymethylcellulose) and swelling clays (such as bentonite or attapulgate).

 A compound of formula (I) may be applied by any of the known means of applying pesticidal compounds. For example, it may be applied, formulated or unformulated, to the pests or to a locus of the pests (such as a habitat of the pests, or a growing plant liable to
20 infestation by the pests) or to any part of the plant, including the foliage, stems, branches or roots, to the seed before it is planted or to other media in which plants are growing or are to be planted (such as soil surrounding the roots, the soil generally, paddy water or hydroponic culture systems), directly or it may be sprayed on, dusted on, applied by dipping, applied as a cream or paste formulation, applied as a vapour or applied through distribution or
25 incorporation of a composition (such as a granular composition or a composition packed in a water-soluble bag) in soil or an aqueous environment.

 A compound of formula (I) may also be injected into plants or sprayed onto vegetation using electrodynamic spraying techniques or other low volume methods, or applied by land or aerial irrigation systems.

30 Compositions for use as aqueous preparations (aqueous solutions or dispersions) are generally supplied in the form of a concentrate containing a high proportion of the active ingredient, the concentrate being added to water before use. These concentrates, which may

include DCs, SCs, ECs, EWs, MEs SGs, SPs, WPs, WGs and CSs, are often required to withstand storage for prolonged periods and, after such storage, to be capable of addition to water to form aqueous preparations which remain homogeneous for a sufficient time to enable them to be applied by conventional spray equipment. Such aqueous preparations may contain varying amounts of a compound of formula (I) (for example 0.0001 to 10%, by weight) depending upon the purpose for which they are to be used.

A compound of formula (I) may be used in mixtures with fertilisers (for example nitrogen-, potassium- or phosphorus-containing fertilisers). Suitable formulation types include granules of fertiliser. The mixtures suitably contain up to 25% by weight of the compound of formula (I).

The invention therefore also provides a fertiliser composition comprising a fertiliser and a compound of formula (I).

The compositions of this invention may contain other compounds having biological activity, for example micronutrients or compounds having fungicidal activity or which possess plant growth regulating, herbicidal, insecticidal, nematocidal or acaricidal activity.

The compound of formula (I) may be the sole active ingredient of the composition or it may be admixed with one or more additional active ingredients such as a pesticide, fungicide, synergist, herbicide or plant growth regulator where appropriate. An additional active ingredient may: provide a composition having a broader spectrum of activity or increased persistence at a locus; synergise the activity or complement the activity (for example by increasing the speed of effect or overcoming repellency) of the compound of formula (I); or help to overcome or prevent the development of resistance to individual components. The particular additional active ingredient will depend upon the intended utility of the composition. Examples of suitable pesticides include the following:

- a) Pyrethroids, such as permethrin, cypermethrin, fenvalerate, esfenvalerate, deltamethrin, cyhalothrin (in particular lambda-cyhalothrin), bifenthrin, fenpropathrin, cyfluthrin, tefluthrin, fish safe pyrethroids (for example ethofenprox), natural pyrethrin, tetramethrin, s-bioallethrin, fenfluthrin, prallethrin or 5-benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R,3S)-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropane carboxylate;
- b) Organophosphates, such as, profenofos, sulprofos, acephate, methyl parathion, azinphos-methyl, demeton-s-methyl, heptenophos, thiometon, fenamiphos, monocrotophos, profenofos, triazophos, methamidophos, dimethoate, phosphamidon, malathion, chlorpyrifos,

- phosalone, terbufos, fensulfothion, fonofos, phorate, phoxim, pirimiphos-methyl, pirimiphos-ethyl, fenitrothion, fosthiazate or diazinon;
- c) Carbamates (including aryl carbamates), such as pirimicarb, triazamate, cloethocarb, carbofuran, furathiocarb, ethiofencarb, aldicarb, thiofurox, carbosulfan, bendiocarb,
- 5 fenobucarb, propoxur, methomyl or oxamyl;
- d) Benzoyl ureas, such as diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron or chlorfluazuron;
- e) Organic tin compounds, such as cyhexatin, fenbutatin oxide or azocyclotin;
- f) Pyrazoles, such as tebufenpyrad and fenpyroximate;
- 10 g) Macrolides, such as avermectins or milbemycins, for example abamectin, emamectin benzoate, ivermectin, milbemycin, spinosad or azadirachtin;
- h) Hormones or pheromones;
- i) Organochlorine compounds such as endosulfan, benzene hexachloride, DDT, chlordane or dieldrin;
- 15 j) Amidines, such as chlordimeform or amitraz;
- k) Fumigant agents, such as chloropicrin, dichloropropane, methyl bromide or metam;
- l) Chloronicotinyl compounds such as imidacloprid, thiacloprid, acetamiprid, nitenpyram or thiamethoxam;
- m) Diacylhydrazines, such as tebufenozide, chromafenozide or methoxyfenozide;
- 20 n) Diphenyl ethers, such as diofenolan or pyriproxifen;
- o) Indoxacarb;
- p) Chlorfenapyr; or
- q) Pymetrozine.

In addition to the major chemical classes of pesticide listed above, other pesticides

25 having particular targets may be employed in the composition, if appropriate for the intended utility of the composition. For instance, selective insecticides for particular crops, for example stemborer specific insecticides (such as cartap) or hopper specific insecticides (such as buprofezin) for use in rice may be employed. Alternatively insecticides or acaricides specific for particular insect species/stages may also be included in the compositions (for

30 example acaricidal ovo-larvicides, such as clofentezine, flubenzimine, hexythiazox or tetradifon; acaricidal motilicides, such as dicofol or propargite; acaricides, such as

bromopropylate or chlorobenzilate; or growth regulators, such as hydramethylnon, cyromazine, methoprene, chlorfluazuron or diflubenzuron).

Examples of fungicidal compounds which may be included in the composition of the invention are (*E*)-*N*-methyl-2-[2-(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl]-2-methoxy-
 5 iminoacetamide (SSF-129), 4-bromo-2-cyano-*N,N*-dimethyl-6-trifluoromethylbenzimidazole-1-sulphonamide, α -[*N*-(3-chloro-2,6-xylyl)-2-methoxyacetamido]- γ -butyrolactone, 4-chloro-2-cyano-*N,N*-dimethyl-5-*p*-tolylimidazole-1-sulfonamide (IKF-916, cyanidazosulfamid), 3-5-dichloro-*N*-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH-7281, zoxamide), *N*-allyl-4,5,-dimethyl-2-trimethylsilylthiophene-3-carboxamide (MON65500), *N*-
 10 (1-cyano-1,2-dimethylpropyl)-2-(2,4-dichlorophenoxy)propionamide (AC382042), *N*-(2-methoxy-5-pyridyl)-cyclopropane carboxamide, acibenzolar (CGA245704), alanycarb, aldimorph, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, biloxazol, bitertanol, blasticidin S, bromuconazole, bupirimate, captafol, captan, carbendazim, carbendazim
 chlorhydrate, carboxin, carpropamid, carvone, CGA41396, CGA41397, chinomethionate,
 15 chlorothalonil, chlorozolinate, clozylacon, copper containing compounds such as copper oxychloride, copper oxyquinolate, copper sulphate, copper tallate and Bordeaux mixture, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, debacarb, di-2-pyridyl disulphide 1,1'-dioxide, dichlofluanid, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, difenzoquat, diflumetorim, *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphate, dimefluazole, dimetconazole,
 20 dimethomorph, dimethirimol, diniconazole, dinocap, dithianon, dodecyl dimethyl ammonium chloride, dodemorph, dodine, doguadine, edifenphos, epoxiconazole, ethirimol, ethyl(*Z*)-*N*-benzyl-*N*[(methyl(methyl-thioethylideneaminooxycarbonyl)amino)thio]- β -alaninate, etridiazole, famoxadone, fenamidone (RPA407213), fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid (KBR2738), fencpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate,
 25 fentin hydroxide, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluoroimide, fluquinconazole, flusilazole, flutolanil, flutriafol, folpet, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, guazatine, hexaconazole, hydroxyisoxazole, hymexazole, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iminoctadine triacetate, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb (SZX0722), isopropanyl butyl carbamate, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl,
 30 LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mfenoxam, mepanipyrin, mepronil, metalaxyl, metconazole, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, myclobutanil, neoasozin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-*iso*propyl, nuarimol, ofurace, organomercury

compounds, oxadixyl, oxasulfuron, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, pefurazoate, penconazole, pencycuron, phenazin oxide, phosetyl-Al, phosphorus acids, phthalide, picoxystrobin (ZA1963), polyoxin D, polyram, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propiconazole, propineb, propionic acid, pyrazophos, pyrifenoxy, pyrimethanil, 5 pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, quaternary ammonium compounds, quinomethionate, quinoxifen, quintozone, sipconazole (F-155), sodium pentachlorophenate, spiroxamine, streptomycin, sulphur, tebuconazole, tecloftalam, tecnazene, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamid, 2-(thiocyanomethylthio)benzothiazole, thiophanate-methyl, thiram, timibenconazole, tolclofos-methyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutyl, 10 triazoxide, tricyclazole, tridemorph, trifloxystrobin (CGA279202), triforine, triflumizole, triticonazole, validamycin A, vapam, vinclozolin, zineb and ziram.

The compounds of formula (I) may be mixed with soil, peat or other rooting media for the protection of plants against seed-borne, soil-borne or foliar fungal diseases.

Examples of suitable synergists for use in the compositions include piperonyl 15 butoxide, sesamex, safroxan and dodecyl imidazole.

Suitable herbicides and plant-growth regulators for inclusion in the compositions will depend upon the intended target and the effect required.

An example of a rice selective herbicide which may be included is propanil. An example of a plant growth regulator for use in cotton is PIX™.

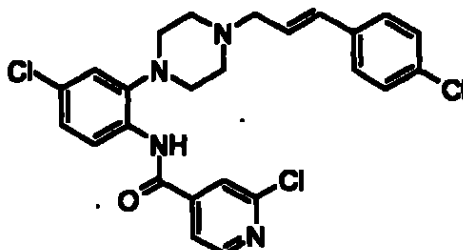
20 Some mixtures may comprise active ingredients which have significantly different physical, chemical or biological properties such that they do not easily lend themselves to the same conventional formulation type. In these circumstances other formulation types may be prepared. For example, where one active ingredient is a water insoluble solid and the other a water insoluble liquid, it may nevertheless be possible to disperse each active ingredient in 25 the same continuous aqueous phase by dispersing the solid active ingredient as a suspension (using a preparation analogous to that of an SC) but dispersing the liquid active ingredient as an emulsion (using a preparation analogous to that of an EW). The resultant composition is a suspoemulsion (SE) formulation.

The invention is illustrated by the following Examples:

Mass spectra data were obtained for selected compounds of the following examples using LCMS: LC5: 254nm - gradient 10% A to 100% B A=H₂O+0.01%HCOOH B=CH₃CN/CH₃OH+0.01%HCOOH positive electrospray 150-1000 m/z.

EXAMPLE 1

- 5 This Example illustrates the preparation of 2-chloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide.



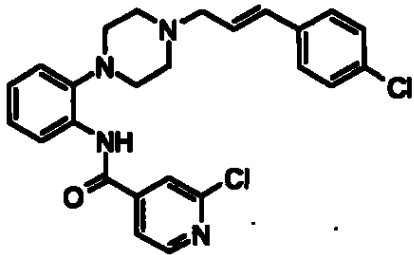
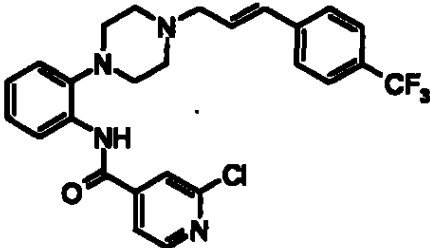
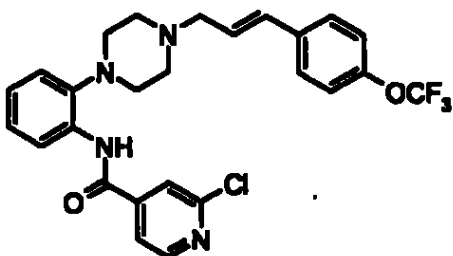
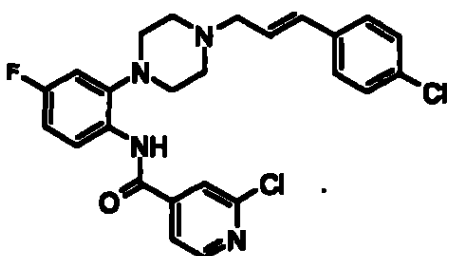
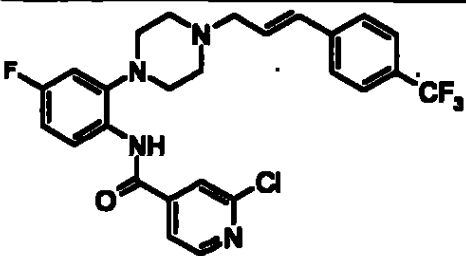
- Step A: Triethylamine (4.2 ml) was added to a stirred solution of 2,4-dichloronitrobenzene (1.9 g) and 1-t-butoxycarbonyl-piperazine (2.2 g) in dimethylsulfoxide (18 ml) under N₂. The resulting solution was stirred at 70°C for 48 hours then cooled to room temperature. Water was added and the mixture extracted three times with ethyl acetate; the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 8:2) to afford 4-(5-chloro-2-nitrophenyl)-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (2.6 g) as a foam. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (br s, 4H), 3.5 (br s, 4H), 6.9 (d, J = 10 Hz, 1H), 7.0 (s, 1H), 7.7 (d, J = 10 Hz, 1H); MS (ES+) 242/244 (M+H⁺-CO₂-isobutene), 286/288 (M+H⁺-isobutene).

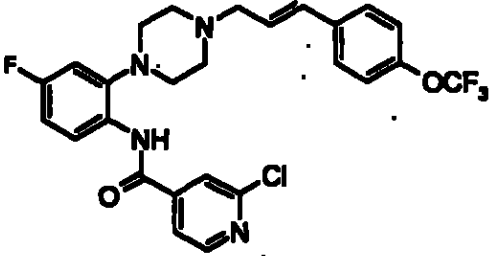
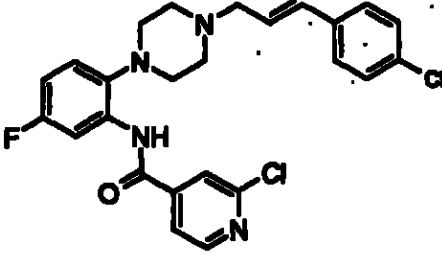
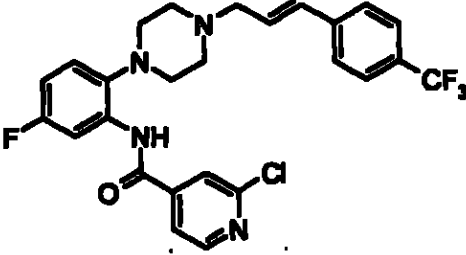
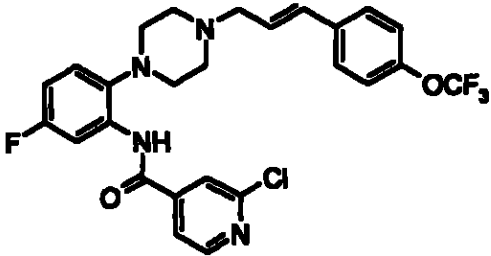
- Step B: To a stirred suspension of the compound obtained in Step A (2.5 g) in ethanol (40 ml) and water (30 ml) at 60°C was added sodium dithionite (7.6 g). The resulting mixture was stirred at 60°C for 1 hour then ethanol was removed *in vacuo*. The suspension was extracted three times with ethyl acetate, the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 1:1) to afford 4-(2-Amino-5-chloro-phenyl)-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (1.0 g) as white crystals. M.p. 125-127 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.8 (m, 4H), 3.5 (m, 4H), 3.9 (s, 2H), 6.6 (d, J = 10 Hz, 1H), 6.8 (d, J = 10 Hz, 1H), 6.9 (s, 1H); MS (ES+) 212/214 (M+H⁺-CO₂-isobutene), 256/258 (M+H⁺-isobutene), 312/314 (M+H⁺).

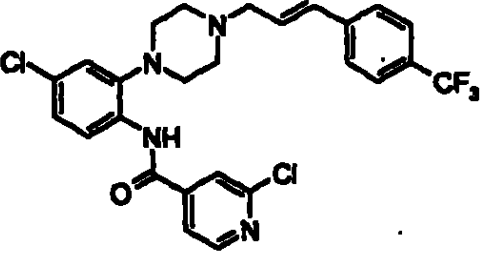
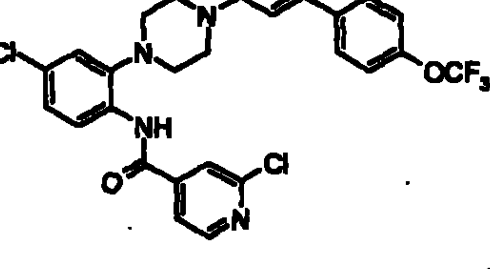
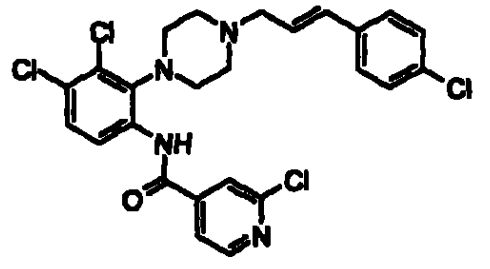
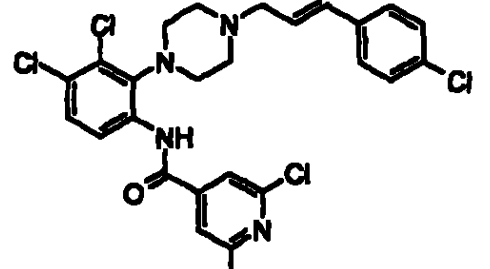
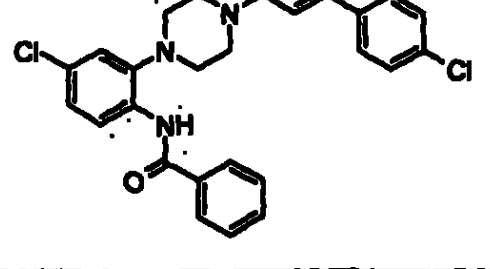
Step C: triethylamine (2 ml) was added to a stirred solution of the compound obtained in Step B (1.0 g) in dichloromethane (20 ml); the solution was cooled to 0°C and 2-chloro-isonicotinoyl chloride (1.2 g) was added. The resulting mixture was stirred at room temperature for 12 hours, poured into water, extracted two times with dichloromethane, the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 7:2) to afford 4-{5-Chloro-2-[(2-chloro-pyridine-4-carbonyl)-amino]-phenyl}-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester, which was recrystallised (845 mg) from hexane/ethyl acetate to give white crystals. M.p. 185-189 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (m, 4H), 3.7 (m, 4H), 7.2 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.2 (dd, J = 1.5, 10 Hz, 1H), 7.6 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.8 (s, 1H), 8.5 (d, J = 10 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 9.4 (s, 1H, NH); MS (ES+) 351/353 (M+H⁺-CO₂-isobutene), 395/397 (M+H⁺-isobutene), 451/453 (M+H⁺).

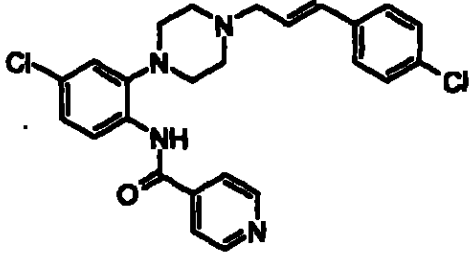
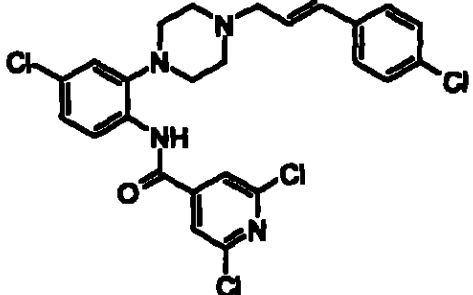
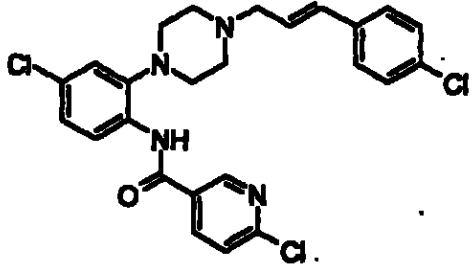
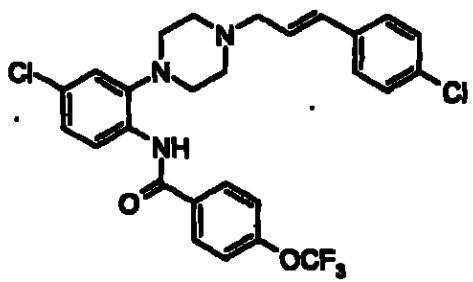
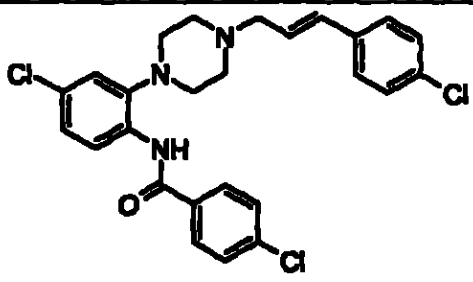
Step D: A solution of the compound obtained in Step C (200 mg) in dichloromethane (10 ml) was treated with trifluoroacetic acid (0.3 ml) for 48 hours at room temperature. The reaction mixture was basified with saturated aqueous sodium bicarbonate, extracted two times with dichloromethane, the organic layer was dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was dissolved in acetonitrile (20 ml), diisopropylethylamine (0.16 ml) and 4-chlorocinnamyl chloride (96 mg) were added. The solution was stirred 50 hours at room temperature, the solvent was removed *in vacuo* and the residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 7:2) to afford the title product (162 mg) as a yellow solid. M.p. 129-132 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1-7.3 (m, 6H), 7.6 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 8.4 (d, J = 10 Hz, 1H), 8.5 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 9.4 (s, 1H, NH); Retention Time HPLC 2.46 min; MS (ES+) 501/503/505 (M+H⁺).

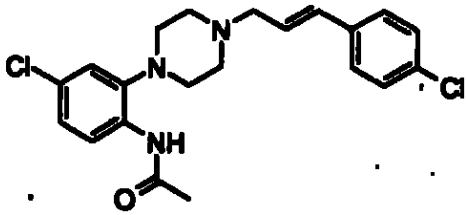
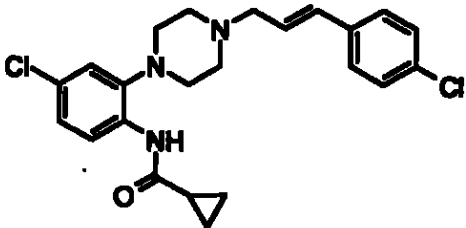
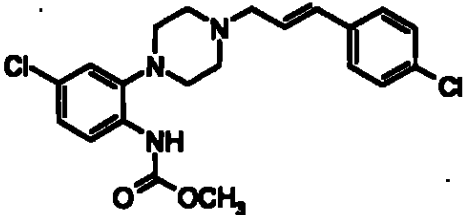
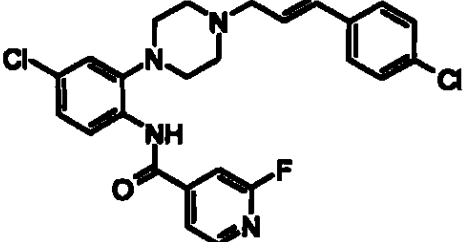
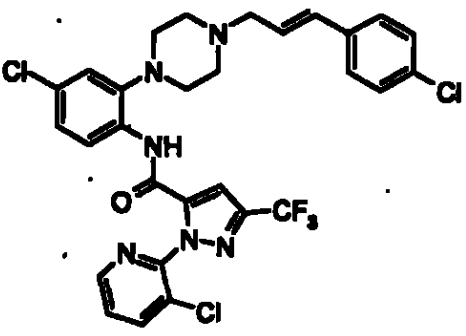
The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 1:

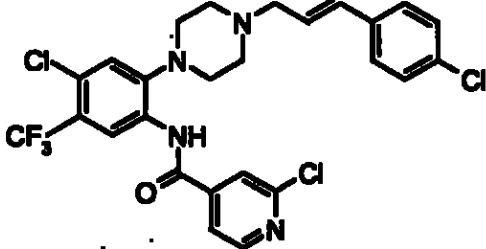
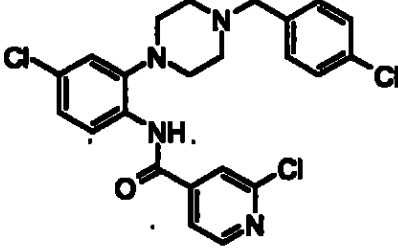
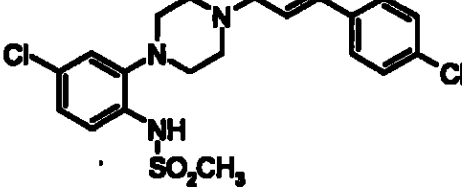
Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide			467/469	2.26
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide			501	2.32
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide			517	2.46
2-chloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		145-147	485/487	2.29
2-chloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		98-100	519	1.91

phenyl)- isonicotinamide				
2-chloro-N-(4-fluoro-2- {4-[(E)-3-(4- trifluoromethoxy- phenyl)-allyl]- piperazin-1-yl}- phenyl)- isonicotinamide		85- 89	535/537	2.44
2-chloro-N-(5-fluoro-2- {4-[(E)-3-(4-chloro- phenyl)-allyl]- piperazin-1-yl}- phenyl)- isonicotinamide		80- 83	485/487	2.28
2-chloro-N-(5-fluoro-2- {4-[(E)-3-(4- trifluoromethyl- phenyl)-allyl]- piperazin-1-yl}- phenyl)- isonicotinamide		105- 109	519	2.51
2-chloro-N-(5-fluoro-2- {4-[(E)-3-(4- trifluoromethoxy- phenyl)-allyl]- piperazin-1-yl}- phenyl)- isonicotinamide		110- 114	535	2.48

2-chloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		129-131	535/537	2.56
2-chloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		92-95	551/553	2.63
2-chloro-N-(3,4-dichloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		154-156	537/539	2.38
2,6-dichloro-N-(3,4-dichloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		178-181	571/573	2.67
N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-benzamide		79-81	466/468	2.49

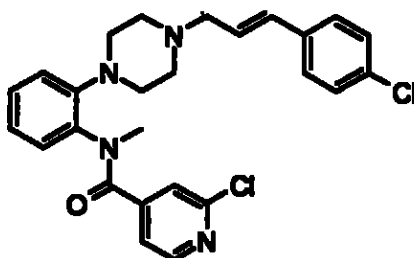
N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		152-154	467-469	2.11
2,6-dichloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		121-123	537/539	2.77
6-chloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-nicotinamide		120-123	467/469	2.10
N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-4-trifluoromethoxybenzamide		104-107	550/552	3.22
N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-4-chlorobenzamide		62-64	502/504	2.85

N-(4-chloro-2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-phenyl)-acetamide		145-148	404/406	1.95
cyclopropanecarboxylic acid (4-chloro-2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-phenyl)-amide		87-89	430/432	2.17
(4-chloro-2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-phenyl)-carbamic acid methyl ester		73-76	420/422	2.17
2-fluoro-N-(4-chloro-2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-phenyl)-isonicotinamide		162-165	485/487	2.31
2-(3-chloro-pyridin-2-yl)-5-trifluoromethyl-2H-pyrazole-3-carboxylic acid (4-chloro-2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-phenyl)-amide		97-100	637/639	2.65

2-chloro-N-(4-chloro-5-trifluoromethyl-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-isonicotinamide		135-136	569/571	2.92
2-Chloro-N-{4-chloro-2-[4-(4-chloro-benzyl)-piperazin-1-yl]-phenyl}-isonicotinamide		116-118	475/477	2.50
N-(4-Chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-methanesulfonamide		81-83	440-442	2.01

EXAMPLE 2

This Example illustrates the preparation of 2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-isonicotinamide.



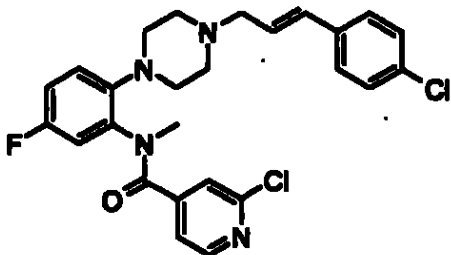
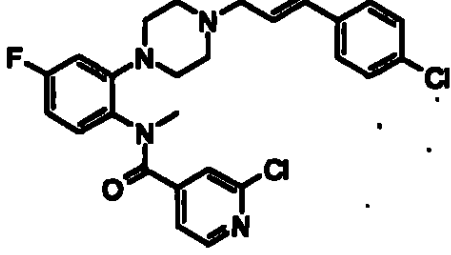
5

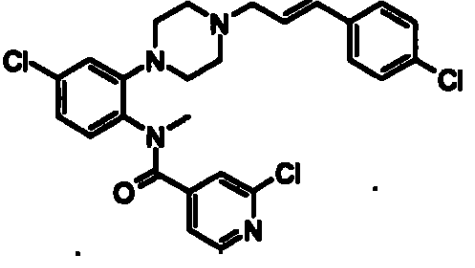
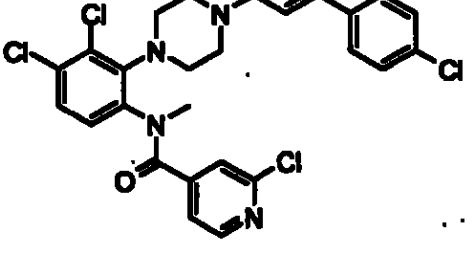
10

4-{2-[(2-chloro-pyridine-4-carbonyl)-amino]-phenyl}-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (100 mg, prepared as described in Example 1, Steps A-C) was added to a suspension of sodium hydride (50% in oil, 24 mg) in tetrahydrofuran at 0°C and the resulting mixture was stirred at 0°C for 1 hour at which time iodomethane (0.03 ml) was added. The reaction mixture was stirred at room temperature for 3 hours, diluted with ethyl acetate, washed three

times with water, dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 7:3) to afford 4-{2-[(2-Chloro-pyridine-4-carbonyl)-methyl-amino]-phenyl}-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester as white crystals. M.p. 59-61 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.2 (m, 2H), 2.8 (m, 2H), 3.4 (m, 2H), 3.4 (s, 3H), 3.5 (m, 2H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.0-7.3 (m, 4H), 8.1 (m, 1H); MS (ES+) 331 (M+H⁺-CO₂-isobutene), 375 (M+H⁺-isobutene), 431 (M+H⁺). This compound was treated according to Example 1 Step D to afford the title product as yellow crystals. M.p. 117-120 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (m, 2H), 2.5 (m, 2H), 2.6 (m, 2H), 2.9 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 3.5 (s, 3H), 3.5 (m, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.8 (d, J = 9 Hz, 1H), 6.9 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.0-7.3 (m, 6H), 8.1 (d, J = 5 Hz, 1H); retention Time HPLC 2.17 min; MS (ES+) 481/483 (M+H⁺).

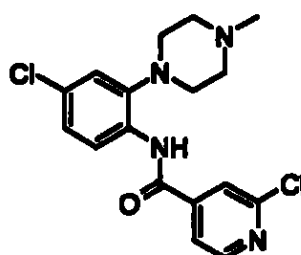
The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 2:

Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-chloro-N-(5-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-isonicotinamide		60-64	499/501	2.12
2-chloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-isonicotinamide		110-117	499/501	2.09

2-chloro-N-(4-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-isonicotinamide		130-133	517-519	2.28
2-chloro-N-(3,4-dichloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-N-methyl-isonicotinamide		112-115	551/553	2.42

EXAMPLE 3

This Example illustrates the preparation of 2-Chloro-N-[4-chloro-2-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-isonicotinamide.



5

Step A: A solution of 4-{5-chloro-2-[(2-chloro-pyridine-4-carbonyl)-amino]-phenyl}-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (6.7 g, Example 1, Step C) in dichloromethane (20 ml) was treated with trifluoroacetic acid (10 ml) for 20 hours at room temperature. Concentration of the solution under reduced pressure afforded 2-chloro-N-[4-chloro-2-(piperazin-1-yl)-phenyl]-isonicotinamide trifluoroacetate (6.9 g) as a brown solid. MS (ES+) 351/353 (M+H⁺).

10

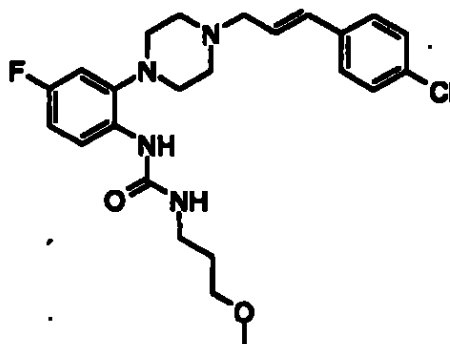
Step B: The product obtained in Step A (300 mg), formic acid (16 ml) and 37% aqueous formaldehyde (0.47 ml) were refluxed for 2 hours. The reaction mixture was diluted with water, made basic with saturated aqueous sodium bicarbonate and extracted with ethyl acetate. The organic layer was dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (ethyl acetate: methanol 8:2) to afford the

15

title product. M.p. 118-120 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (s, 3H), 2.7 (m, 2H), 3.0 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.6 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.4 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.5 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 9.4 (br s, 1H); MS (ES+) 365/367 (M+H⁺).

EXAMPLE 4

- 5 This Example illustrates the preparation of 1-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-3-(3-methoxy-propyl)-urea.

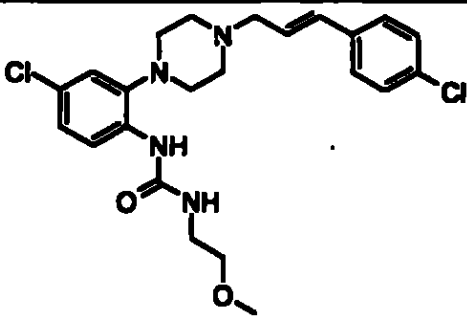
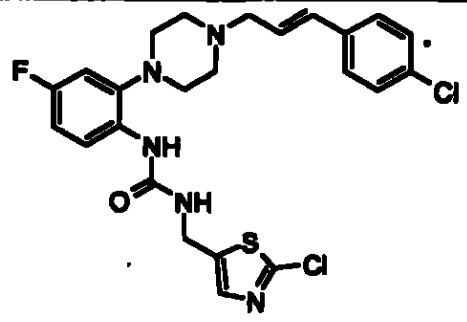


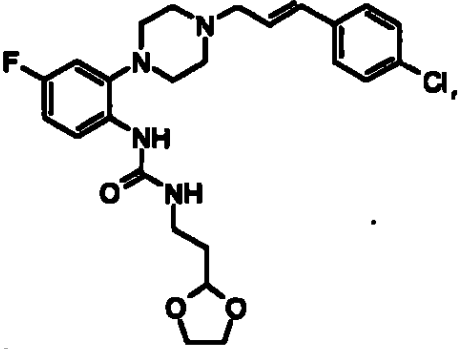
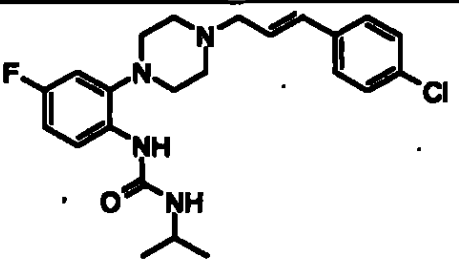
- Step A: A solution of 4-(5-fluoro-2-nitrophenyl)-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (10 g, prepared from 2,4-difluoronitrobenzene as described in Example 1, Step A) in
 10 dichloromethane (80 ml) was treated with trifluoroacetic acid (23 ml) for 24 hours at room temperature. The reaction mixture was concentrated *in vacuo*. The residue was dissolved in acetonitrile (100 ml), diisopropylethylamine (27 ml) and 4-chloro-cinnamyl chloride (6.8 g) were added. The solution was stirred for 17 hours at room temperature, the solvent was removed *in vacuo* and the residue was subjected to silica gel chromatography
 15 (cyclohexane:ethyl acetate 1:1) to afford 1-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-4-(5-fluoro-2-nitro-phenyl)-piperazine (10.5 g); ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (t, J = 8 Hz, 4H), 3.1 (t, J = 8 Hz, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.6 (dt, J = 1.0, 7.0 Hz, 1H), 6.7 (dd, J = 1.0, 10 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H), 7.8 (d, J = 7.0, 10.0 Hz, 1H); MS (ES+) 151/153, 376/378 (M+H⁺).
- 20 Step B: To a stirred suspension of the compound obtained in Step A (8.0 g) in ethanol (66 ml) and water (80 ml) at 60°C was added sodium dithionite (11 g). The resulting mixture was stirred at 60°C for 1 hour then ethanol was removed *in vacuo*. The suspension was extracted three times with ethyl acetate, the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was filtered on silica gel (eluent ethyl acetate) to
 25 afford 1-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-4-(5-fluoro-2-amino-phenyl)-piperazine (4.1 g). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.6 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.7 (m, 2H), 6.2

(dt, $J = 18, 9$ Hz, 1H), 6.5 (d, $J = 18$ Hz, 1H), 6.6 (m, 2H), 6.7 (d, $J = 10$ Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H); MS (ES+) 151/153, 346/348 ($M+H^+$).

- Step C: To a stirred solution of di-tert-butyl carbonate (266 mg) in dichloromethane (4 ml) under nitrogen was added 4-dimethylaminopyridine (106 mg) in dichloromethane (4 ml) followed by the product obtained in Step B (300 mg). The solution was stirred at room temperature until gas evolution ceased. 3-Methoxypropylamine (155 mg) dissolved in dichloromethane (4 ml) was then added dropwise and the resulting solution stirred at room temperature for 1 hour. The solvent was removed under reduced pressure and the residue purified by silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 1:9) to afford the title product (210 mg). M.p. 86-90 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.8 (quint, $J = 7$ Hz, 2H), 2.6 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, $J = 9$ Hz, 2H), 3.2 (s, 3H), 3.3 (q, $J = 7$ Hz, 2H), 3.4 (t, $J = 7$ Hz, 2H), 5.3 (m, 1H), 6.2 (dt, $J = 18, 9$ Hz, 1H), 6.5 (d, $J = 18$ Hz, 1H), 6.8 (m, 2H), 6.9 (s, 1H), 7.2-7.3 (m, 6H), 7.7 (m, 1H); Retention Time HPLC 1.93; MS (ES+) 372/374, 461/463 ($M+H^+$).

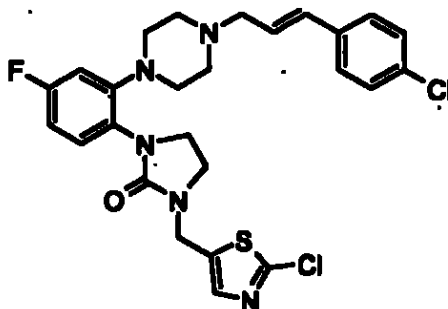
- The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 4:

Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH^+	Retention Time (min)
1-(4-Chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-phenyl)-3-(2-methoxy-ethyl)-urea		178	463/465	1.97
1-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-3-(2-chloro-thiazol-5-ylmethyl)-urea		94-98	520/522	2.12

1-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-3-(2-[1,3]dioxolan-2-yl-ethyl)-urea		76-80	489	2.02
1-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-3-isopropyl-urea		162-166	431	2.08

EXAMPLE 5

This Example illustrates the preparation of 1-(2-{4-[(E)-3-(4-Chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-3-(2-chloro-thiazol-5-ylmethyl)-imidazolidin-2-one.



5

Step A: To a solution of 1-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-4-(5-fluoro-2-amino-phenyl)-piperazine (1.0 g, Example 3, Step B) in tetrahydrofuran (10 ml) at 0°C was added 2-chloroethylisocyanate (327 mg) and the resulting solution was stirred under nitrogen at room temperature for 18 hours. The residue was dissolved in a minimum volume of

10

tetrahydrofuran, then added to a suspension of sodium hydride (146 mg, 50% in oil) in tetrahydrofuran (10 ml). The reaction mixture was stirred at room temperature for 3 hours, concentrated under reduced pressure, then triturated with diethyl ether to afford 1-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-fluoro-phenyl)-imidazolidin-2-one (677 mg) as white crystals. M.p. 170-172°C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.11 (m, 4H), 3.26 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 3.63 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.99 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 5.12 (br s, 1H), 6.32 (dt,

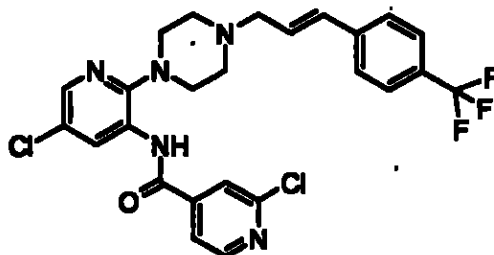
15

J = 15.6, 6.8 Hz, 1H), 6.57 (d, J = 15.6 Hz, 1H), 6.82 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 4H); MS (ES+) 415/417 (M+H⁺).

Step B: The product obtained in Step A (250 mg) dissolved in dimethylacetamide (4 ml) was added to a suspension of sodium hydride (50% in oil, 29 mg) in dimethylacetamide (4 ml) at 0°C and the resulting mixture was stirred at 0°C for 30 min at which time C-(2-chloro-thiazol-5-yl)-methylamine (102 mg) dissolved in dimethylacetamide (4 ml) was added. The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 hours, quenched by addition of water, extracted with ethyl acetate (three times), dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 1:9) to afford the title product as a yellow solid. M.p. 72-77 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.0 (m, 4H), 3.2 (d, J = 7 Hz, 2H), 3.35 (t, J = 6 Hz, 2H), 3.8 (t, J = 6 Hz, 2H), 4.5 (s, 2H), 6.3 (dt, J = 16, 7 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 16 Hz, 1H), 6.8 (m, 2H), 7.2-7.3 (m, 4H), 7.4 (s, 1H); MS (ES+) 546/548 (M+H⁺).

EXAMPLE 6

This Example illustrates the preparation of 2-chloro-N-(5-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyridin-3-yl)-isonicotinamide.



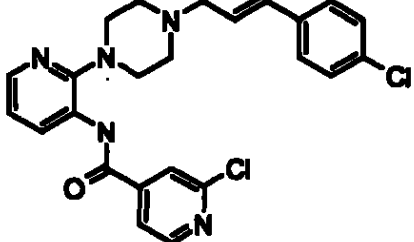
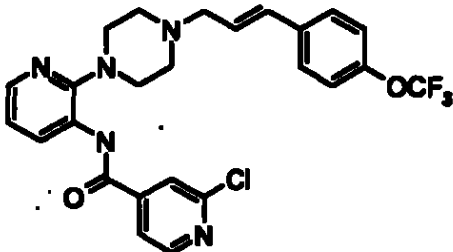
Step A: Piperazine (1.38 g) was added to a stirred solution of 2,6-dichloro-3-nitropyridine (3.0 g, prepared according to *J. Heterocyclic Chem.* 1994, 31, 73) and diisopropylethylamine (3.0 ml) in dichloromethane (100 ml) at 0°C under N₂. The resulting solution was stirred at room temperature for 2 hours then poured into saturated aqueous sodium bicarbonate, extracted with dichloromethane, dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (ethyl acetate:methanol 8:2) to afford 1-(6-Chloro-3-nitro-pyridin-2-yl)-piperazine (2.99 g) as a red solid. M.p. 50-53°C; MS (ES+) 243/245 (M+H⁺).

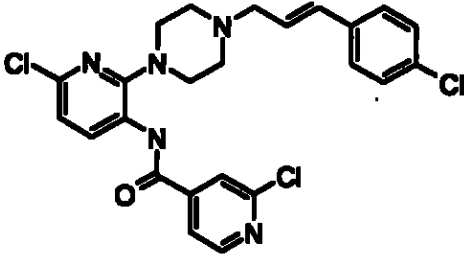
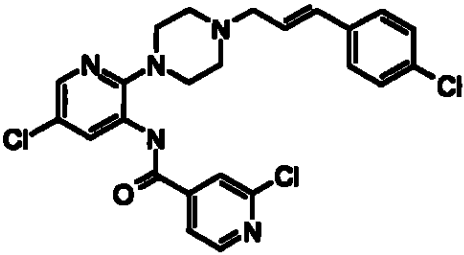
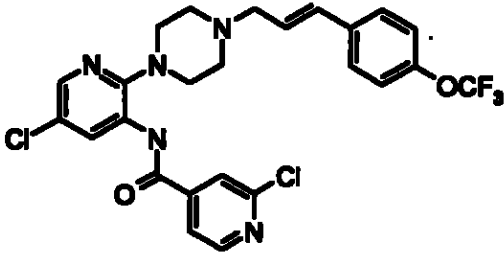
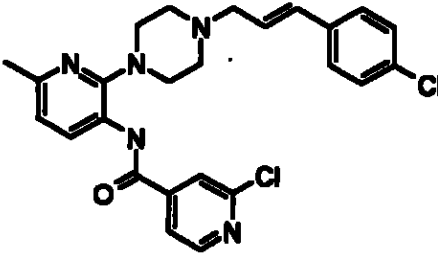
Step B: The product obtained in Step A (800 mg) was dissolved in acetonitrile (320 ml), diisopropylethylamine (1.2 ml) and 4-trifluoromethylcinnamyl chloride (728 mg) were added. The solution was stirred at room temperature for 24 hours, the solvent was removed

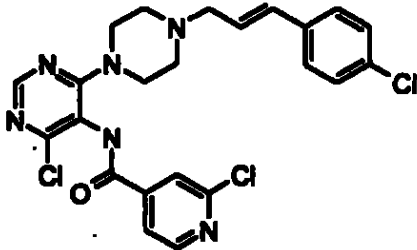
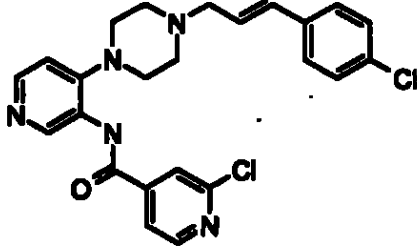
in vacuo and the residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 7:3) to afford 1-(5-Chloro-3-nitro-pyridin-2-yl)-4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazine (0.79 g) as a yellow foam. M.p. 129-132 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.3 (d, J = 9 Hz, 1H), 3.5 (m, 4H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.4 (m, 4H), 8.2 (d, J = 2 Hz, 1H), 8.3 (d, J = 2 Hz, 1H); MS (ES+) 427/429 (M+H⁺).

Step C: The product obtained in Step B (435 mg) was reduced and acylated as described in Example 1 Step B and C to afford after silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 7:3) the title product (185 mg). M.p. 156-159 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.1 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.4 (d, J = 9 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 9 Hz, 2H), 7.5 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.6 (s, 1H), 8.0 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 5 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.8 (s, 1H, NH); HPLC Retention Time 2.12 min; MS (ES+) 536/538 (M+H⁺).

The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 6:

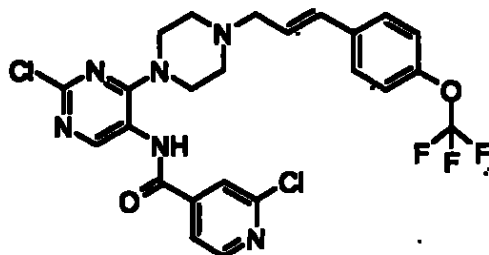
Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyridin-3-yl)-isonicotinamide		106-109	468/470	2.05
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyridin-3-yl)-isonicotinamide			518/520	2.19

2-chloro-N-(6-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)allyl]piperazin-1-yl}pyridin-3-yl)isonicotinamide		70-73	502/504	2.16
2-chloro-N-(5-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)allyl]piperazin-1-yl}pyridin-3-yl)isonicotinamide		127-129	502/504	2.29
2-chloro-N-(5-chloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxyphenyl)allyl]piperazin-1-yl}pyridin-3-yl)isonicotinamide		115-117	552/554	2.40
2-chloro-N-(6-methyl-2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)allyl]piperazin-1-yl}pyridin-3-yl)isonicotinamide		67-70	482/484	2.44

2-Chloro-N-(4-chloro-6-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyrimidin-5-yl)-isonicotinamide		84-87	503/505	2.48
2-Chloro-N-(4-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyridin-3-yl)-isonicotinamide		77-79	468/470	1.99

EXAMPLE 7

This Example illustrates the preparation of 2-chloro-N-(2-chloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyrimidin-5-yl)-isonicotinamide.



5

1-t-Butoxycarbonyl-piperazine (2.36 g) was condensed with 2,4-dichloro-pyrimidin-5-ylamine (2.0 g) in dimethylsulfoxide (20 ml) in the presence of triethylamine (5.3 ml) according to the method described in Example 1, Step A. 4-(5-Amino-2-chloro-pyrimidin-4-yl)-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (3.4 g) was obtained as violet crystals. MS (ES+) 314/316 (M+H⁺). The title product (120 mg) was obtained from this intermediate according to the methods described in Example 1, step C and D. 2-Chloro-N-(2-chloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethoxy-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyrimidin-5-yl)-isonicotinamide. M.p. 210-211 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.5 (m, 4H), 3.1 (d, J = 9 Hz, 1H), 3.6 (m, 4H), 6.1 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.4 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1 (d, J = 11 Hz, 2H), 7.3 (d, J = 11

10

Hz, 2H), 7.6 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 7.8 (s, 1H, NH), 8.4 (s, 1H), 8.5 (d, J = 5 Hz, 1H); MS (ES⁺) 553/555 (M+H⁺).

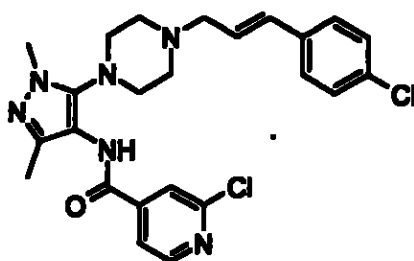
The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 7:

Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-chloro-N-(2-chloro-4-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyrimidin-5-yl)-isonicotinamide		187-189	503/505	2.09
2-chloro-N-(2-chloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluoromethyl-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-pyrimidin-5-yl)-isonicotinamide		169-173	537/539	2.21

5

EXAMPLE 8

This Example illustrates the preparation of 2-Chloro-N-(5-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-yl)-isonicotinamide.



10

Step A: A solution of N-BOC-piperazine (4.3 g) and triethylamine (9 ml) in dimethylsulfoxide (40 ml) at 0°C under nitrogen was treated with 4-chlorocinnamyl chloride

(5 g) and the resulting solution was stirred at room temperature for 18 hours, poured into water, extracted with ethyl acetate (three times), dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was filtered over silica gel to afford crude 4-[(E)-3-(4-Chloro-phenyl)-allyl]-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester. This compound was dissolved in
5 dichloromethane (30 ml) and treated with trifluoroacetic acid (10 ml) at room temperature for 18 hours. Concentration afforded 1-[(E)-3-(4-Chloro-phenyl)-allyl]-piperazine (5.8 g), which was characterised by its mass and NMR spectra. MS (ES+) 151/153 (M-piperazine), 237/239 (M+H⁺).

Step B: The product obtained in Step A (3.1 g) was condensed with 5-Chloro-1,3-dimethyl-
10 4-nitro-1H-pyrazole (1.5 g) in dimethylsulfoxide (20 ml) in the presence of triethylamine (3.4 ml) as described in Example 1, Step A to afford 1-[(E)-3-(4-Chloro-phenyl)-allyl]-4-(2,5-dimethyl-4-nitro-2H-pyrazol-3-yl)-piperazine (1.82 g) as a brown solid. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (s, 3H), 2.6 (m, 4H), 3.2 (m, 6H), 3.7 (s, 3H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H); MS (ES+) 151/153, 376/378 (M+H⁺).

Step C: To a solution of the product obtained in Step B (800 mg) in tetrahydrofuran (8 ml) and methanol (8 ml) at room temperature under nitrogen was added tin(II)chloride monohydrate (2.9 g) and sodium acetate trihydrate (3.5 g). The resulting mixture was stirred at room temperature for 34 hours. The reaction mixture was partitioned between 1M sodium hydroxide and ethyl acetate, stirred for 10 min, the organic layer was separated, dried over
20 sodium sulfate and concentrated. 1-[(E)-3-(4-Chlorophenyl)-allyl]-4-(2,5-dimethyl-4-amino-2H-pyrazol-3-yl)-piperazine (510 mg) was obtained as a red solid. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.3 (s, 3H), 2.8 (m, 4H), 3.3 (m, 4H), 3.4 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.8 (s, 3H), 6.4 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.7 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 4H); MS (ES+) 151/153 (cinnamyl), 196(M-cinnamyl), 346/348 (M+H⁺).

Step D: triethylamine (0.46 ml) was added to a stirred solution of the compound obtained in
25 Step C (250 mg) in dichloromethane (10 ml); the solution was cooled to 0°C and 2-chloro-isonicotinoyl chloride (250 mg) was added. The resulting mixture was stirred at room temperature for 12 hours, poured into water, extracted two times with dichloromethane, the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The
30 residue was subjected to silica gel chromatography (ethyl acetate:ethanol 9:5) to afford the title compound (158 mg). M.p. 85-88 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.0 (s, 3H), 2.52 (br s, 4H), 3.05 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.1 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 3.58 (s, 3H), 6.13 (dt, J = 15.6, 6.8 Hz,

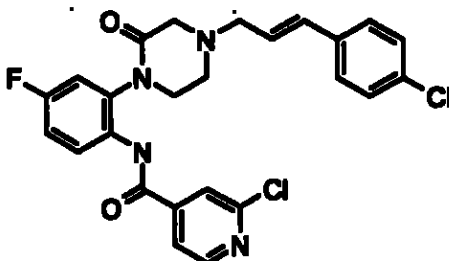
1H), 6.40 (d, J = 15.6 Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.55 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.49 (d, J = 5.2 Hz, 1H); Retention Time LCMS 2.26 min; MS (ES+) 485/487 (M+H⁺).

The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 8:

Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-Chloro-N-(2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl)-6-methoxy-pyridin-3-yl)-isonicotinamide		65-69	498/500	2.39

EXAMPLE 9

This Example illustrates the preparation of 2-Chloro-N-(2-(4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-2-oxo-piperazin-1-yl)-4-fluoro-phenyl)-isonicotinamide.



10

Step A: Piperazinone was prepared according to the method described in US6433134: ethyl chloroformate (10 g) in ethanol (50 ml) was added dropwise to a solution of ethylene diamine (32.85 ml) in ethanol (150 ml) at room temperature under nitrogen. The resulting solution was stirred at room temperature for 48 hrs, then treated dropwise over 30 min with a freshly prepared solution of sodium ethanolate in ethanol (prepared from 1.9 g sodium and 90 ml ethanol). The solution was stirred at room temperature for 2 hours, filtered on Hyflo (rinsed with ethanol), then the solvent and the excess diamine were removed in vacuo. The oily residue was refluxed in toluene (400 ml) for 3 hours, the toluene layer decanted and

15

separated from the remaining oil; the toluene layer was kept at 0°C overnight and the solid collected by filtration to afford piperazinone (3.6 g). M.p. 108-109°C.

Step B: Piperazinone (3.6 g) was dissolved in acetonitrile (100 ml) then treated with diisopropylethylamine (9 ml) and 4-chlorocinnamyl chloride (6.7 g). The resulting reaction mixture was stirred at room temperature under nitrogen for 48 hours. The white precipitate was collected by filtration, washed with cold acetonitrile and dried under vacuum (white solid, 4.35 g). The filtrate was concentrated *in vacuo* and the residue crystallized from acetonitrile (white crystals, 1.4 g). M.p. 129-130°C. Both fractions showed satisfactory analytical data: N-4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-2-one. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.63 (t, J = 5 Hz, 2H), 3.12 (s, 2H), 3.15 (d, J = 7 Hz, 2H), 3.32 (m, 2H), 6.1 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H).

Step C: To a solution of the product obtained in Step B (2.51 g) in dimethylformamide (50 ml) at room temperature under nitrogen was added potassium carbonate (3.45 g) and 2,4-difluoronitrobenzene (1.59 g). The resulting mixture was stirred at 100°C for 24 hours. Potassium carbonate (1.4 g) and 2,4-difluoronitrobenzene (1.4 g) were added again and the resulting mixture stirred at 110°C for 48 hours. The reaction mixture was cooled to room temperature, poured into water, extracted three times with ethyl acetate; the combined organic layers were washed with brine, dried (Na₂SO₄) and concentrated *in vacuo*. Column chromatography (cyclohexane/ethyl acetate 6:4) afforded 4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-1-(5-fluoro-2-nitro-phenyl)-piperazin-2-one (1.9 g) as a brown solid. M. p. 57°C; MS (ES+) 151/153 (cinnamyl), 390/392 (M+H⁺).

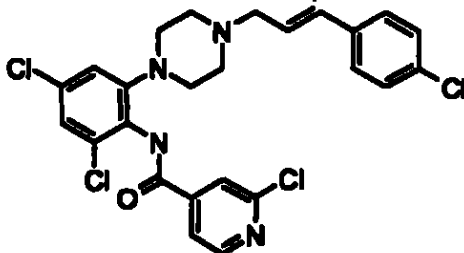
Step D: Raney nickel (50% slurry in water, 200 mg) was added to a solution of the compound obtained in Step C (389 mg) in ethanol (10 ml); hydrazine hydrate (0.5 ml) was added and the reaction mixture was stirred at room temperature until gas evolution ceased (1 hour). The reaction mixture was filtered over Hyflo, the solvent removed *in vacuo* and the residue purified by column chromatography (2.5% methanol in ethyl acetate) to afford 1-(2-Amino-5-fluoro-phenyl)-4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-2-one (162 mg). Retention Time LCMS 2.81 min; MS (ES+) 360/362 (M+H⁺).

Step E: triethylamine (0.14 ml) was added to a stirred solution of the compound obtained in Step D (140 mg) in dichloromethane (10 ml); the solution was cooled to 0°C and 2-chloro-isonicotinoyl chloride (200 mg) was added. The resulting mixture was stirred at room

temperature for 3 hours, poured into water, extracted two times with dichloromethane, the combined organic layers were dried over sodium sulfate and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (ethyl acetate:cyclohexane 1:1) to afford the title compound as a white powder (130 mg). M.p. 75-77 °C; Retention Time LCMS 3.46 min; MS (ES+) 150/152, 499/501 (M+H⁺).

EXAMPLE 10

This Example illustrates the preparation of 2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chloro-phenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4,6-dichloro-phenyl)-isonicotinamide.



Step A: A solution of 1,3,5-trichloronitrobenzene (800 mg) and 1-t-butoxycarbonyl-piperazine (790 mg) in toluene (20 ml) was stirred at 80 °C under N₂ for 15 hours. The reaction mixture was cooled to room temperature, partitioned between water and ethyl acetate, the organic layer was dried (Na₂SO₄) and concentrated *in vacuo*. The residue was subjected to silica gel chromatography (cyclohexane:ethyl acetate 8:2) to afford 4-(3,5-dichloro-2-nitrophenyl)-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (0.37 g). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (m, 4H), 3.5 (m, 4H), 7.0 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 2 Hz, 1H); Retention Time HPLC 2.33 min; MS (ES+) 276/278 (M-BOC), 317/319 (M-isoprene).

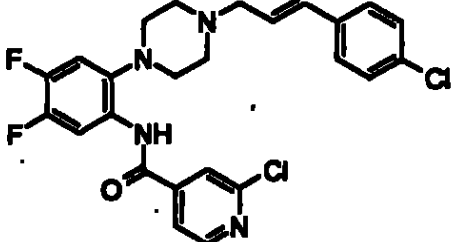
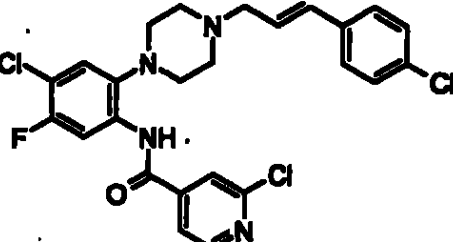
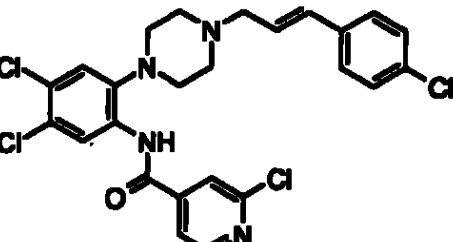
Step B: The product obtained in Step A (200 mg) was reduced with tin chloride then acylated with 2-chloroisonicotinoyl chloride as described in example 8, step C and D to afford 4-{2-[(2-Chloro-pyridine-4-carbonyl)-amino]-3,5-dichloro-phenyl}-piperazine-1-carboxylic acid tert-butyl ester (1.04 g). Retention Time HPLC 2.05 min; MS (ES+) 431/433, 485/487/489 (MH⁺).

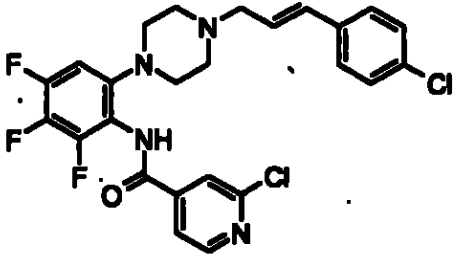
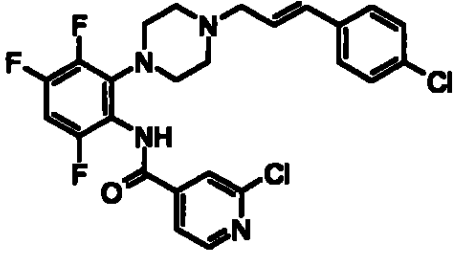
Step C: A solution of the compound obtained in Step C (0.08 g) in dichloromethane (1 ml) was treated with trifluoroacetic acid (0.1 ml) for 24 hours at room temperature. The reaction mixture was concentrated *in vacuo*. The residue was dissolved in acetonitrile (1 ml), diisopropylethylamine (0.15 ml) and 4-chlorocinnamyl chloride (0.05 g) were added. The solution was stirred 24 hours at room temperature, the solvent was removed *in vacuo* and the residue was subjected to silica gel chromatography to afford the title product (66 mg) as a

solid. M.p. 79-80 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.37 (m, 4H), 2.6 (m, 4H), 3.1 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.9 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 5H), 7.5 (s, 1H, NH), 7.6 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.5 (d, J = 5.5 Hz, 1H); Retention Time HPLC 1.44 min; MS (ES+) 535/537/539 (M+H⁺).

5

The following compounds were prepared according to procedures analogous to those described in Example 10:

Compound Name	Structure	M.p (°C)	MH ⁺	Retention Time (min)
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4,5-difluorophenyl)-isonicotinamide		55-58	503-505	1.62
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4-chloro-5-fluorophenyl)-isonicotinamide		122-123	519	1.52
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4,5-dichlorophenyl)-isonicotinamide		154-155	535/537/539	1.57

2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-4,5,6-trifluorophenyl)-isonicotinamide		94-96	521/523	1.39
2-chloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-chlorophenyl)-allyl]-piperazin-1-yl}-3,4,6-trifluorophenyl)-isonicotinamide		80-82	521/523	1.36

EXAMPLE 11

This Example illustrates the pesticidal/insecticidal properties of compounds of formula (I).

Test against were performed as follows:

5 ***Spodoptera littoralis* (Egyptian cotton leafworm)**

Cotton leaf discs were placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. After drying, the leaf discs were infested with 5 L₁ larvae. The samples were checked for mortality, repellent effect, feeding behaviour, and growth regulation 3 days after treatment (DAT). The following compounds gave at least 80%

10 **control of *Spodoptera littoralis*:**

I-3, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-75, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, II-49, III-49, V-49, XII-49, XIV-26, XV-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94, XXV-26 and XXV-49.

***Heliothis virescens* (Tobacco budworm):**

- 15 Eggs (0-24 h old) were placed in 24-well microtiter plate on artificial diet and treated with test solutions at an application rate of 200 ppm by pipetting. After an incubation period of 4 days, samples were checked for egg mortality, larval mortality, and growth regulation. The following compounds gave at least 80% control of *Heliothis virescens*:

I-3, I-6, I-7, I-26, I-29, I-30, I-47, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, III-49, V-49, XII-49, XIV-26, XIV-49, XV-26, XVI-26, XVII-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94, XXV-2, XXV-26, XXV-49 and XXV-68.

Plutella xylostella (Diamond back moth):

- 5 24-well microtiter plate (MTP) with artificial diet was treated with test solutions at an application rate of 18.2 ppm by pipetting. After drying, the MTP's were infested with larvae (L2)(10-15 per well). After an incubation period of 5 days, samples were checked for larval mortality, antifeedant and growth regulation. The following compounds gave at least 80% control of *Plutella xylostella*:

- 10 I-26, I-29, I-30, I-49, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, V-49, IX-49, XII-49, XIV-26, XV-26, XXIV-46, XXIV-90 and XXV-26.

Aedes aegypti (Yellow fever mosquito):

- 10-15 *Aedes* larvae (L2) together with a nutrition mixture are placed in 96-well microtiter plates. Test solutions at an application rate of 2ppm are pipetted into the wells. 2 days later, insects were checked for mortality and growth inhibition. The following compounds gave at least 80% control of *Aedes aegypti*

I-3, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, I-76, III-49, III-118, XIV-26, XV-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94 and XXV-68.

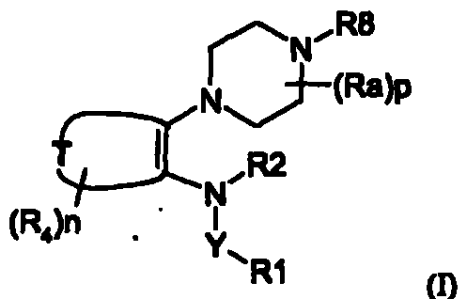
Myzus persicae (Green peach aphid):

- 20 Sunflower leaf discs were placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. After drying, the leaf discs were infested with an aphid population of mixed ages. After an incubation period of 6 DAT, samples were checked for mortality. The following compounds gave at least 80% control of *Myzus persicae*:

- 25 I-3, I-26, I-29, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, III-49, V-49, XXIV-46, XXIV-90 and XXIV-94.

CLAIMS

1. A method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I.



Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2;
the ring



is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

R¹ is hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted alkylcarbonyl, aminocarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heterocyclyloxy, cyano, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted cycloalkenyl, formyl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkylthio, NO or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, COR¹⁵, optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl or R¹³ and R¹⁴ together with the N atom to which they are attached form a group -N=C(R¹⁶)-NR¹⁷R¹⁸ or R¹³ and R¹⁴ together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O,

N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₆ alkyl groups; R¹⁵ is H, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy or NR¹⁹R²⁰; R¹⁶, R¹⁷ and R¹⁸ are each independently H or lower alkyl; R¹⁹ and R²⁰ are independently optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl;

R² is H or optionally substituted alkyl; or R¹ and R² together with the groups Y and N form a 5- or 6-membered heterocyclic ring which may optionally contain one further heteroatom selected from O, N or S and which may be optionally substituted by C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl or halogen;

each R⁴ is independently halogen, nitro, cyano, optionally substituted C₁₋₄ alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C₃₋₇ cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio or R²¹R²²N where R²¹ and R²² are, independently, hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, C₃₋₆ alkynyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl or R²¹ and R²² together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₆ alkyl groups, or 2 adjacent groups R⁴ together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6, or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen; n is 0, 1, 2, 3 or 4;

R⁸ is optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl or optionally substituted alkenylcarbonyl;

each R_a is independently halogen, hydroxy, cyano, optionally substituted C_{1-8} alkyl, optionally substituted C_{2-6} alkenyl, optionally substituted C_{2-6} alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C_{3-7} cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio, optionally substituted arylthio or $R^{23}R^{24}N$ where R^{23} and R^{24} are, independently, hydrogen, C_{1-8} alkyl, C_{3-7} cycloalkyl, C_{3-6} alkenyl, C_{3-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{2-6} haloalkyl, C_{1-6} alkoxy(C_{1-6})alkyl, C_{1-6} alkoxycarbonyl or R^{23} and R^{24} together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C_{1-6} alkyl groups, or two R_a groups attached to the same carbon atom are $=O$, $=S$, $=NR_b$, $=CR_cR_d$ where R_b , R_c and R_d are independently H or optionally substituted alkyl; p is 0, 1, 2, 3 or 4 or salts or N-oxides thereof.

2. A method according to claim 1 wherein the ring



is a 6-membered aromatic ring or is 5 or 6 membered heteroaromatic ring wherein the ring members are each independently CH, S, N, NR^4 , O, or CR^4 provided that at least one ring member is other than CH or CR^4 and that there are no more than one O or S atoms present in the ring.

3. A method according to claim 1 or claim 2 wherein Y is a single bond, $C=O$ or $C=S$.

4. A method according to any preceding claim wherein R^1 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} cyanoalkyl, C_{1-6} haloalkyl, C_{3-7} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, C_{1-6} alkoxy(C_{1-6})alkyl, heteroaryl(C_{1-6})alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} haloalkyl, C_{1-6} alkoxy, C_{1-6} haloalkoxy, C_{1-6}

alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, C₁₋₆
 alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system
 may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself
 optionally substituted with halogen), aryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group may be
 5 optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆
 haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆
 alkoxy carbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on
 the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or
 heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆
 10 alkylcarbonylamino(C₁₋₆)alkyl, aryl (which may be optionally substituted by halo,
 nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆
 alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, C₁₋₆
 alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may
 be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself
 15 optionally substituted with halogen), heteroaryl (which may be optionally substituted
 by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆
 alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, C₁₋₆
 alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system
 may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself
 20 optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (wherein
 the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄
 haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino),
 heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl,
 C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heterocyclyloxy (optionally substituted by halo, C₁₋₆
 25 alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), cyano, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆
 alkynyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₇ cycloalkenyl, heterocyclyl (optionally substituted by
 halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₆
 alkylthio, C₁₋₆ haloalkylthio or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently
 hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, phenyl (which may be
 30 optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄
 haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino or C₁₋₄ alkoxy carbonyl),
 phenyl (C₁₋₆)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by

halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen) or heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₄ alkoxycarbonyl C₁₋₆ alkylcarbonylamino, phenyloxycarbonylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), amino, C₁₋₆ alkylamino or phenylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino)).

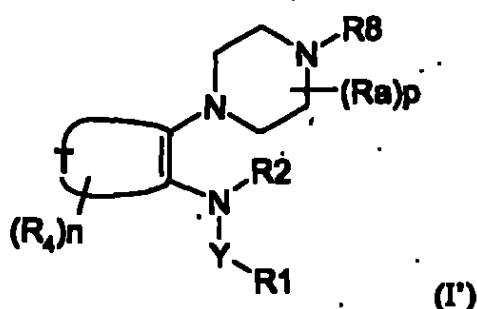
5. A method according to any preceding claim wherein R² is hydrogen, hydroxy, C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl.
6. A method according to any preceding claim wherein each R⁴ is independently halogen, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ cyanoalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkenyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkenyloxy(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkynyloxy(C₁₋₆)alkyl, aryloxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ carboxyalkyl, C₁₋₆ alkylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkenylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₂₋₆ alkynylcarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkenyloxycarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ alkynyloxycarbonyl(C₁₋₆)alkyl, aryloxycarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylthio(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl(C₁₋₆)alkyl, aminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl(C₁₋₆)alkyl, phenyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino

- or dialkylamino), heteroaryl(C₁₋₄)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heterocyclyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the heterocyclyl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₂₋₆ alkenyl, aminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkenyl, phenyl(C₂₋₄)-alkenyl, (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), C₂₋₆ alkynyl, trimethylsilyl(C₂₋₆)alkynyl, aminocarbonyl(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkynyl, di(C₁₋₆)alkylaminocarbonyl(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₇ halocycloalkyl, C₃₋₇ cyanocycloalkyl, C₁₋₃ alkyl(C₃₋₇)-cycloalkyl, C₁₋₃ alkyl(C₃₋₇)halocycloalkyl, phenyl (optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heterocyclyl (wherein the heterocyclyl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), or 2 adjacent groups R⁴ together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₆ alkylthio or R¹⁹R²⁰N where R¹⁹ and R²⁰ are, independently, hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, C₃₋₆ alkynyl, C₂₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl or R¹⁹ and R²⁰ together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₆ alkyl groups; n is 0, 1, 2 or 3.
7. A method according to any preceding claim wherein R⁸ is C₁₋₁₀ alkyl, C₁₋₁₀ haloalkyl, aryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or

dialkylamino), heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), arylcarbonyl-(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino and the alkyl group may be optionally substituted by aryl), C₂₋₈ alkenyl, C₂₋₈ haloalkenyl, aryl(C₂₋₆)-alkenyl (wherein the aryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), heteroaryl(C₂₋₆)-alkenyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), C₂₋₆ alkynyl, phenyl(C₂₋₆)alkynyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), C₃₋₇ cycloalkyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonyl, C₁₋₆ haloalkylcarbonyl or aryl(C₂₋₆)alkenylcarbonyl (wherein the aryl group may be optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), or -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]₂-R⁵⁵ where z is 1 or 2, R⁵¹ and R⁵² are each independently H, halo or C₁₋₂ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.

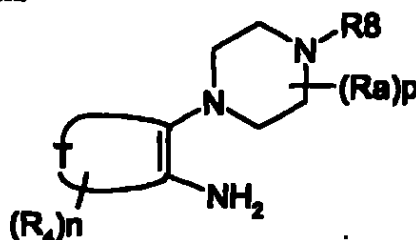
25 8. A method according to any preceding claim wherein Ra is independently halo, cyano, C₁₋₃ alkyl, hydroxy or two Ra groups together with the carbon atom to which they are attached form =O, =S, =NRb, =CRcRd where Rb, Rc and Rd are independently H or optionally substituted alkyl, and p is 0, 1 or 2.

9. A compound of formula I'



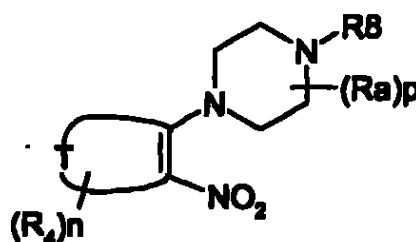
wherein R¹, R², R⁴, Ra, T, Y, n and p are as defined in relation to formula I and R⁸ is -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ where z is 1 or 2, preferably 1, R⁵¹ and R⁵² are each independently H or C₁₋₂ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is phenyl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino.

10. A compound of formula



wherein R⁴, R⁸, Ra, T, Y, n and p are as defined in relation to formula I' in claim 9 provided the compound is other than 4,5-diamino-6-(4-cinnamyl-1-piperazinyl)-pyrimidine.

11. A compound of formula



wherein R⁴, R⁸, Ra, T, Y, n and p are as defined in relation to formula I' in claim 9 provided that when T is a phenyl ring, R⁸ is cinnamyl and p is 0 then R⁴ is not a CF₃

or NO₂ group *para* to the piperazine ring and further provided the compound is other than 4-amino-6-(4-cinnamyl 1 piperaziny) 5 nitro pyrimidine

- 12 An insecticidal acaricidal or nematocidal composition comprising an insecticidally
5 acaricidally or nematocidally effective amount of a compound of formula I as defined
in claim 1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/IB2005/001468

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
IPC 7 A01N43/60 A01N47/30 A01N47/20 C07D401/00 C07D295/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)		
IPC 7 A01N C07D		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)		
EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 02/42310 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; GESING, ERNST, RUDOLF, F; ERDELEN, CHRISTOPH) 30 May 2002 (2002-05-30) page 150; compound 202	1-8,12
X	US 3 457 263 A (GILBERT REGNIER ET AL) 22 July 1969 (1969-07-22) column 5, line 6 - line 10	9,12
X	EP 0 103 464 A (WARNER-LAMBERT COMPANY) 21 March 1984 (1984-03-21) cited in the application page 21 - page 28	12
-/-		
☒ Further documents are listed in the continuation of box C.		
☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents:		
A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance		
E earlier document but published on or after the international filing date		
L document which may throw doubt on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)		
O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		
P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention		
X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone		
Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art		
A document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
30 August 2005		08/09/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 8016 Patankien 2 NL - 8200 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 651 epo nl Fax: (+31-70) 340-8016		Authorized officer Molina de Alba, J

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	J. GUILLAUME, D.S. GRIERSON, C. MONNERET: "Syntesis of bis-heteroaryl piperazine derivatives as potential reverse transcriptase inhibitors" J.HETEROCYCLIC CHEM., vol. 38, 2001, pages 985-988, XP002342777 compounds 6A-6G	12
P,X	WO 2004/089905 A (ABBOTT GMBH & CO. KG; BRAJE, WILFRIED; HAUPT, ANDREAS; LUBISCH, WILFRI) 21 October 2004 (2004-10-21) abstract examples	12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/IB2005/001468

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0242310	A	30-05-2002	CN 1355168 A	26-06-2002
			AU 2185302 A	03-06-2002
			WO 0242310 A2	30-05-2002
			EP 1339720 A2	03-09-2003
			JP 2005507852 T	24-03-2005
			US 2004053996 A1	18-03-2004
US 3457263	A	22-07-1969	BE 709014 A	05-07-1968
			CH 490404 A	15-05-1970
			ES 349429 A1	01-04-1969
			FR 7559 M	29-12-1969
			FR 1550912 A	20-12-1968
			GB 1165283 A	24-09-1969
EP 0103464	A	21-03-1984	US 4532240 A	30-07-1985
			AT 38666 T	15-12-1988
			AU 560971 B2	30-04-1987
			AU 1869983 A	15-03-1984
			AU 568997 B2	14-01-1988
			AU 6878787 A	14-05-1987
			CA 1251447 A1	21-03-1989
			DE 3378469 D1	22-12-1988
			DK 407383 A ,B,	10-03-1984
			EP 0103464 A2	21-03-1984
			ES 8502989 A1	01-05-1985
			ES 8504775 A1	16-07-1985
			GR 79058 A1	02-10-1984
			IE 56148 B1	08-05-1991
			JP 1831735 C	29-03-1994
			JP 59073573 A	25-04-1984
WO 2004089905	A	21-10-2004	US 2004204422 A1	14-10-2004
			WO 2004089905 A1	21-10-2004

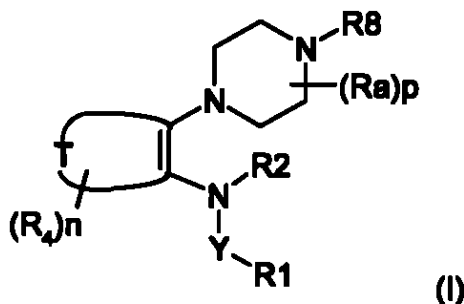
DERIVADOS DE PIPERAZINA Y SU USO EN EL CONTROL DE PESTICIDAS

La presente invención se refiere a los derivados de piperazina, a los procesos para prepararlos, a las composiciones insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que los comprenden y a los métodos para utilizarlos para combatir y controlar las plagas de insectos, acarinas, moluscos y nemátodos.

Los derivados de piperazina con propiedades antiprotozoarias se revelan, por ejemplo, en US3331845 y EP103464 revela los compuestos de pirimidinil piperazina con propiedades antibacterianas.

De manera sorprendente se halló que ciertas piperazinas tienen propiedades insecticidas.

Por lo tanto, la presente invención suministra un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nemátodos o moluscos que comprende la aplicación a una plaga, a un locus de una plaga o a una planta susceptible de atacar por una plaga una cantidad efectiva desde el punto de vista insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I):



Y es una unión única, C=O, C=S o S(O)_m donde m es 0, 1 ó 2; el anillo



20

es un anillo aromático de 6 miembros o es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros;

215.355

R¹ es hidrógeno, alquilo sustituido de manera opcional, alcoxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, aminocarbonilo, alquilo aminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera

25

opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, heterociclioxi sustituido de manera opcional, ciano, alquenilo sustituido de manera opcional, alquinilo sustituido de manera opcional, cicloalquilo sustituido de manera opcional, cicloalquenilo sustituido de manera opcional, formilo, heterociclilo sustituido de manera opcional, alquiltio sustituido de manera opcional, NO o $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ donde R^{13} y R^{14} son independientemente hidrógeno, COR¹⁵, alquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclilo sustituido de manera opcional o R^{13} y R^{14} junto con el átomo N al cual están unidos forman un grupo – $\text{N}=\text{C}(\text{R}^{16})-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ o R^{13} y R^{14} junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que pueden estar sustituidos de manera opcional por uno o dos grupos C₁₋₆ alquilo; R¹⁵ es H, alquilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional o $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$; R¹⁶, R¹⁷ y R¹⁸ son cada uno de manera independiente H o el alquilo inferior; R¹⁹ y R²⁰ son de manera independiente alquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional o heteroarilo sustituido de manera opcional;

R² es H, hidroxil, alcoxi sustituido de manera opcional o alquilo sustituido de manera opcional; o R¹ y R² junto con los grupos Y y N forman un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que de manera opcional puede contener un heteroátomo más seleccionado a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ haloalquilo o halógeno;

cada R⁴ es de manera independiente halógeno, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo sustituido de manera opcional, C₂₋₆ alquenilo sustituido de manera opcional, C₂₋₆ alquinilo sustituido de manera opcional, alcoxycarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C₃₋₇ cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de

manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, alquiltio sustituido de manera opcional o $R^{21}R^{22}N$ donde R^{21} y R^{22} son, de manera independiente, hidrógeno, C_{1-8} alquilo, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-8} alquenilo, C_{3-8} alquinilo, C_{3-7} cicloalquil(C_{1-4})alquilo, C_{2-8} haloalquilo, C_{1-8} alcoxi(C_{1-8})alquilo, C_{1-8} alcoxicarbonilo o R^{21} y R^{22} junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos C_{1-8} grupos alquilo, o 2 grupos adyacente R^4 junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6, ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno; n es 0, 1, 2, 3 ó 4;

R^8 es alquilo sustituido de manera opcional, alquenilo sustituido de manera opcional, alquinilo sustituido de manera opcional, cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, alcoxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional o alquenilcarbonilo sustituido de manera opcional;

cada R_a es de manera independiente halógeno, hidroxilo, ciano, C_{1-8} alquilo sustituido de manera opcional, C_{2-8} alquenilo sustituido de manera opcional, C_{2-8} alquinilo sustituido de manera opcional, alcoxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C_{3-7} cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, alquiltio sustituido de manera opcional, ariltio sustituido de manera opcional o $R^{23}R^{24}N$ donde R^{23} y R^{24} son, de manera independiente, hidrógeno, C_{1-8} alquilo, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-8} alquenilo, C_{3-8} alquinilo, C_{3-7} cicloalquil(C_{1-4})alquilo, C_{2-8} haloalquilo, C_{1-8} alcoxi(C_{1-8})alquilo, C_{1-8} alcoxicarbonilo o R^{23} y R^{24} junto con el átomo N al cual están unidos

forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C₁₋₈ alquilo, o dos grupos Ra unidos al mismo átomo de carbono son =O, =S, =NRb, =CRcRd
 5 donde Rb, Rc y Rd son de manera independiente H o alquilo sustituido de manera opcional; p es 0, 1, 2, 3 ó 4 o las sales o los N-óxidos de los mismos.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden existir en diferentes isómeros geométricos u ópticos o en formas tautoméricas. Esta invención cubre a todos los isómeros mencionados así como los tautómeros y las mezclas de los mismos en
 10 todas las proporciones al igual que las mencionadas formas isotópicas tales como los compuestos deuterados.

Cada mitad de alquilo ya sea sola o como parte de un grupo más grande (tal como por ejemplo alcoxi, alcóxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada y es, por ejemplo,
 15 metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, iso-propilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, tert-butilo o neo-pentilo. Los grupos alquilo son de manera adecuada los grupos alquilo C₁ a C₁₂, pero son con preferencia C₁-C₁₀, con mayor preferencia C₁-C₈, aún con mayor preferencia C₁-C₆ y con mayor preferencia los grupos alquilo C₁-C₄.

20 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en una mitad alquilo (solos o como parte de un grupo más grande tal como alcoxi, alcóxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, NCS-, C₃₋₇ cicloalquilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₈ alquilo o halógeno), C₅₋₇ cicloalquenilo (él msmo sustituido de
 25 manera opcional por C₁₋₈ alquilo o halógeno), hidroxilo, C₁₋₁₀ alcoxi, C₁₋₁₀ alcóxi(C₁₋₁₀)alcoxi, tri(C₁₋₄)alquilsilil(C₁₋₈)alcoxi, C₁₋₈ alcóxicarbonil(C₁₋₁₀)alcoxi, C₁₋₁₀ haloalcoxi, aril(C₁₋₄)-alcoxi (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional), C₃₋₇ cicloalquilo (donde el grupo cicloalquilo es sustituido de manera opcional por C₁₋₈ alquilo o halógeno), C₂₋₁₀ alquenilo, C₂₋₁₀ alquilo, SH, C₁₋₁₀
 30 alquiltio, C₁₋₁₀ haloalquiltio, aril(C₁₋₄)alquiltio (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional), C₃₋₇ cicloalquiltio (donde el grupo cicloalquilo es sustituido de manera opcional por C₁₋₈ alquilo o halógeno), tri(C₁₋₄)alquilsilil(C₁₋₈)alquiltio,

arilitio (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional), C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ haloalquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ haloalquilsulfinilo, arilsulfonilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional), tri(C₁₋₄)alquilsililo, arildi(C₁₋₄)alquilsililo, (C₁₋₄)alquildiarilsililo, triarilsililo, C₁₋₁₀ alquilcarbonilo, HO₂C, C₁₋₁₀ alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonilo, di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonilo, N-(C₁₋₃ alquil)-N-(C₁₋₃ alcoxi)aminocarbonilo, C₁₋₆ alquilcarboniloxi, arilcarboniloxi (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional), di(C₁₋₆)alquilaminocarboniloxi, oximas tales como =NOalquilo, =Nohaloalquilo y =NOarilo (él mismo sustituido de manera opcional), arilo (él mismo sustituido de manera opcional), heteroarilo (él mismo sustituido de manera opcional), heterociclilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), ariloxi (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional), heteroariloxi, (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional), heterocicliloxi (donde el grupo heterociclilo está sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), amino, C₁₋₆ alquilamino, di(C₁₋₆) alquilamino, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, N-(C₁₋₆)alquilcarbonil-N-(C₁₋₆) alquilamino, C₂₋₆ alquenilcarbonilo, C₂₋₆ alquinilcarbonilo, C₃₋₆ alqueniloxicarbonilo, C₃₋₆ alquiniloxicarbonilo, ariloxicarbonilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional) y arilcarbonilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional).

Las mitades alquenilo y alquinilo pueden estar bajo la forma de cadenas lineales o ramificadas, y las mitades de alquenilo, donde sea adecuado, pueden ser ya sea de la configuración (E)- o (Z)-. Los ejemplos son vinilo, alililo y propargilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo incluyen a los sustituyentes opcionales que se dieron más arriba para la mitad alquilo.

En el contexto de esta especificación acilo es C₁₋₆ alquilcarbonilo sustituido de manera opcional (por ejemplo acetilo), C₂₋₆ alquenilcarbonilo sustituido de manera opcional, C₂₋₆ alquinilcarbonilo sustituido de manera opcional, arilcarbonilo sustituido de manera opcional (por ejemplo benzoilo) o heteroarilcarbonilo sustituido de manera opcional.

Halógeno es fluoro, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo son los grupos alquilo que son sustituidos por uno o más de los mismos o diferentes átomos de halógeno y son, por ejemplo, CF_3 , CF_2Cl , CF_3CH_2 o CHF_2CH_2 .

5 En el contexto de la presente especificación, los términos "arilo", "anillo aromático" y "sistema de anillo aromático" se refieren a los sistemas de anillo que pueden ser mono-, bi- o tricíclicos. Los ejemplos de tales anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antralenilo, antracenilo, indenilo o fenantrenilo. Un grupo arilo preferido es fenilo. Además, los términos "heteroarilo", "anillo heteroaromático" o "sistema de anillo heteroaromático" se refieren a un sistema de anillo aromático que
10 contiene por lo menos un heteroátomo y que consiste ya sea en un anillo único o en dos o más anillos fusionados. Con preferencia, los anillos únicos contendrán hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos los cuales con preferencia serán elegidos a partir de nitrógeno, oxígeno y azufre. Los ejemplos
15 de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1, 2, 3-triazolilo, 1, 2, 4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1, 2, 3-oxadiazolilo, 1, 2, 4-oxadiazolilo, 1, 3, 4-oxadiazolilo, 1, 2, 5-oxadiazolilo, 1, 2, 3-tiadiazolilo, 1, 2, 4-tiadiazolilo, 1, 3, 4-tiadiazolilo, 1, 2, 5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1, 2, 3-triazinilo, 1, 2, 4-triazinilo, 1, 3, 5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2, 1, 3-benzoxadiazol quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo. Los ejemplos preferidos de los radicales
20 heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2, 1, 3-benzoxadiazol y tiazolilo.

Los términos heterociclo y heterociclilo se refieren a un anillo no aromático que contiene hasta 10 átomos que incluyen uno o más (con preferencia uno o dos) heteroátomos seleccionados a partir de O, S y N. Los ejemplos de tales
30 anillos incluyen 1, 3-dioxolano, tetrahidrofurano y morfolina.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el heterociclilo incluyen C₁₋₆ alquilo y C₁₋₆ haloalquilo al igual que aquellos sustituyentes opcionales dados más arriba para una mitad alquilo.

El cicloalquilo incluye ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

5 El cicloalquenilo incluye ciclopentenilo y ciclohexenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo incluyen C₁₋₃ alquilo al igual que los sustituyentes opcionales dados más arriba para una mitad alquilo.

10 Los anillos carbocíclicos incluyen los grupos arilo, cicloalquilo y cicloalquenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo o heteroarilo se seleccionan de manera independiente a partir de halógeno, nitro, ciano, NCS-, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi-(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquenilo, C₂₋₆ haloalquenilo, C₂₋₆ alquinilo, C₃₋₇ cicloalquilo (él mismo sustituido de manera
15 opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), C₅₋₇ cicloalquenilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), hidroxil, C₁₋₁₀ alcoxi, C₁₋₁₀ alcoxi(C₁₋₁₀)alcoxi, tri(C₁₋₄)alquil-silil(C₁₋₆)alcoxi, C₁₋₆ alcóxicarbonil(C₁₋₁₀)alcoxi, C₁₋₁₀ haloalcoxi, aril(C₁₋₄)alcoxi (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional con halógeno o C₁₋₆ alquilo), C₃₋₇ cicloalquiloxi (donde el grupo cicloalquilo es
20 sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), C₂₋₁₀ alqueniloxi, C₂₋₁₀ alquiniloxi, SH, C₁₋₁₀ alquiltio, C₁₋₁₀ haloalquiltio, aril(C₁₋₄)alquiltio C₃₋₇ cicloalquiltio (donde el grupo cicloalquilo es sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), tri(C₁₋₄)-alquilsilil(C₁₋₆)alquiltio, ariltio, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ haloalquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ haloalquilsulfinilo, arilsulfonilo, tri(C₁₋₄)alquilsililo, arildi(C₁₋₄)-alquilsililo, (C₁₋₄) alquildiarilsililo, triarilsililo, C₁₋₁₀ alquilcarbonilo, HO₂C, C₁₋₁₀ alcóxicarbonilo, aminocarbonilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonilo, di(C₁₋₆ alquil)-aminocarbonilo, N-(C₁₋₃ alquil)-N-(C₁₋₃ alcoxi)aminocarbonilo, C₁₋₆ alquilcarboniloxi, arilcarboniloxi, di(C₁₋₆)alquilamino-
25 carboniloxi, arilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), heteroarilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), heterociclilo (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), ariloxi (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional por C₁₋₆

30

alquilo o halógeno), heteroariloxi (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), heterociclioxi (donde el grupo heterociclilo está sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo o halógeno), amino, C₁₋₆ alquilamino, di(C₁₋₆)alquilamino, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, N-(C₁₋₆)alquilcarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, arilcarbonilo, (donde el grupo arilo es el mismo sustituido de manera opcional con halógeno o C₁₋₆ alquilo) o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, el mismo sustituido de manera opcional con halógeno o C₁₋₆ alquilo. Los demás

10 sustituyentes para arilo o heteroarilo incluyen arilo carbonilo amino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), (C₁₋₆)alquiloxicarbonilamino (C₁₋₆)alquiloxicarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, ariloxicarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), ariloxicarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆

15 alquilo o halógeno), arilsulfonilamino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), arilsulfonil-N-(C₁₋₆)alquilamino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), aril-N-(C₁₋₆)alquilamino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), arilamino (donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), heteroarilo amino (donde el grupo heteroarilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), heterocicliamino (donde el grupo heterociclilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), aminocarbonilamino, C₁₋₆ alquilaminocarbonil amino, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil amino, arilaminocarbonil amino donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), aril-N-(C₁₋₆) alquilaminocarbonilamino donde el grupo arilo está

20 sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno), C₁₋₆ alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquil amino, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquil amino, arilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquil amino donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno) y aril-N-(C₁₋₆)alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquil amino donde el grupo arilo está sustituido por C₁₋₆ alquilo o halógeno).

30 Para las mitades de fenilo sustituidas, los grupos heterociclilo y heteroarilo se prefiere que uno o más sustituyentes sean seleccionados de manera independiente a partir de halógeno, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋

alquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ haloalquiltio, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ haloalquilsulfinilo, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ haloalquilsulfonilo, C₂₋₆ alquenilo, C₂₋₆ haloalquenilo, C₂₋₆ alquinilo, C₃₋₇ cicloalquilo, nitro, ciano, CO₂H, C₁₋₆ alquilcarbonilo, C₁₋₆ alcoxycarbonilo, R²⁵R²⁶N o R²⁷R²⁸NC(O); donde R²⁵, R²⁶,
 5 R²⁷ y R²⁸ son, de manera independiente, hidrógeno o C₁₋₆ alquilo. Los demás sustituyentes preferidos son los grupos arilo y heteroarilo.

Los grupos haloalquenilo son los grupos alquenilo los cuales sons sustituidos por uno o más de los mismos o de átomos diferentes de halógeno.

Se debe comprender que los sustituyentes de dialquilamino incluyen a
 10 aquéllos donde los grupos dialquilo junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y el cual es sustituido de manera opcional por uno o dos grupos alquilo (C₁₋₆) seleccionados de manera independientes. Cuando los anillos heterocíclicos se forman por
 15 medio de la unión de dos grupos en un átomo N, los anillos resultantes son de manera adecuada pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina, cada uno de los cuales puede estar sustituido por uno o dos grupos alquilo (C₁₋₆) seleccionados de manera independiente.

Con preferencia los sustituyentes opcionales en una mitad alquilo incluyen
 20 uno o más de halógeno, nitro, ciano, HO₂C, C₁₋₁₀ alcoxi (él mismo sustituido de manera opcional por C₁₋₁₀ alcoxi), aril(C₁₋₄)alcoxi, C₁₋₁₀ alquiltio, C₁₋₁₀ alquilcarbonilo, C₁₋₁₀ alcoxycarbonilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonilo, di(C₁₋₆ alquil)aminocarbonilo, (C₁₋₆)alquilcarboniloxi, fenilo, heteroarilo, ariloxi, arilcarboniloxi, heteroariloxi, heterociclilo, heterociciloxi sustituidos de manera
 25 opcional, C₃₋₇ cicloalquilo (él mismo sustituido de manera opcional por (C₁₋₆)alquilo o halógeno), C₃₋₇ cicloalquiloxi, C₆₋₇ cicloalquenilo, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, tri(C₁₋₄)alquilsililo, tri(C₁₋₄)alquilsilil(C₁₋₆)alcoxi, arildi(C₁₋₄)alquilsililo, (C₁₋₄)alquildiarilsililo y triarilsililo.

Con preferencia los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo
 30 incluyen uno o más de halógeno, arilo y C₃₋₇ cicloalquilo.

Un sustituyente opcional preferido para el heterociclilo es el alquilo C₁₋₆.

Con preferencia los sustituyentes opcionales para el cicloalquilo incluyen halógeno, ciano y alquilo C₁₋₃.

Con preferencia los sustituyentes opcionales para el cicloalquenilo incluyen alquilo C₁₋₃, halógeno y ciano.

5 Los grupos preferidos para T, Y, Ra, R¹, R², R⁴ y R⁸ en cualquiera de las combinaciones de los mismos se establecen a continuación.

Con preferencia Y es un enlace simple, C=O o C=S.

Con mayor preferencia Y es un enlace simple o C=O.

Aún con mayor preferencia Y es C=O.

10 Con preferencia R¹ es hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ cianoalquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₃₋₇ cicloalquil(C₁₋₄)alquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, heteroaril(C₁₋₆)alquilo (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), aril(C₁₋₆)alquilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), C₁₋₆ alquilcarbonilamino(C₁₋₆)alquilo, arilo (el cual puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆

15

20

25

30

alcóxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones
 adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar
 un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de
 manera opcional con halógeno), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (donde el grupo
 5 fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi,
 C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o
 dialquilamino), heteroariloxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano,
 C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), heterocicliloxi
 (sustituido de manera opcional con halo, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o
 10 C₁₋₆ haloalcoxi), ciano, C₂₋₆ alquenilo, C₂₋₆ alquinilo, C₃₋₆ cicloalquilo, C₅₋₇
 cicloalquenilo, heterociclilo (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano,
 C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆
 haloalquiltio o NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ son de manera independiente hidrógeno,
 C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, fenilo (el cual puede estar
 15 sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄
 haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o C₁₋₄
 alcóxicarbonilo), fenilo (C₁₋₆)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar sustituido
 de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄
 haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C₁₋₆ alquilsulfonilo,
 20 C₁₋₆ alcóxicarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo de fenilo pueden ser
 colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7
 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), heteroarilo (C₁₋₆
)alquilo (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional
 con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆
 25 alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcóxicarbonilo, C₁₋₆
 alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema
 heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o
 heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con
 halógeno) o heteroarilo (el cual puede estar sustituido de manera opcional con
 30 halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₄
 alcóxicarbonilo C₁₋₆ alquilcarbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo
 fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi,

C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, C₁₋₆ alquilamino o fenilamino (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino)).

- 5 Con mayor preferencia R¹ es C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, heteroaril(C₁₋₃)alquilo (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar
- 10 un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), fenil(C₁₋₃)alquil (donde el grupo fenilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo de
- 15 fenilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), fenilo (el cual puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, o dos
- 20 posiciones adyacentes en el anillo de fenilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), heteroarilo (el cual puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, o dos
- 25 posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₂₋₆ alquenilo, heterociclilo (sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ haloalquiltio o
- 30 NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ son de manera independiente hidrógeno, C₁₋₆ alquilo o C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquilcarbonilo, fenilcarbonilo, (donde el fenilo es sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi,

C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil(C₁₋₃)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxycarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo de fenilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno) o heteroaril(C₁₋₃)alquilo (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxycarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ser colocadas en ciclos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno).

Con mayor preferencia aún, R¹ es C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, heteroaril(C₁₋₃)alquilo (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo y donde el grupo heteroarilo es un anillo de tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o piridazina), heteroarilo (sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo y donde el grupo heteroarilo es un anillo de piridina, pirimidina, 2,1,3-benzoxadiazol, pirazina o piridazina), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alquilamino, C₁₋₆ alquiox(C₁₋₆)alquilamino o heteroaril(C₁₋₃)alquilamino (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo y donde el grupo heteroarilo es un anillo de tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o piridazina).

Con mayor preferencia R¹ es piridilo (sustituido de manera opcional con halo, C₁₋₃ alquilo o C₁₋₃ haloalquilo) especialmente piridilo sustituido por halo.

Es preferible que R² sea hidrógeno, hidroxí, C₁₋₆ alquilo o C₁₋₆ haloalquilo.

Con mayor preferencia R² es hidrógeno, C₁₋₄ alquilo o C₁₋₄ haloalquilo.

Aún con mayor preferencia R² es hidrógeno o C₁₋₄ alquilo.

Aún con mayor preferencia R² es de manera independiente hidrógeno o metilo.

Con mayor preferencia R^2 es hidrógeno.

Con preferencia cada R^4 es de manera independiente halógeno, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} cianoalquilo, C_{1-6} alcoxi(C_{1-6})alquilo, C_{3-7} cicloalquil(C_{1-6})alquilo, C_{5-6} cicloalquenilo(C_{1-6})alquilo, C_{3-6} alquenilo(C_{1-6})alquilo, C_{3-6} alquinox(C_{1-6})alquilo, ariloxi(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} carboxialquilo, C_{1-6} alquilcarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{2-6} alquenilcarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{2-6} alquilcarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{3-6} alqueniloxycarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{3-6} alquiloxycarbonil(C_{1-6})alquilo, ariloxycarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} alquiltio(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} alquilsulfinil(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} alquilsulfonil(C_{1-6})alquilo, aminocarbonil(C_{1-6})alquilo, C_{1-6} alquilaminocarbonil(C_{1-6})alquilo, di(C_{1-6})alquilaminocarbonil(C_{1-6})alquilo, fenil(C_{1-4})alquilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C_{1-4})alquilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi o C_{1-6} haloalcoxi), heterocicil(C_{1-4})alquilo (donde el grupo heterocicilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi o C_{1-6} haloalcoxi), C_{2-6} alquenilo, aminocarbonil(C_{2-6})alquenilo, C_{1-6} alquilaminocarbonil(C_{2-6})alquenilo, di(C_{1-6})alquilaminocarbonil(C_{2-6})alquenilo, fenil(C_{2-4})alquenilo, (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C_{2-6} alquino, trimetilsilil(C_{2-6})alquino, aminocarbonil(C_{2-6})alquino, C_{1-6} alquilaminocarbonil(C_{2-6})alquino, di(C_{1-6})alquilaminocarbonil(C_{2-6})alquino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-7} halocicloalquilo, C_{3-7} cianocicloalquilo, C_{1-3} alquil(C_{3-7})-cicloalquilo, C_{1-3} alquil(C_{3-7})halocicloalquilo, fenilo (sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi o C_{1-6} haloalcoxi), heterocicilo (donde el grupo heterocicilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi o C_{1-6} haloalcoxi), o 2 grupos adyacentes R^4 junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de

4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), heteroariloxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alquiltio o R¹⁹R²⁰N donde R¹⁹ y R²⁰ son, de manera independiente, hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₃₋₆ alqueno, C₃₋₆ alquino, C₂₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcóxicarbonilo o R¹⁹ y R²⁰ junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C₁₋₆ alquilo; n es 0, 1, 2 ó 3.

Con mayor preferencia cada R⁴ es de manera independiente halógeno, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ cianoalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquino, trimetilsilil(C₂₋₆)alquino, C₁₋₆ alcóxicarbonilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₁₋₃ alquilo (C₃₋₇) cicloalquilo, fenilo (sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterociclilo (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₃ alquilo, C₁₋₃ haloalquilo, C₁₋₃ alcoxi o C₁₋₃ haloalcoxi), di(C₁₋₆)alquilamino, o 2 grupos adyacentes R⁴ junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno; n es 0, 1, 2 ó 3.

Aún con mayor preferencia cada R⁴ es de manera independiente halógeno, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ cianoalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquino, heterociclilo (sustituido de manera opcional por C₁₋₆ alquilo), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₃ alquilo o C₁₋₃ haloalquilo), heteroariloxi (sustituido de manera opcional con halo, ciano, C₁₋₃ alquilo ó C₁₋₃ haloalquilo), di(C₁₋₆)alquilamino o 2 grupos adyacentes R⁴ junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico

o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno; n es 0, 1, 2 ó 3.

Aún con mayor preferencia cada R^4 es de manera independiente fluoro, cloro, bromo, ciano, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} cianoalquilo o C_{1-3} alcoxi(C_{1-3})alquilo; n es 0, 1, 2 ó 3, con preferencia 0, 1 ó 2.

Con mayor preferencia cada R^4 es de manera independiente fluoro, cloro, bromo, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo; n es 1, 2 ó 3, con preferencia 1 ó 2.

Con preferencia R^8 es C_{1-10} alquilo, C_{1-10} haloalquilo, aril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonil-(C_{1-6})alquilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino y el grupo alquilo puede estar sustituido de manera opcional con arilo), C_{2-8} alquenilo, C_{2-8} haloalquenilo, aril(C_{2-6})-alquenilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), heteroaril(C_{2-6})-alquenilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), C_{2-8} alquinilo, fenil(C_{2-6})alquinilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C_{3-7} cicloalquilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alquilcarbonilo, C_{1-6} haloalquilcarbonilo o aril(C_{2-6})alquenilcarbonilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o –

$C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_Z-R^{55}$ donde z es 1 ó 2, R^{51} y R^{52} son cada uno de manera independiente H, halo o C_{1-2} alquilo, R^{53} y R^{54} son cada uno de manera independiente H, halógeno, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo y R^{55} es arilo sustituido de manera opcional o heteroarilo sustituido de manera opcional.

5 Con mayor preferencia R^8 es fenil(C_{1-4})alquilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenil(C_{2-6})alquenilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C_{2-6})alquenilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino) o fenil(C_{2-6})alquinilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_Z-R^{55}$ donde z es 1 ó 2, R^{51} y R^{52} son cada uno de manera independiente H, halo o C_{1-2} alquilo, R^{53} y R^{54} son cada uno de manera independiente H, halógeno, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo y R^{55} es arilo sustituido de manera opcional o heteroarilo sustituido de manera opcional.

Con mayor preferencia R^8 es $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_Z-R^{55}$ donde z es 1 ó 2, con preferencia 1, R^{51} y R^{52} son cada uno de manera independiente H o C_{1-2} alquilo, R^{53} y R^{54} son cada uno de manera independiente H, halógeno, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo y R^{55} es fenilo sustituido por halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido por halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

R^{51} y R^{52} son con preferencia hidrógeno.

30 R^{53} y R^{54} son con preferencia hidrógeno o halógeno, especialmente hidrógeno.

R⁵⁵ es Con preferencia fenilo sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados a partir de halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

Con preferencia cada Ra es de manera independiente halo, ciano, C₁₋₃ alquilo, hidroxilo o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman =O, =S, =NRb, =CRcRd donde Rb, Rc y Rd son de manera independiente H o alquilo sustituido de manera opcional, y p es 0, 1 ó 2.

Con mayor preferencia cada Ra es de manera independiente fluoro, metilo, hidroxilo o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo carbonilo y p es 0, 1 ó 2.

Con mayor preferencia p es 0.

Se prefiere que el anillo mencionado



sea un anillo aromático de 6 miembros o sea un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros donde los miembros del anillo sean cada uno de ellos de manera independiente CH, S, N, NR⁴, O, o CR⁴ siempre y cuando por lo menos un miembro del anillo sea diferente de CH o CR⁴ y que no haya más de un átomo O o S presente en el anillo.

Con mayor preferencia el anillo



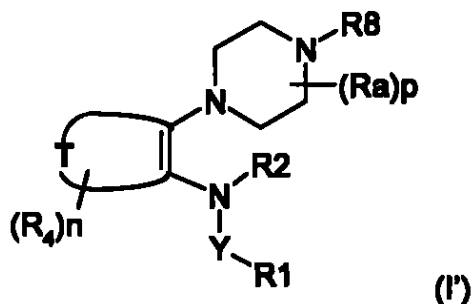
es un a benceno, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, furano, tiofeno, pirrolo, imidazol, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol.

Con mayor preferencia el anillo



es un anillo de benceno o piridina.

Ciertos compuestos de la fórmula (I) son novedosos y como tales forman un aspecto adicional de la invención. Un grupo de los compuestos novedosos son los compuestos de la fórmula I'



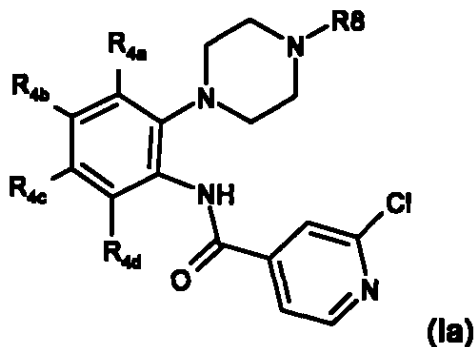
5

donde R^1 , R^2 , R^4 , R_a , T , Y , n y p son como se los define en relación con la fórmula I y R^8 es

$-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ donde z es 1 ó 2, con preferencia 1, R^{51} y R^{52} son
 10 cada uno de manera independiente H o C_{1-2} alquilo, R^{53} y R^{54} son cada uno de manera independiente H, halógeno, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo y R^{55} es fenilo sustituido por halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido por
 15 halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

Los compuestos de las Tablas I a XXV que figuran a continuación ilustran los compuestos de la invención.

La Tabla I proporciona 897 compuestos de la fórmula Ia



20

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

Tabla 1

Compuesto No	R ^a	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1	4-clorobencilo	H	H	H	H
I-2	Cinamilo	H	H	H	H
I-3	4-clorocinamilo	H	H	H	H
I-4	4-fluorocinamilo	H	H	H	H
I-5	4-bromocinamilo	H	H	H	H
I-6	4-trifluorometilcinamilo	H	H	H	H
I-7	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	H	H
I-8	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	H	H
I-9	4-metoxicinamilo	H	H	H	H
I-10	4-etoxicinamilo	H	H	H	H
I-11	4-cianocinamilo	H	H	H	H
I-12	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	H	H
I-13	3-(4-clorofenilo)-but-2-enilo	H	H	H	H
I-14	3-(4-clorofenilo)-3-fluoro- allilo	H	H	H	H
I-15	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	H	H
I-16	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	H	H
I-17	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	H	H
I-18	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	H	H	H	H
I-19	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	H	H
I-20	3-(5-trifluorometil-piridin-2- il)-allilo	H	H	H	H
I-21	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	H	H
I-22	3-piridin-4-il-allilo	H	H	H	H
I-23	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	H	H
I-24	4-clorobencilo	H	F	H	H
I-25	Cinamilo	H	F	H	H

I-26	4-clorocinamilo	H	F	H	H
I-27	4-fluorocinamilo	H	F	H	H
I-28	4-bromocinamilo	H	F	H	H
I-29	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	H
I-30	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	H
I-31	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	H
I-32	4-metoxicinamilo	H	F	H	H
I-33	4-etoxicinamilo	H	F	H	H
I-34	4-cianocinamilo	H	F	H	H
I-35	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	H	H
I-36	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	H
I-37	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	H	H
I-38	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	H
I-39	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	H
I-40	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	H
I-41	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	H	H
I-42	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	H	H
I-43	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	F	H	H
I-44	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	H	H
I-45	3-piridin-4-il-allilo	H	F	H	H
I-46	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	H	H
I-47	4-clorobencilo	H	Cl	H	H
I-48	Cinamilo	H	Cl	H	H
I-49	4-clorocinamilo	H	Cl	H	H
I-50	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	H
I-51	4-bromocinamilo	H	Cl	H	H
I-52	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	H
I-53	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-54	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	H

I-55	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-56	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	H
I-57	4-cianocinamilo	H	Cl	H	H
I-58	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	H	H
I-59	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	H
I-60	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	H	H
I-61	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	H
I-62	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	H
I-63	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	H
I-64	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	H
I-65	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	H	H
I-66	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H	H
I-67	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H	H
I-68	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	H	H
I-69	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	H	H
I-70	4-clorobencilo	H	H	F	H
I-71	Cinamilo	H	H	F	H
I-72	4-clorocinamilo	H	H	F	H
I-73	4-fluorocinamilo	H	H	F	H
I-74	4-bromocinamilo	H	H	F	H
I-75	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	H
I-76	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	H
I-77	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	H
I-78	4-metoxicinamilo	H	H	F	H
I-79	4-etoxicinamilo	H	H	F	H
I-80	4-cianocinamilo	H	H	F	H
I-81	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	F	H
I-82	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	H
I-83	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	F	H

I-84	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	H
I-85	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	H
I-86	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	H
I-87	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	F	H
I-88	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	F	H
I-89	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	F	H
I-90	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	F	H
I-91	3-piridin-4-il-allilo	H	H	F	H
I-92	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	F	H
I-93	4-clorobencilo	H	H	Cl	H
I-94	Cinamilo	H	H	Cl	H
I-95	4-clorocinamilo	H	H	Cl	H
I-96	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	H
I-97	4-bromocinamilo	H	H	Cl	H
I-98	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	H
I-99	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-100	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-101	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-102	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	H
I-103	4-cianocinamilo	H	H	Cl	H
I-104	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	Cl	H
I-105	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	H
I-106	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	Cl	H
I-107	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	H
I-108	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	H
I-109	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	H
I-110	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	H
I-111	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	Cl	H

I-112	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	H
I-113	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	H
I-114	3-piridin-4-il-allilo	H	H	Cl	H
I-115	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	Cl	H
I-116	4-clorobencilo	Cl	Cl	H	H
I-117	Cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-118	4-clorocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-119	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-120	4-bromocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-121	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	H	H
I-122	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-123	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-124	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-125	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	H	H
I-126	4-cianocinamilo	Cl	Cl	H	H
I-127	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	Cl	H	H
I-128	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	H	H
I-129	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	Cl	H	H
I-130	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-131	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-132	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	H	H
I-133	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	H	H
I-134	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	H	H
I-136	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	H	H
I-137	3-piridin-4-il-allilo	Cl	Cl	H	H
I-138	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	Cl	H	H
I-139	4-clorobencilo	F	F	H	H

I-140	Cinamilo	F	F	H	H
I-141	4-clorocinamilo	F	F	H	H
I-142	4-fluorocinamilo	F	F	H	H
I-143	4-bromocinamilo	F	F	H	H
I-144	4-trifluorometilcinamilo	F	F	H	H
I-145	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	H	H
I-146	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	H	H
I-147	4-metoxicinamilo	F	F	H	H
I-148	4-etoxicinamilo	F	F	H	H
I-149	4-cianocinamilo	F	F	H	H
I-150	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	F	H	H
I-151	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	H	H
I-152	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	F	H	H
I-153	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	H	H
I-154	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	H	H
I-155	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	H	H
I-156	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	H	H
I-157	3-naftalen-2-il-allilo	F	F	H	H
I-158	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	F	H	H
I-159	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	F	H	H
I-160	3-piridin-4-il-allilo	F	F	H	H
I-161	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	F	H	H
I-162	4-clorobencilo	F	H	F	H
I-163	Cinamilo	F	H	F	H
I-164	4-clorocinamilo	F	H	F	H
I-165	4-fluorocinamilo	F	H	F	H
I-166	4-bromocinamilo	F	H	F	H
I-167	4-trifluorometilcinamilo	F	H	F	H
I-168	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	F	H

I-169	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	F	H
I-170	4-metoxicinamilo	F	H	F	H
I-171	4-etoxicinamilo	F	H	F	H
I-172	4-cianocinamilo	F	H	F	H
I-173	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	F	H
I-174	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	F	H
I-175	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	F	H
I-176	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	F	H
I-177	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	F	H
I-178	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	F	H
I-179	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	F	H	F	H
I-180	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	F	H
I-181	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	F	H
I-182	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	F	H
I-183	3-piridin-4-il-allilo	F	H	F	H
I-184	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	F	H
I-185	4-clorobencilo	F	H	H	F
I-186	Cinamilo	F	H	H	F
I-187	4-clorocinamilo	F	H	H	F
I-188	4-fluorocinamilo	F	H	H	F
I-189	4-bromocinamilo	F	H	H	F
I-190	4-trifluorometilcinamilo	F	H	H	F
I-191	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	H	F
I-192	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	H	F
I-193	4-metoxicinamilo	F	H	H	F
I-194	4-etoxicinamilo	F	H	H	F
I-195	4-cianocinamilo	F	H	H	F
I-196	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	H	F
I-197	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	H	F

I-198	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	H	F
I-199	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	H	F
I-200	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	H	F
I-201	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	H	F
I-202	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	H	F
I-203	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	H	F
I-204	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	H	F
I-205	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	H	F
I-206	3-piridin-4-il-allilo	F	H	H	F
I-207	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	H	F
I-208	4-clorobencilo	Cl	H	Cl	H
I-209	Cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-210	4-clorocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-211	4-fluorocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-212	4-bromocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-213	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	Cl	H
I-214	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-215	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-216	4-metoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-217	4-etoxicinamilo	Cl	H	Cl	H
I-218	4-cianocinamilo	Cl	H	Cl	H
I-219	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	Cl	H
I-220	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	Cl	H
I-221	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	Cl	H
I-222	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-223	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	Cl	H
I-224	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	Cl	H
I-225	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	Cl	H

I-226	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	Cl	H
I-227	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	Cl	H
I-228	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	Cl	H
I-229	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	Cl	H
I-230	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	Cl	H
I-231	4-clorobencilo	Cl	H	H	Cl
I-232	Cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-233	4-clorocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-234	4-fluorocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-235	4-bromocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-236	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	H	Cl
I-237	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-238	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-239	4-metoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-240	4-etoxicinamilo	Cl	H	H	Cl
I-241	4-cianocinamilo	Cl	H	H	Cl
I-242	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	H	Cl
I-243	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	H	Cl
I-244	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	H	Cl
I-245	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-246	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-247	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	H	Cl

I-248	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	H	Cl
I-249	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	H	Cl
I-250	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H	Cl
I-251	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H	Cl
I-252	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	H	Cl
I-253	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	H	Cl
I-254	4-clorobencilo	F	Cl	H	H
I-255	Cinamilo	F	Cl	H	H
I-256	4-clorocinamilo	F	Cl	H	H
I-257	4-fluorocinamilo	F	Cl	H	H
I-258	4-bromocinamilo	F	Cl	H	H
I-259	4-trifluorometilcinamilo	F	Cl	H	H
I-260	4-trifluorometoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-261	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-262	4-metoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-263	4-etoxicinamilo	F	Cl	H	H
I-264	4-cianocinamilo	F	Cl	H	H
I-265	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	Cl	H	H
I-266	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	Cl	H	H
I-267	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	Cl	H	H
I-268	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	Cl	H	H
I-269	3,5-dicloro-cinamilo	F	Cl	H	H
I-270	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	Cl	H	H
I-271	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	Cl	H	H
I-272	3-naftalen-2-il-allilo	F	Cl	H	H
I-273	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	Cl	H	H
I-274	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	Cl	H	H

I-275	3-piridin-4-il-allilo	F	Cl	H	H
I-276	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	Cl	H	H
I-277	4-clorobencilo	F	H	Cl	H
I-278	Cinamilo	F	H	Cl	H
I-279	4-clorocinamilo	F	H	Cl	H
I-280	4-fluorocinamilo	F	H	Cl	H
I-281	4-bromocinamilo	F	H	Cl	H
I-282	4-trifluorometilcinamilo	F	H	Cl	H
I-283	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-284	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-285	4-metoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-286	4-etoxicinamilo	F	H	Cl	H
I-287	4-cianocinamilo	F	H	Cl	H
I-288	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	Cl	H
I-289	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	Cl	H
I-290	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	Cl	H
I-291	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	Cl	H
I-292	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	Cl	H
I-293	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	Cl	H
I-294	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	Cl	H
I-295	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	Cl	H
I-296	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	Cl	H
I-297	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	Cl	H
I-298	3-piridin-4-il-allilo	F	H	Cl	H
I-299	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	Cl	H
I-300	4-clorobencilo	F	H	H	Cl
I-301	Cinamilo	F	H	H	Cl
I-302	4-clorocinamilo	F	H	H	Cl
I-303	4-fluorocinamilo	F	H	H	Cl

I-304	4-bromocinamilo	F	H	H	Cl
I-305	4-trifluorometilcinamilo	F	H	H	Cl
I-306	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-307	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-308	4-metoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-309	4-etoxicinamilo	F	H	H	Cl
I-310	4-cianocinamilo	F	H	H	Cl
I-311	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	H	Cl
I-312	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	H	Cl
I-313	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	H	Cl
I-314	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	H	Cl
I-315	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	H	Cl
I-316	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	H	Cl
I-317	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	H	Cl
I-318	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	H	Cl
I-319	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	H	Cl
I-320	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	H	Cl
I-321	3-piridin-4-il-allilo	F	H	H	Cl
I-322	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	H	Cl
I-323	4-clorobencilo	Cl	F	H	H
I-324	Cinamilo	Cl	F	H	H
I-325	4-clorocinamilo	Cl	F	H	H
I-326	4-fluorocinamilo	Cl	F	H	H
I-327	4-bromocinamilo	Cl	F	H	H
I-328	4-trifluorometilcinamilo	Cl	F	H	H
I-329	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-330	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-331	4-metoxicinamilo	Cl	F	H	H
I-332	4-etoxicinamilo	Cl	F	H	H

I-333	4-cianocinamilo	Cl	F	H	H
I-334	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	F	H	H
I-335	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	F	H	H
I-336	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	F	H	H
I-337	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	F	H	H
I-338	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	F	H	H
I-339	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	F	H	H
I-340	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	F	H	H
I-341	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	F	H	H
I-342	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	F	H	H
I-343	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	F	H	H
I-344	3-piridin-4-il-allilo	Cl	F	H	H
I-345	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	F	H	H
I-346	4-clorobencilo	H	F	Cl	H
I-347	Cinamilo	H	F	Cl	H
I-348	4-clorocinamilo	H	F	Cl	H
I-349	4-fluorocinamilo	H	F	Cl	H
I-350	4-bromocinamilo	H	F	Cl	H
I-351	4-trifluorometilcinamilo	H	F	Cl	H
I-352	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-353	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-354	4-metoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-355	4-etoxicinamilo	H	F	Cl	H
I-356	4-cianocinamilo	H	F	Cl	H
I-357	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	Cl	H
I-358	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	Cl	H
I-359	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	Cl	H
I-360	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	Cl	H
I-361	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	Cl	H

I-362	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	Cl	H
I-363	4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo	H	F	Cl	H
I-364	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	Cl	H
I-365	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	F	Cl	H
I-366	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	Cl	H
I-367	3-piridin-4-il-allilo	H	F	Cl	H
I-368	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	Cl	H
I-369	4-clorobencilo	H	F	H	Cl
I-370	Cinamilo	H	F	H	Cl
I-371	4-clorocinamilo	H	F	H	Cl
I-372	4-fluorocinamilo	H	F	H	Cl
I-373	4-bromocinamilo	H	F	H	Cl
I-374	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	Cl
I-375	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-376	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-377	4-metoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-378	4-etoxicinamilo	H	F	H	Cl
I-379	4-cianocinamilo	H	F	H	Cl
I-380	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	H	Cl
I-381	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	Cl
I-382	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	H	Cl
I-383	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	Cl
I-384	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	Cl
I-385	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	Cl
I-386	4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo	H	F	H	Cl
I-387	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	H	Cl
I-388	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	F	H	Cl

I-389	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	H	Cl
I-390	3-piridin-4-il-allilo	H	F	H	Cl
I-391	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	H	Cl
I-392	4-clorobencilo	Cl	H	F	H
I-393	Cinamilo	Cl	H	F	H
I-394	4-clorocinamilo	Cl	H	F	H
I-395	4-fluorocinamilo	Cl	H	F	H
I-396	4-bromocinamilo	Cl	H	F	H
I-397	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	F	H
I-398	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-399	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-400	4-metoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-401	4-etoxicinamilo	Cl	H	F	H
I-402	4-cianocinamilo	Cl	H	F	H
I-403	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	F	H
I-404	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	F	H
I-405	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	F	H
I-406	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	F	H
I-407	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	F	H
I-408	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	F	H
I-409	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	F	H
I-410	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	F	H
I-411	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	F	H
I-412	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	F	H
I-413	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	F	H
I-414	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	F	H
I-415	4-clorobencilo	H	Cl	F	H
I-416	Cinamilo	H	Cl	F	H
I-417	4-clorocinamilo	H	Cl	F	H

I-418	4-fluorocinamilo	H	Cl	F	H
I-419	4-bromocinamilo	H	Cl	F	H
I-420	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	F	H
I-421	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-422	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-423	4-metoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-424	4-etoxicinamilo	H	Cl	F	H
I-425	4-cianocinamilo	H	Cl	F	H
I-426	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	F	H
I-427	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	F	H
I-428	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	F	H
I-429	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	F	H
I-430	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	F	H
I-431	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	F	H
I-432	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	F	H
I-433	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	F	H
I-434	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	F	H
I-435	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	F	H
I-436	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	F	H
I-437	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	F	H
I-438	4-clorobencilo	H	H	F	Cl
I-439	Cinamilo	H	H	F	Cl
I-440	4-clorocinamilo	H	H	F	Cl
I-441	4-fluorocinamilo	H	H	F	Cl
I-442	4-bromocinamilo	H	H	F	Cl
I-443	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	Cl
I-444	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-445	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-446	4-metoxicinamilo	H	H	F	Cl

I-447	4-etoxicinamilo	H	H	F	Cl
I-448	4-cianocinamilo	H	H	F	Cl
I-449	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	F	Cl
I-450	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	Cl
I-451	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	F	Cl
I-452	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	Cl
I-453	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	Cl
I-454	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	Cl
I-455	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	F	Cl
I-456	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	F	Cl
I-457	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	F	Cl
I-458	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	F	Cl
I-459	3-piridin-4-il-allilo	H	H	F	Cl
I-460	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	F	Cl
I-461	4-clorobencilo	Cl	H	H	F
I-462	Cinamilo	Cl	H	H	F
I-463	4-clorocinamilo	Cl	H	H	F
I-464	4-fluorocinamilo	Cl	H	H	F
I-465	4-bromocinamilo	Cl	H	H	F
I-466	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	H	F
I-467	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-468	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-469	4-metoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-470	4-etoxicinamilo	Cl	H	H	F
I-471	4-cianocinamilo	Cl	H	H	F
I-472	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	H	F
I-473	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	H	F
I-474	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	H	F
I-475	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	H	F

I-476	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	H	F
I-477	5-fenil-penta-2,4-dienil	Cl	H	H	F
I-478	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	H	F
I-479	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	H	F
I-480	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H	F
I-481	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H	F
I-482	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	H	F
I-483	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	H	F
I-484	4-clorobencilo	H	Cl	H	F
I-485	Cinamilo	H	Cl	H	F
I-486	4-clorocinamilo	H	Cl	H	F
I-487	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	F
I-488	4-bromocinamilo	H	Cl	H	F
I-489	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	F
I-490	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-491	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-492	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-493	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	F
I-494	4-cianocinamilo	H	Cl	H	F
I-495	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	H	F
I-496	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	F
I-497	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	H	F
I-498	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	F
I-499	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	F
I-500	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	F
I-501	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	F
I-502	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	H	F
I-503	3-(5-trifluorometil-piridin-2-	H	Cl	H	F

	il)-allilo				
I-504	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H	F
I-505	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	H	F
I-506	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	H	F
I-507	4-clorobencilo	H	H	Cl	F
I-508	Cinamilo	H	H	Cl	F
I-509	4-clorocinamilo	H	H	Cl	F
I-510	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	F
I-511	4-bromocinamilo	H	H	Cl	F
I-512	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	F
I-513	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-514	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-515	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-516	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	F
I-517	4-cianocinamilo	H	H	Cl	F
I-518	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	Cl	F
I-519	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	F
I-520	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	Cl	F
I-521	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	F
I-522	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	F
I-523	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	F

I-524	4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	F
I-525	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	Cl	F
I-526	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	F
I-527	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	F
I-528	3-piridin-4-il-allilo	H	H	Cl	F
I-529	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	Cl	F
I-530	4-clorobencilo	H	F	F	F
I-531	Cinamilo	H	F	F	F
I-532	4-clorocinamilo	H	F	F	F
I-533	4-fluorocinamilo	H	F	F	F
I-534	4-bromocinamilo	H	F	F	F
I-535	4-trifluorometilcinamilo	H	F	F	F
I-536	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	F	F
I-537	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	F	F
I-538	4-metoxicinamilo	H	F	F	F
I-539	4-etoxicinamilo	H	F	F	F
I-540	4-cianocinamilo	H	F	F	F
I-541	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	F	F
I-542	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	F	F
I-543	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	F	F
I-544	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	F	F
I-545	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	F	F
I-546	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	F	F
I-547	4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo	H	F	F	F
I-548	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	F	F
I-549	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	F	F	F
I-550	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	F	F

I-551	3-piridin-4-il-allilo	H	F	F	F
I-552	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	F	F
I-553	4-clorobencilo	F	H	F	F
I-554	Cinamilo	F	H	F	F
I-555	4-clorocinamilo	F	H	F	F
I-556	4-fluorocinamilo	F	H	F	F
I-557	4-bromocinamilo	F	H	F	F
I-558	4-trifluorometilcinamilo	F	H	F	F
I-559	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	F	F
I-560	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	F	F
I-561	4-metoxicinamilo	F	H	F	F
I-562	4-etoxicinamilo	F	H	F	F
I-563	4-cianocinamilo	F	H	F	F
I-564	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	F	F
I-565	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	F	F
I-566	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	F	F
I-567	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	F	F
I-568	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	F	F
I-569	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	F	F
I-570	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	F	F
I-571	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	F	F
I-572	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	F	F
I-573	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	F	F
I-574	3-piridin-4-il-allilo	F	H	F	F
I-575	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	F	F
I-576	4-clorobencilo	F	F	H	F
I-577	Cinamilo	F	F	H	F
I-578	4-clorocinamilo	F	F	H	F
I-579	4-fluorocinamilo	F	F	H	F

I-580	4-bromocinamilo	F	F	H	F
I-581	4-trifluorometilcinamilo	F	F	H	F
I-582	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	H	F
I-583	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	H	F
I-584	4-metoxicinamilo	F	F	H	F
I-585	4-etoxicinamilo	F	F	H	F
I-586	4-cianocinamilo	F	F	H	F
I-587	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	F	H	F
I-588	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	H	F
I-589	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	F	H	F
I-590	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	H	F
I-591	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	H	F
I-592	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	H	F
I-593	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	H	F
I-594	3-naftalen-2-il-allilo	F	F	H	F
I-595	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	F	H	F
I-596	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	F	H	F
I-597	3-piridin-4-il-allilo	F	F	H	F
I-598	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	F	H	F
I-599	4-clorobencilo	F	F	F	H
I-600	Cinamilo	F	F	F	H
I-601	4-clorocinamilo	F	F	F	H
I-602	4-fluorocinamilo	F	F	F	H
I-603	4-bromocinamilo	F	F	F	H
I-604	4-trifluorometilcinamilo	F	F	F	H
I-605	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	F	H
I-606	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	F	H
I-607	4-metoxicinamilo	F	F	F	H
I-608	4-etoxicinamilo	F	F	F	H

I-609	4-cianocinamilo	F	F	F	H
I-610	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	F	F	H
I-611	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	F	H
I-612	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	F	F	H
I-613	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	F	H
I-614	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	F	H
I-615	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	F	H
I-616	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	F	H
I-617	3-naftalen-2-il-allilo	F	F	F	H
I-618	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	F	F	H
I-619	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	F	F	H
I-620	3-piridin-4-il-allilo	F	F	F	H
I-621	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	F	F	H
I-622	4-clorobencilo	H	Cl	Cl	Cl
I-623	Cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-624	4-clorocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-625	4-fluorocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-626	4-bromocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-627	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-628	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-629	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-630	4-metoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-631	4-etoxicinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-632	4-cianocinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-633	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-634	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	Cl	Cl
I-635	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-636	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-637	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	Cl	Cl

I-638	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	Cl	Cl
I-639	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	H	Cl	Cl	Cl
I-640	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-641	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-642	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-643	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-644	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	Cl	Cl
I-645	4-clorobencilo	Cl	H	Cl	Cl
I-646	Cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-647	4-clorocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-648	4-fluorocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-649	4-bromocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-650	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-651	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-652	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-653	4-metoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-654	4-etoxicinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-655	4-cianocinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-656	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-657	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	Cl	Cl
I-658	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-659	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-660	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-661	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	Cl	Cl
I-662	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	Cl	H	Cl	Cl
I-663	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-664	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	Cl	Cl

I-665	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-666	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-667	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	Cl	Cl
I-668	4-clorobencilo	Cl	Cl	H	Cl
I-669	Cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-670	4-clorocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-671	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-672	4-bromocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-673	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-674	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-675	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-676	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-677	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-678	4-cianocinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-679	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-680	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	H	Cl
I-681	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-682	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-683	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-684	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	H	Cl
I-685	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	H	Cl
I-686	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-687	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-688	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-689	3-piridin-4-il-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-690	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	Cl	H	Cl
I-691	4-clorobencilo	Cl	Cl	Cl	H
I-692	Cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-693	4-clorocinamilo	Cl	Cl	Cl	H

I-694	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-695	4-bromocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-696	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-697	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-698	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-699	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-700	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-701	4-cianocinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-702	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-703	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	Cl	H
I-704	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-705	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-706	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-707	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	Cl	H
I-708	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	Cl	H
I-709	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-710	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-711	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-712	3-piridin-4-il-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-713	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	H
I-714	4-clorobencilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-715	Cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-716	4-clorocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-717	4-fluorocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-718	4-bromocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-719	4-trifluorometilcinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-720	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-721	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-722	4-metoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl

I-723	4-etoxicinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-724	4-cianocinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-725	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-726	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-727	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-728	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-729	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-730	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-731	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-732	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-733	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-734	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-735	3-piridin-4-il-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-736	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	Cl	Cl	Cl
I-737	4-clorobencilo	F	F	F	F
I-738	Cinamilo	F	F	F	F
I-739	4-clorocinamilo	F	F	F	F
I-740	4-fluorocinamilo	F	F	F	F
I-741	4-bromocinamilo	F	F	F	F
I-742	4-trifluorometilcinamilo	F	F	F	F
I-743	4-trifluorometoxicinamilo	F	F	F	F
I-744	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	F	F	F
I-745	4-metoxicinamilo	F	F	F	F
I-746	4-etoxicinamilo	F	F	F	F
I-747	4-cianocinamilo	F	F	F	F
I-748	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	F	F	F
I-749	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	F	F	F
I-750	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	F	F	F
I-751	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	F	F	F

I-752	3,5-dicloro-cinamilo	F	F	F	F
I-753	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	F	F	F
I-754	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	F	F	F
I-755	3-naftalen-2-il-allilo	F	F	F	F
I-756	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	F	F	F
I-757	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	F	F	F
I-758	3-piridin-4-il-allilo	F	F	F	F
I-759	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	F	F	F
I-760	4-clorobencilo	H	F	H	F
I-761	Cinamilo	H	F	H	F
I-762	4-clorocinamilo	H	F	H	F
I-763	4-fluorocinamilo	H	F	H	F
I-764	4-bromocinamilo	H	F	H	F
I-765	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H	F
I-766	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H	F
I-767	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H	F
I-768	4-metoxicinamilo	H	F	H	F
I-769	4-etoxicinamilo	H	F	H	F
I-770	4-cianocinamilo	H	F	H	F
I-771	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	H	F
I-772	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H	F
I-773	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	H	F
I-774	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H	F
I-775	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H	F
I-776	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H	F
I-777	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	F	H	F
I-778	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	H	F
I-779	3-(5-trifluorometil-piridin-2-	H	F	H	F

	il)-allilo				
I-780	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	H	F
I-781	3-piridin-4-il-allilo	H	F	H	F
I-782	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	H	F
I-783	4-clorobencilo	H	F	F	H
I-784	Cinamilo	H	F	F	H
I-785	4-clorocinamilo	H	F	F	H
I-786	4-fluorocinamilo	H	F	F	H
I-787	4-bromocinamilo	H	F	F	H
I-788	4-trifluorometilcinamilo	H	F	F	H
I-789	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	F	H
I-790	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	F	H
I-791	4-metoxicinamilo	H	F	F	H
I-792	4-etoxicinamilo	H	F	F	H
I-793	4-cianocinamilo	H	F	F	H
I-794	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	F	H
I-795	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	F	H
I-796	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	F	H
I-797	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	F	H
I-798	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	F	H
I-799	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	F	H

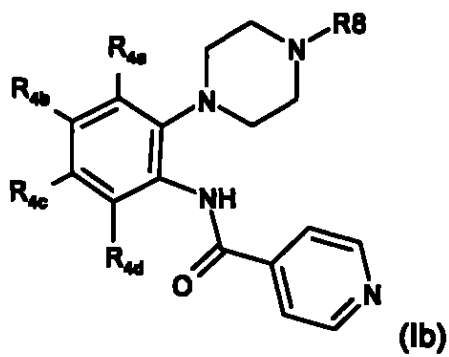
I-800	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	H	F	F	H
I-801	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	F	H
I-802	3-(5-trifluorometil-piridin-2- il)-allilo	H	F	F	H
I-803	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	F	H
I-804	3-piridin-4-il-allilo	H	F	F	H
I-805	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	F	H
I-806	4-clorobencilo	H	F	F	H
I-807	Cinamilo	H	H	F	F
I-808	4-clorocinamilo	H	H	F	F
I-809	4-fluorocinamilo	H	H	F	F
I-810	4-bromocinamilo	H	H	F	F
I-811	4-trifluorometilcinamilo	H	H	F	F
I-812	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	F	F
I-813	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	F	F
I-814	4-metoxicinamilo	H	H	F	F
I-815	4-etoxicinamilo	H	H	F	F
I-816	4-cianocinamilo	H	H	F	F
I-817	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	F	F
I-818	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	F	F
I-819	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	F	F
I-820	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	F	F
I-821	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	F	F
I-822	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	F	F
I-823	4-isopropiloxicarbonilamino- cinamilo	H	H	F	F
I-824	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	F	F
I-825	3-(5-trifluorometil-piridin-2- il)-allilo	H	H	F	F
I-826	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	F	F

I-827	3-piridin-4-il-allilo	H	H	F	F
I-828	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	F	F
I-829	4-clorobencilo	H	H	Cl	Cl
I-830	Cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-831	4-clorocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-832	4-fluorocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-833	4-bromocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-834	4-trifluorometilcinamilo	H	H	Cl	Cl
I-835	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-836	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-837	4-metoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-838	4-etoxicinamilo	H	H	Cl	Cl
I-839	4-cianocinamilo	H	H	Cl	Cl
I-840	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	Cl	Cl
I-841	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	Cl	Cl
I-842	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	Cl	Cl
I-843	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-844	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-845	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	Cl	Cl
I-846	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	H	Cl	Cl
I-847	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	Cl	Cl
I-848	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	Cl
I-849	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	Cl	Cl
I-850	3-piridin-4-il-allilo	H	H	Cl	Cl
I-851	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	Cl	Cl
I-852	4-clorobencilo	H	Cl	Cl	H
I-853	Cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-854	4-clorocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-855	4-fluorocinamilo	H	Cl	Cl	H

I-856	4-bromocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-857	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	Cl	H
I-858	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-859	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-860	4-metoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-861	4-etoxicinamilo	H	Cl	Cl	H
I-862	4-cianocinamilo	H	Cl	Cl	H
I-863	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	Cl	H
I-864	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	Cl	H
I-865	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	Cl	H
I-866	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-867	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-868	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	Cl	H
I-869	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	Cl	H
I-870	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	Cl	H
I-871	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	Cl	H
I-872	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	Cl	H
I-873	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	Cl	H
I-874	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	Cl	H
I-875	4-clorobencilo	H	Cl	H	Cl
I-876	Cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-877	4-clorocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-878	4-fluorocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-879	4-bromocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-880	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H	Cl
I-881	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-882	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-883	4-metoxicinamilo	H	Cl	H	Cl
I-884	4-etoxicinamilo	H	Cl	H	Cl

I-885	4-cianocinamilo	H	Cl	H	Cl
I-886	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	H	Cl
I-887	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H	Cl
I-888	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	H	Cl
I-889	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-890	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-891	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H	Cl
I-892	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H	Cl
I-893	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	H	Cl
I-894	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H	Cl
I-895	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H	Cl
I-896	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	H	Cl
I-897	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	H	Cl

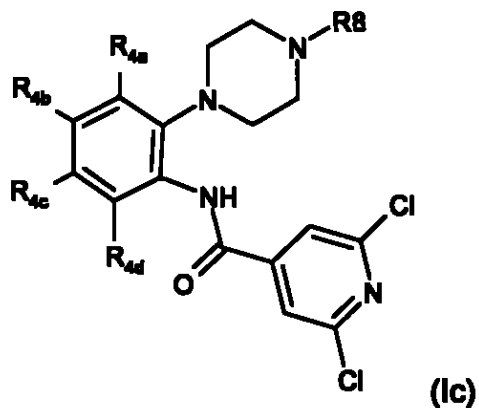
La Tabla II presenta 897 compuestos de la fórmula Ib



donde los valores de R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

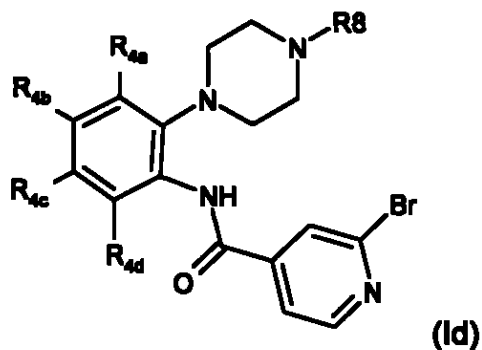
5

La Tabla III presenta 897 compuestos de la fórmula Ic



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1

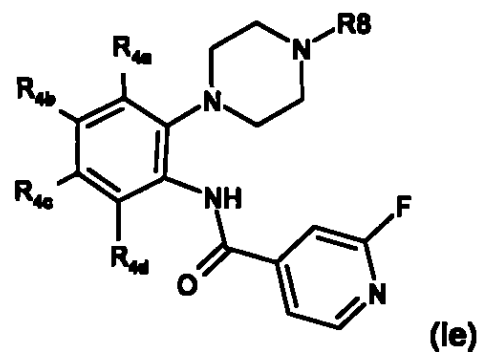
La Tabla IV presenta 897 compuestos de la fórmula Id



5

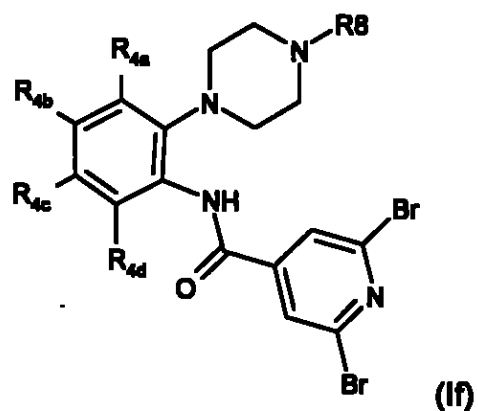
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1

La Tabla V presenta 897 compuestos de la fórmula Ie



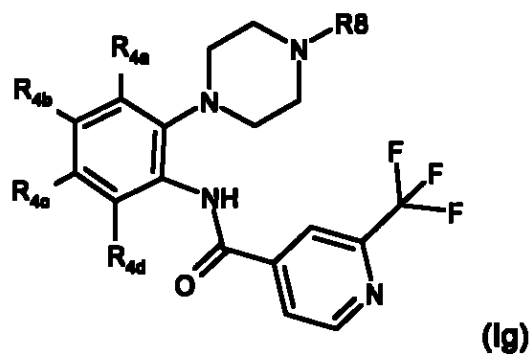
10 donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1

La Tabla VI presenta 897 compuestos de la fórmula If



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1

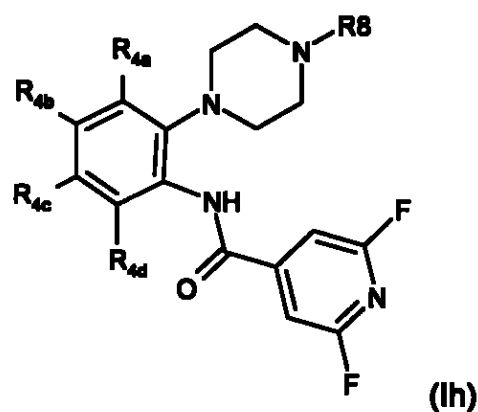
La Tabla VII presenta 897 compuestos de la fórmula Ig



5

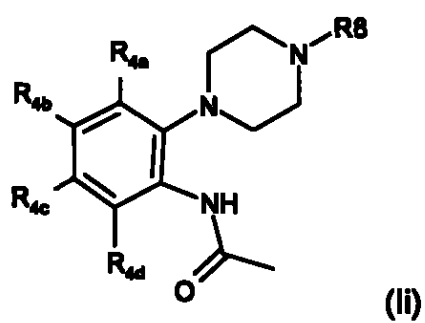
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla VIII presenta 897 compuestos de la fórmula Ih



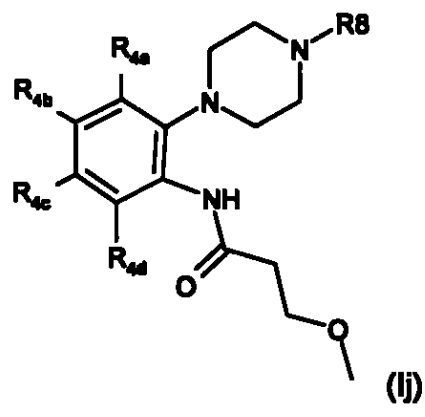
10 donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1

La Tabla IX presenta 897 compuestos de la fórmula li



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

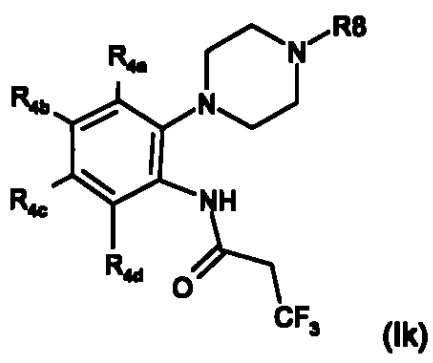
La Tabla X presenta 897 compuestos de la fórmula lj



5

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

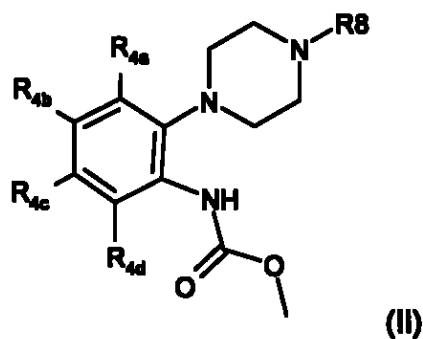
La Tabla XI presenta 897 compuestos de la fórmula lk



10

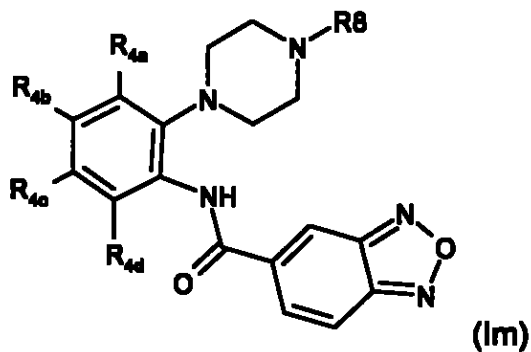
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XII presenta 897 compuestos de la fórmula ll



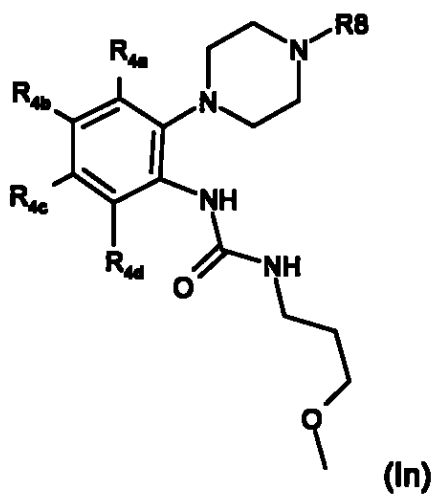
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XIII presenta 897 compuestos de la fórmula Im



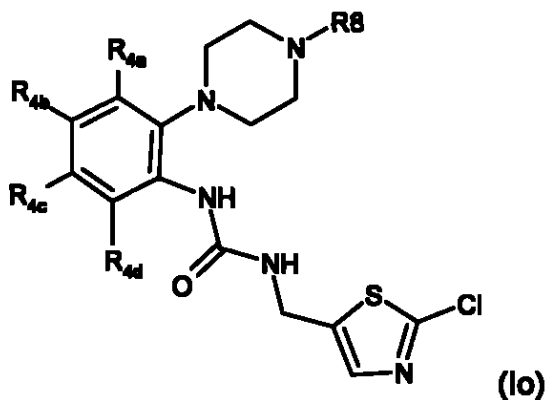
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XIV presenta 897 compuestos de la fórmula In



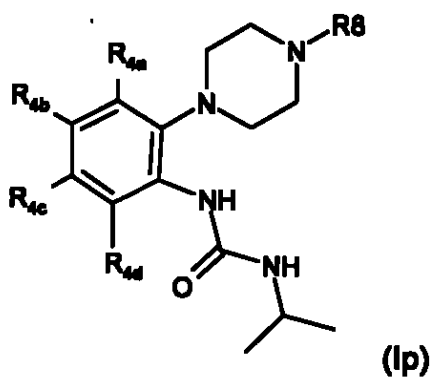
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XV presenta 897 compuestos de la fórmula lo



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

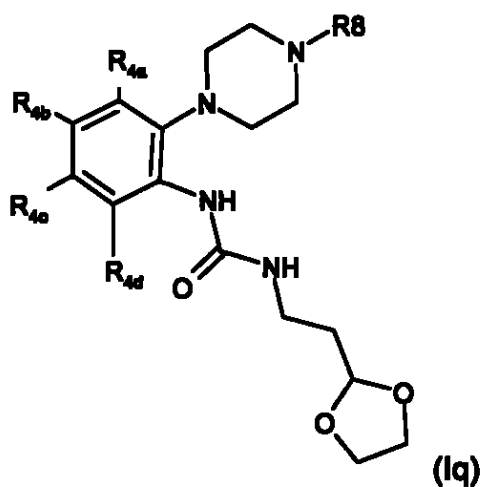
La Tabla XVI presenta 897 compuestos de la fórmula Ip



5

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

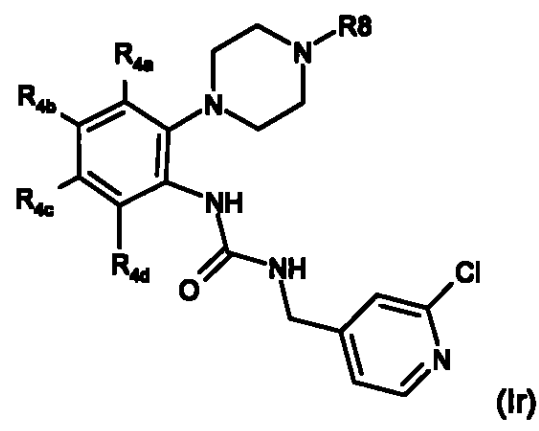
La Tabla XVII presenta 897 compuestos de la fórmula Iq



10

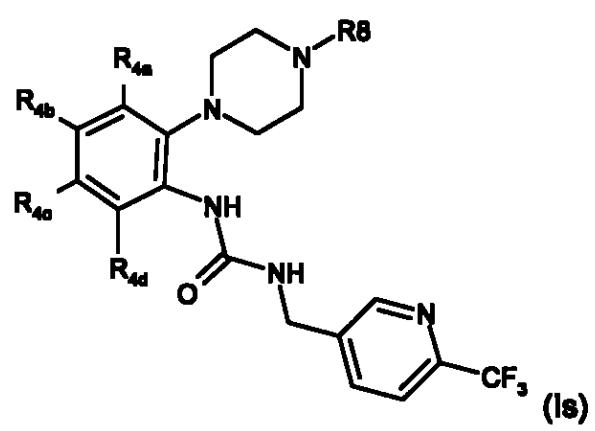
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XVIII presenta 897 compuestos de la fórmula Ir



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

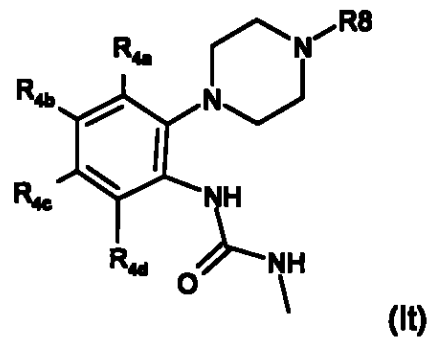
La Tabla XIX presenta 897 compuestos de la fórmula Is



5

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

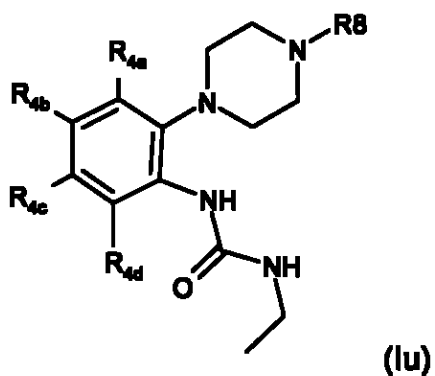
La Tabla XX presenta 897 compuestos de la fórmula It



10

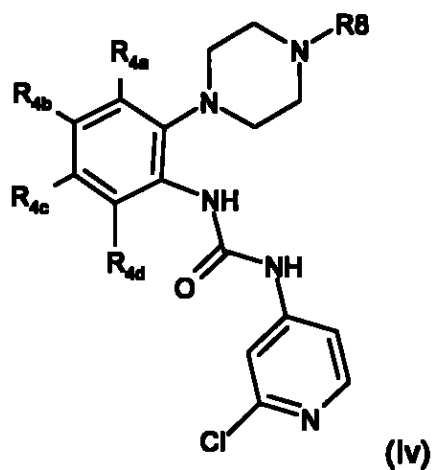
donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XXI presenta 897 compuestos de la fórmula Iu



donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

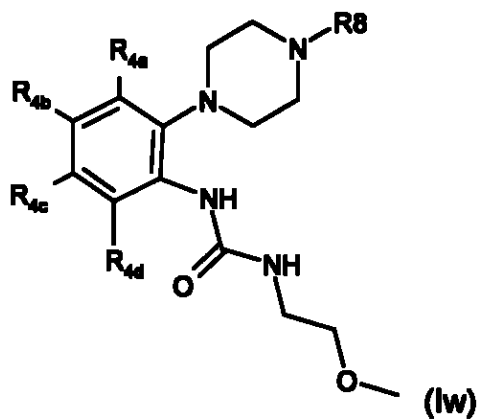
La Tabla XXII presenta 897 compuestos de la fórmula lv



5

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

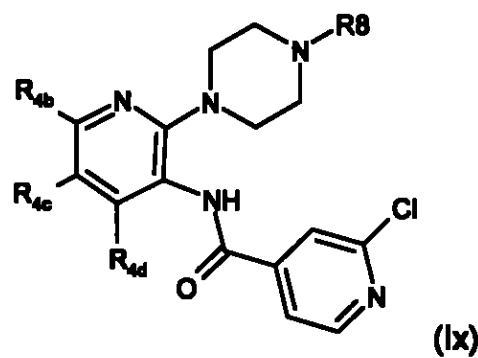
La Tabla XXIII presenta 897 compuestos de la fórmula lw



10

donde los valores de R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

La Tabla XXIV presenta 110 compuestos de la fórmula Ix



donde los valores de R⁸, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 24.

5

Tabla 24

Compuesto No	R ⁸	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
XXIV-1	Cinamilo	H	H	H
XXIV-2	4-clorocinamilo	H	H	H
XXIV-3	4-fluorocinamilo	H	H	H
XXIV-4	4-bromocinamilo	H	H	H
XXIV-5	4-trifluorometilcinamilo	H	H	H
XXIV-6	4-trifluorometoxicinamilo	H	H	H
XXIV-7	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	H	H
XXIV-8	4-metoxicinamilo	H	H	H
XXIV-9	4-etoxicinamilo	H	H	H
XXIV-10	4-cianocinamilo	H	H	H
XXIV-11	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	H	H
XXIV-12	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	H	H
XXIV-13	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	H	H
XXIV-14	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	H	H
XXIV-15	3,5-dicloro-cinamilo	H	H	H
XXIV-16	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	H	H
XXIV-17	4-isopropiloxicarbonilamino-	H	H	H

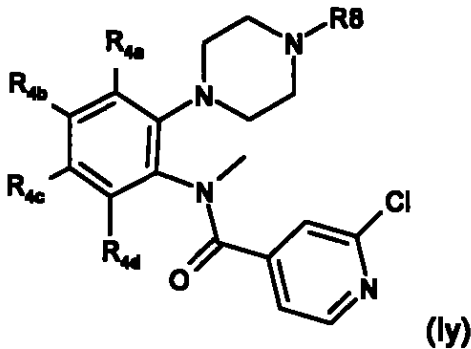
	cinamilo			
XXIV-18	3-naftalen-2-il-allilo	H	H	H
XXIV-19	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	H	H
XXIV-20	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	H	H
XXIV-21	3-piridin-4-il-allilo	H	H	H
XXIV-22	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	H	H
XXIV-23	Cinamilo	F	H	H
XXIV-24	4-clorocinamilo	F	H	H
XXIV-25	4-fluorocinamilo	F	H	H
XXIV-26	4-bromocinamilo	F	H	H
XXIV-27	4-trifluorometilcinamilo	F	H	H
XXIV-28	4-trifluorometoxicinamilo	F	H	H
XXIV-29	4-pentafluoroetoxicinamilo	F	H	H
XXIV-30	4-metoxicinamilo	F	H	H
XXIV-31	4-etoxicinamilo	F	H	H
XXIV-32	4-cianocinamilo	F	H	H
XXIV-33	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	F	H	H
XXIV-34	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	F	H	H
XXIV-35	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	F	H	H
XXIV-36	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	F	H	H
XXIV-37	3,5-dicloro-cinamilo	F	H	H
XXIV-38	5-fenil-penta-2,4-dienilo	F	H	H
XXIV-39	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	F	H	H
XXIV-40	3-naftalen-2-il-allilo	F	H	H
XXIV-41	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	F	H	H
XXIV-42	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	F	H	H
XXIV-43	3-piridin-4-il-allilo	F	H	H
XXIV-44	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	F	H	H

XXIV-45	Cinamilo	Cl	H	H
XXIV-46	4-clorocinamilo	Cl	H	H
XXIV-47	4-fluorocinamilo	Cl	H	H
XXIV-48	4-bromocinamilo	Cl	H	H
XXIV-49	4-trifluorometilcinamilo	Cl	H	H
XXIV-50	4-trifluorometoxicinamilo	Cl	H	H
XXIV-51	4-pentafluoroetoxicinamilo	Cl	H	H
XXIV-52	4-metoxicinamilo	Cl	H	H
XXIV-53	4-etoxicinamilo	Cl	H	H
XXIV-54	4-cianocinamilo	Cl	H	H
XXIV-55	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	Cl	H	H
XXIV-56	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	Cl	H	H
XXIV-57	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	Cl	H	H
XXIV-58	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	Cl	H	H
XXIV-59	3,5-dicloro-cinamilo	Cl	H	H
XXIV-60	5-fenil-penta-2,4-dienilo	Cl	H	H
XXIV-61	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	Cl	H	H
XXIV-62	3-naftalen-2-il-allilo	Cl	H	H
XXIV-63	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H
XXIV-64	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	Cl	H	H
XXIV-65	3-piridin-4-il-allilo	Cl	H	H
XXIV-66	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	Cl	H	H
XXIV-67	Cinamilo	H	F	H
XXIV-68	4-clorocinamilo	H	F	H
XXIV-69	4-fluorocinamilo	H	F	H
XXIV-70	4-bromocinamilo	H	F	H
XXIV-71	4-trifluorometilcinamilo	H	F	H
XXIV-72	4-trifluorometoxicinamilo	H	F	H
XXIV-73	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	F	H

XXIV-74	4-metoxicinamilo	H	F	H
XXIV-75	4-etoxicinamilo	H	F	H
XXIV-76	4-cianocinamilo	H	F	H
XXIV-77	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	F	H
XXIV-78	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	F	H
XXIV-79	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	F	H
XXIV-80	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	F	H
XXIV-81	3,5-dicloro-cinamilo	H	F	H
XXIV-82	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	F	H
XXIV-83	4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo	H	F	H
XXIV-84	3-naftalen-2-il-allilo	H	F	H
XXIV-85	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	F	H
XXIV-86	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	F	H
XXIV-87	3-piridin-4-il-allilo	H	F	H
XXIV-88	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	F	H
XXIV-89	Cinamilo	H	Cl	H
XXIV-90	4-clorocinamilo	H	Cl	H
XXIV-91	4-fluorocinamilo	H	Cl	H
XXIV-92	4-bromocinamilo	H	Cl	H
XXIV-93	4-trifluorometilcinamilo	H	Cl	H
XXIV-94	4-trifluorometoxicinamilo	H	Cl	H
XXIV-95	4-pentafluoroetoxicinamilo	H	Cl	H
XXIV-96	4-metoxicinamilo	H	Cl	H
XXIV-97	4-etoxicinamilo	H	Cl	H
XXIV-98	4-cianocinamilo	H	Cl	H
XXIV-99	3-(6-cloro-piridin-3-il)-allilo	H	Cl	H
XXIV-100	3-(4-clorofenil)-but-2-enilo	H	Cl	H
XXIV-101	3-(4-clorofenil)-3-fluoro-allilo	H	Cl	H
XXIV-102	3-cloro-4-fluoro-cinamilo	H	Cl	H

XXIV-103	3,5-dicloro-cinamilo	H	Cl	H
XXIV-104	5-fenil-penta-2,4-dienilo	H	Cl	H
XXIV-105	4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo	H	Cl	H
XXIV-106	3-naftalen-2-il-allilo	H	Cl	H
XXIV-107	3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H
XXIV-108	3-(5-cloro-piridin-2-il)-allilo	H	Cl	H
XXIV-109	3-piridin-4-il-allilo	H	Cl	H
XXIV-110	3-(2-Cloro-piridin-4-il)-allilo	H	Cl	H

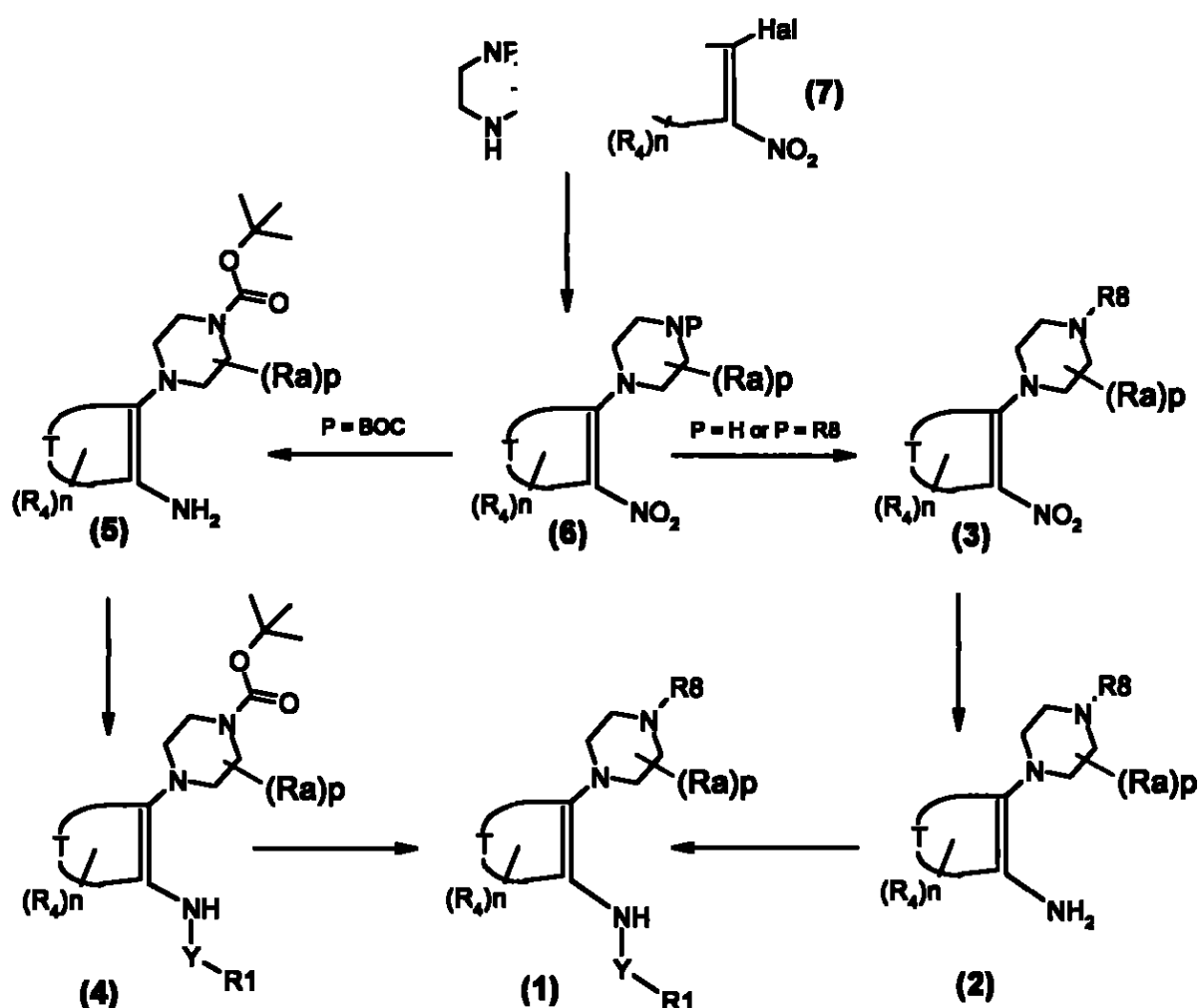
La Tabla XXV presenta 897 compuestos de la fórmula Iy



5 donde los valores de R⁸, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} se expresan en la Tabla 1.

Los compuestos de la invención se pueden realizar por medio de una variedad de métodos. Por ejemplo, los mismos se pueden elaborar de acuerdo con las reacciones del Esquema 1.

Esquema 1



Por consiguiente, un compuesto de la fórmula 1 se puede obtener a partir

5 de un compuesto de la fórmula 2 por reacción con una especie electrofílica adecuada. Los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo carbonilo se pueden formar por medio de la reacción de los compuestos de la fórmula 2 con un

derivado de ácido carboxílico de la fórmula $\text{R}_1\text{-C(O)-Z}$ donde Z es Cloruro, hidroxilo, alcoxi o aciloxi a una temperatura comprendida entre 0°C y 150°C de

10 manera opcional en un solvente orgánico como por ejemplo diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano, de manera opcional en presencia de una base amina terciaria como por ejemplo trietilamina o diisopropiletilamina y de manera opcional en presencia de un agente de acoplamiento como por ejemplo diciclohexilcarbodiimida. Los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo

15 carbonilo y R_1 es un sustituyente amino de la fórmula $\text{R}'\text{-NH-}$ se pueden formar

por medio de la reacción de los compuestos de la fórmula 4 con un isocianato de la fórmula $R'-N=C=O$ bajo condiciones similares. Los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo de la fórmula $S(O)_m$ se pueden formar a partir de los compuestos de la fórmula 2 por medio del tratamiento con los compuestos de la fórmula de $R1-S(O)_m-Cl$ bajo condiciones similares. Los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo tiocarbonilo y R1 es un sustituyente amino de la fórmula $R'-NH-$ se pueden formar por medio de la reacción de los compuestos de la fórmula 2 con un isotiocianato de la fórmula $R'-N=C=S$ bajo condiciones similares.

10 De una manera alternativa, los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo tiocarbonilo y R1 es un sustituyente de carbono se pueden formar por medio del tratamiento de los compuestos de la fórmula 1 donde Y es un grupo carbonilo y R1 es un sustituyente de carbono con un agente de tionación adecuado como por ejemplo el reactivo de Lawesson.

15 En los procedimientos que se mencionaron con anterioridad, los derivados de los ácidos de la fórmula $R1-C(O)-Z$, los isocianatos de la fórmula $R'-N=C=O$, los isotiocianatos de la fórmula $R'-N=C=S$ u los electrófilos de azufre de la fórmula $R1-S(O)_q-Cl$ son ya sea los compuestos conocidos o bien se pueden formar a partir de los métodos conocidos por una persona especializada en el arte.

20 Los compuestos de la fórmula 2 se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula 3 por medio de la reducción del grupo nitro, de acuerdo con los métodos conocidos por una persona especializada en el arte.

Los compuestos de la fórmula 3 se pueden obtener a partir de los compuestos de la fórmula 6 donde P es H por medio de la reacción con un agente alquilante de la fórmula $R8-L$, donde L es cloruro, bromuro, yoduro o un sulfonato (por ejemplo, mesilato o tosilato) o un grupo de salida similar a una temperatura comprendida entre la temperatura ambiente y los $100^{\circ}C$, de manera típica a $65^{\circ}C$, en un solvente orgánico tal como diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano en presencia de una base amina terciaria tal como trietilamina o diisopropiletilamina y de manera opcional catalizado por medio de sales de haluro como por ejemplo el yoduro de sodio, el yoduro de potasio o el yoduro de tetrabutilamonio. De una manera alternativa, un compuesto de la fórmula 6 donde P es H se puede hacer

25
30

reaccionar con un aldehído de la fórmula R_zCHO a una temperatura comprendida entre la temperatura ambiente y los $100^{\circ}C$ en un solvente orgánico como por ejemplo tetrahidrofurano o etanol o las mezclas de solventes en presencia de un agente reductor tal como el complejo borano-piridina, el borohidruro de sodio, el (5 triacetoxi)borohidruro de sodio, el sodium cianoborohidruro de sodio u otros similares, para producir un compuesto de la fórmula 3 donde R_8 es CH_2-R_z .

De manera alternativa, un compuesto de la fórmula 1 se puede obtener a partir de un compuesto de la fórmula 4 por medio de (1) la reacción con un ácido tal como el ácido trifluoroacético a temperatura ambiente en un solvente orgánico (10 tal como diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano seguido de neutralización de la mezcla de la reacción con una solución acuosa de una base inorgánica tal como el carbonato de sodio, el bicarbonato de sodio o un compuesto similar; luego (2) la reacción con un agente alquilante o un aldehído tal como se describió con anterioridad.

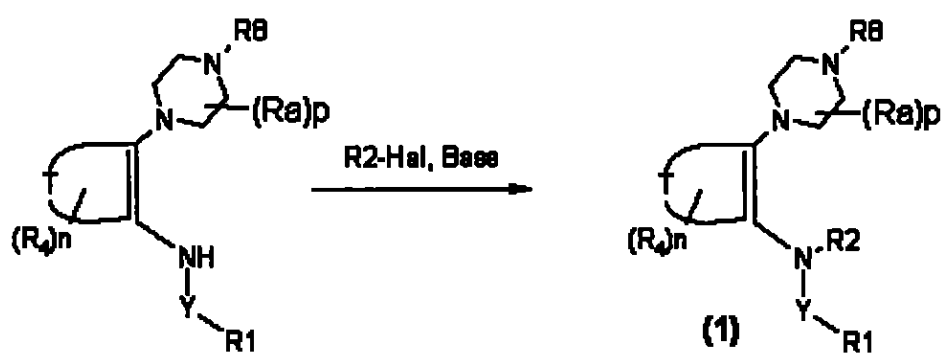
15 Los compuestos de la fórmula 4 se pueden formar por medio de la reacción de los compuestos de la fórmula 5 con un electrófilo adecuado, como se describió con anterioridad en el método para convertir los compuestos de la fórmula 2 en los compuestos de la fórmula 1.

Los compuestos de la fórmula 5 se pueden obtener a partir de los (20 compuestos de la fórmula 6 donde P es t-butoxicarbonilo por medio de la reducción del grupo nitro de acuerdo con los métodos conocidos.

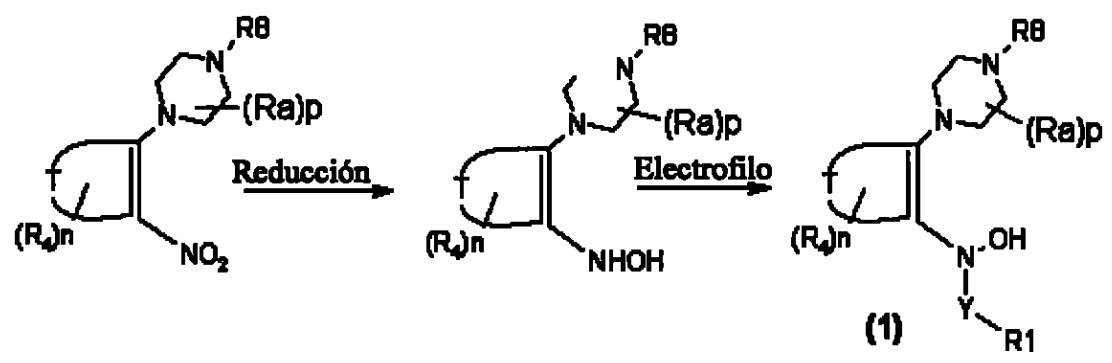
Los compuestos de la fórmula 6 se pueden obtener a partir de los compuestos de la fórmula 7 por medio de la reacción con piperazina ($P = H$) o N-BOC-piperazina ($P = t$ -butoxicarbonilo) a una temperatura comprendida entre 0° (25 C y $180^{\circ} C$, en un solvente tal como diclorometano, 1,2-dicloroetano, acetonitrilo, dimetilformamida o dimetilsulfóxido en presencia de una base tal como trietilamina, diisopropiletilamina o carbonato de potasio o en ausencia de la base.

Los compuestos de la fórmula 5, la formula 6 y la fórmula 7 son los compuestos conocidos o se pueden realizar a partir de los compuestos conocidos (30 por medio de los métodos conocidos.

Esquema 2



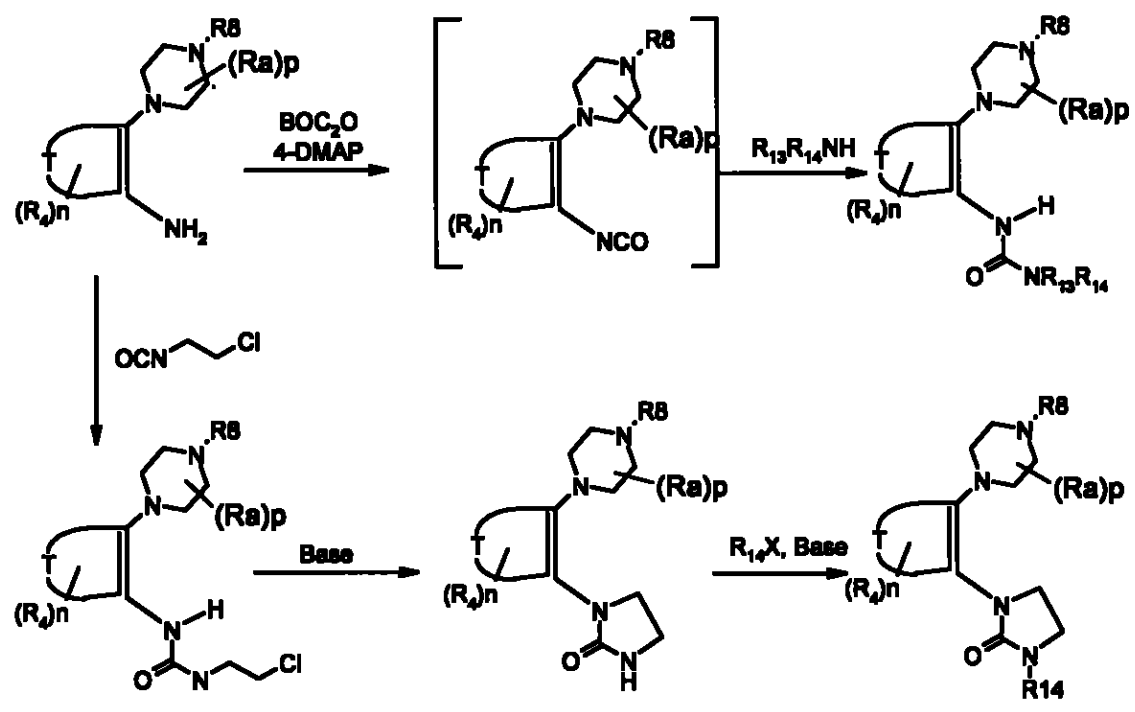
Esquema 3



Ciertos compuestos de la fórmula 2, de la fórmula 3 y de la fórmula 4 son
 5 novedosos y como tales forman un aspecto adicional de la invención.

La persona especializada en el arte reconocerá con rapidez que es posible
 convertir un compuesto de la fórmula 1 donde R_2 es H o un intermediario del
 Esquema 1 a otros compuestos de la fórmula 1. Los ejemplos de tales
 transformaciones se exponen en los Esquemas 2, 3 y 4 en los cuales los grupos
 10 R tienen los significados como se los define para un compuesto de la fórmula 1
 que figura con anterioridad.

Esquema 4



5

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar para combatir y controlar las infestaciones de las plagas de insectos tales como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera y también otras plagas de invertebrados, por ejemplo, las plagas de acarinas, nematodos y moluscos. De aquí en adelante los insectos, las acarinas, los nematodos y los moluscos en forma colectiva recibirán la denominación de plagas. Las plagas que pueden ser combatidas y controladas por medio del uso de los compuestos de la invención incluyen aquellas plagas asociadas con la agricultura (cuya denominación incluye el crecimiento de los cultivos para los productos alimenticios y de fibra), la horticultura y la cría de animales, los animales domésticos, la ingeniería forestal y el almacenamiento de productos de origen vegetal (como por ejemplo las frutas, los granos y la madera); aquellas plagas asociadas con el daño provocado por las estructuras hechas por el hombre y la transmisión de las enfermedades humanas y animales; y también las plagas dañinas (como por ejemplo las moscas).

10

15

20

Los ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por medio de los compuestos de la fórmula (I) incluyen: *Myzus persicae* (áfido), *Aphis gossypii* (áfido), *Aphis fabae* (áfido), *Lygus* spp. (capsids), *Dysdercus* spp. (cápsides), *Nilaparvata lugens* (saltamontes de las plantas), *Nephotettix inciticeps* (saltarilla), *Nezara* spp. (chinches de la madera), *Euschistus* spp. (chinches de la madera), *Leptocoris* spp. (chinches de la madera), *Frankliniella occidentalis* (tisanóptaro), *Thrips* spp. (tisanóptaro), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la papa de Colorado), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aonidiella* spp. (cocos), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (gorgojo europeo de los cereales), *Spodoptera littoralis* (cotton leafworm), *Heliothis virescens* (oruga del tabaco), *Helicoverpa armigera* (gusano del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano del algodón), *Silepta derogata* (insecto enrollador foliar del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla de espalda de diamante), *Agrotis* spp. (oruga nocturna), *Chilo suppressalis* (taladrilla del tallo del arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp. (gusanos de raíz), *Panonychus ulmi* (ácaro rojo europeo), *Panonychus citri* (ácaro rojo del cítrico), *Tetranychus urticae* (ácaro araña de dos manchas), *Tetranychus cinnabarinus* (ácaro araña carmín), *Philocoptruta oleivora* (ácaro roya del cítrico), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco), *Brevipalpus* spp. (ácaro plano de los cítricos), *Bophilus microplus* (garrapata del ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata del perro americano), *Ctenocephalides felis* (pulga del gato), *Liriomyza* spp. (minador de la hoja), *Musca domestica* (mosca común), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquito), *Culex* spp. (mosquito), *Lucilia* spp. (mosca azul), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas de los Mastotermitidae (por ejemplo *Mastotermes* spp.), los Kalotermitidae (por ejemplo *Neotermes* spp.), los Rhinotermitidae (por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, y *R. santonensis*) y los Termitidae (por ejemplo *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga de fuego), *Monomorium pharaonis* (hormiga del faraón), *Damalinea* spp. y *Linognathus* spp. (piojos mordedores y picadores), *Meloidogyne* spp. (nematodos del nódulo de la raíz), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos

del quiste), *Pratilenchus* spp. (nematodos de la lesión radicular), *Rhodopholus* spp. (nematodos gorgojos de la banana), *Tilenchulus* spp. (nematodos del cítrico), *Haemonchus contortus* (gusano del cuajo), *Caenorhabditis elegans* (anguilula del vinagre), *Trichostrongilus* spp. (nematodos gastrointestinales) and *Deroceras reticulatum* (babosa).

La invención por lo tanto suministra un método para combatir y controlar los insectos, las acarinas, los nematodos o los moluscos que comprende la aplicación de una cantidad que desde el punto de vista insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida es efectiva, de un compuesto de la fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de la fórmula (I), a una peste, un locus de peste, o a una planta susceptible de ataque por una peste, los compuestos de la fórmula (I) se utilizan con preferencia contra insectos, acarinas o nematodos.

El término "planta", tal como se lo utiliza en la presente invención incluye los plantones, los arbustos y los árboles.

A fin de aplicar un compuesto de la fórmula (I) como un insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida a una peste, un locus de peste o a una planta susceptible de ataque por una peste, un compuesto de la fórmula (I) es por lo general formulado en una composición que incluye, además del compuesto de la fórmula (I), un diluyente inerte o un portador adecuado y, de manera opcional, un agente activo de superficie (SFA). Los SFA son químicos que están en condiciones de modificar las propiedades de una interfaz (por ejemplo, las interfaces líquido / sólido, líquido / aire o líquido / líquido) al reducir la tensión de la interfaz y por lo tanto provocar cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersión, emulsificación y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto las formulaciones sólidas como las formulaciones líquidas) comprendan, por peso, 0.0001 a 95 %, Con mayor preferencia 1 a 85 %, por ejemplo 5 a 60%, de un compuesto de la fórmula (I). La composición se utiliza por lo general para el control de plagas tales como un compuesto de la fórmula (I) se aplica en una proporción de 0.1g a 10kg por hectárea, con preferencia de 1g a 6 kg por hectárea, con mayor preferencia de 1g a 1 kg por hectárea.

Cuando se utiliza en un abono para las semillas, se utiliza un compuesto de la fórmula (I) en una proporción de 0.0001g a 10g (por ejemplo 0.001 g ó 0.05 g),

con preferencia 0.005 g a 10g, Con mayor preferencia 0.005g a 4g, por kilogramo de semillas.

En otro aspecto, la presente invención suministra una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida que comprende una cantidad efectiva desde el punto de vista insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I) y un portador o un diluyente adecuado. La composición es con preferencia una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida.

Aún en otro aspecto la invención suministra un método para combatir y controlar pestes en un locus que comprende el tratamiento de las pestes o el locus de las pestes con una cantidad efectiva desde el punto de vista insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de una composición que comprende un compuesto de la fórmula (I). Los compuestos de la fórmula (I) se utilizan con preferencia contra insectos, acarinas o nematodos.

Las composiciones se pueden elegir a partir de una cantidad de tipos de formulaciones, que incluyen los polvos pulverizables (DP), los polvos solubles (SP), los gránulos solubles en agua (SG), los gránulos que se dispersan en agua (WG), los polvos que se pueden mezclar con el agua (WP), los gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), los concentrados solubles (SL), los líquidos que se pueden mezclar con aceite (OL), los líquidos de volumen ultra bajo (UL), los concentrados emulsionantes (EC), los concentrados que se pueden dispersar (DC), las emulsiones (tanto el aceite en agua (EW) como el agua en aceite (EO)), las micro emulsiones (ME), los concentrados en suspensión (SC), los aerosoles, las formulaciones con niebla/humo, las suspensiones en cápsulas (CS) y las formulaciones de tratamiento para semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier instancia dependerá del propósito particular encarado y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de la fórmula (I).

Los polvos pulverizables (DP) se pueden preparar por medio de la mezcla de un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo las arcillas naturales, el caolín, la pirofilita, la bentonita, la alúmina, montmorillonita, el kieselguhr, la tiza, las tierras diatomáceas, los fosfatos de calcio, los carbonatos de calcio y de magnesio, el sulfuro, el limo, las fluoritas, el talco y otros portadores

sólidos orgánicos e inorgánicos) y al triturar en forma mecánica la mezcla hasta obtener un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) se pueden preparar por medio de la mezcla de un compuesto de la fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (como por ejemplo el bicarbonato de sodio, el carbonato de sodio o el sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (como por ejemplo un polisacárido) y, de manera opcional, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes de dispersión o una mezcla de los agentes mencionados para mejorar la capacidad de dispersión / solubilidad del agua. Luego, la mezcla se tritura hasta convertirse en un polvo fino. Las composiciones similares también se pueden granular hasta formar gránulos solubles en agua (SG).

Los polvos que se pueden mezclar con el agua (WP) se pueden preparar por medio de la mezcla de un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes o portadores sólidos, uno o más agentes susceptibles de mezclarse con el agua y, con preferencia, uno o más agentes de dispersión y, de manera opcional, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. Luego, la mezcla se trituró hasta lograr un polvo fino. Las composiciones similares también se pueden granular hasta formar gránulos solubles en agua (WG).

Los gránulos (GR) se pueden formar ya sea por medio de la granulación de una mezcla de un compuesto de la fórmula (I) y uno o más diluyentes o portadores sólidos en polvo, o a partir de gránulos lisos preformados por medio de la absorción de un compuesto de la fórmula (I) (o de una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como la piedra pómez, las arcillas de attapulgita, arcilla de batán, kieselguhr, las tierras diatomáceas o las mazorcas de maíz molidas) o por medio de la adsorción de un compuesto de la fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) sobre un material de núcleo resistente (como por ejemplo las arenas, los silicatos, los carbonatos minerales, los sulfatos o los fosfatos) y el secado en caso de ser necesario. Los agentes que se utilizan por lo general para contribuir a la absorción o la adsorción incluyen los solventes (como por ejemplo los solventes alifáticos y aromáticos del petróleo, los alcoholes, los éteres, las cetonas y los

ésteres) y los agentes adhesivos (como por ejemplo los acetatos de polivinilo, los alcoholes de polivinilo, las dextrinas, los azúcares y los agentes vegetales). Uno o más aditivos también se pueden incluir en los gránulos (por ejemplo un agente emulsificador, un agente humectante o un agente de dispersión).

- 5 Los concentrados de dispersión (DC) se pueden preparar por medio de la disolución de un compuesto de la fórmula (I) en agua o en un solvente orgánico, como por ejemplo una cetona, un alcohol o un éter de glicol. Estas soluciones pueden contener un agente de superficie activo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para evitar la cristalización en un tanque rociador).
- 10 Los concentrados que se pueden emulsionar (EC) o las emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar por medio de la disolución de un compuesto de la fórmula (I) en un solvente orgánico (que de manera opcional contenga uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de los agentes mencionados). Los solventes orgánicos adecuados
- 15 para utilizarse en EC incluyen los hidrocarburos aromáticos (como por ejemplo los alquilbencenos o los alquilnaftalenos, cuyos ejemplos se hallan en SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una Marca Comercial Registrada), las cetonas (como por ejemplo la ciclohexanona o la metilciclohexanona) y los alcoholes (como por ejemplo el alcohol de bencilo, el
- 20 alcohol de furfurilo o el butanol), las N-alquilpirrolidonas (como por ejemplo la N-metilpirrolidona o la N-octilpirrolidona), las dimetil amidas de los ácidos grasos (como por ejemplo C₈-C₁₀ ácido graso dimetilamida) y los hidrocarburos clorinados. Un producto EC puede emulsionar de manera espontánea en
- 25 agregado a agua, para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir la aplicación de rociado a través del equipo adecuado. La preparación de un EW implica la obtención de un compuesto de la fórmula (I) ya sea como un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, de manera típica por debajo de los 70 °C) o en la solución (al disolverlo en un solvente adecuado) y luego emulsionando el líquido o la
- 30 solución resultante en agua que contenga uno o más SFA, bajo alto corte, para producir una emulsión. Los solventes adecuados para utilizar en EW incluyen los aceites vegetales, los hidrocarburos clorinados (como por ejemplo los

clorobencenos), los solventes aromáticos (tales como los alquilbencenos o los alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos adecuados que tengan una baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una
5 mezcla de uno o más solventes con uno o más SFA, para producir de manera espontánea una formulación líquida isotrópica estable desde el punto de vista termodinámico. Un compuesto de la fórmula (I) está presente de manera inicial ya sea en el agua o en la mezcla de solvente/SFA. Los solventes adecuados para utilizar en ME incluyen aquéllos que con anterioridad se han descripto para
10 utilizar en EC o en EW. Un ME puede ser ya sea un sistema de aceite en agua o bien un sistema de agua en aceite (qué sistema está presente puede determinarse por medio de mediciones de conductividad) y puede ser adecuado para mezclar pesticidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Un ME es adecuado para la dilución en agua, ya sea
15 permaneciendo como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de la fórmula (I). Los SC se pueden preparar por medio de molienda
20 de bolas o molienda de perlas el compuesto sólido de la fórmula (I) en un medio adecuado, de manera opcional con uno o más agentes de dispersión, hasta producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Uno o más agentes humectantes se pueden incluir en la composición y un agente de suspensión se puede incluir para reducir la velocidad a la cual se sedimentan las partículas. De
25 una manera alternativa, un compuesto de la fórmula (I) se puede moler seca o agregado a agua, que contenga los agentes que se describieron con anterioridad, hasta producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de la fórmula (I)
30 también se puede disolver o dispersar en un medio adecuado (por ejemplo agua o líquido que se puede mezclar en agua, como por ejemplo el *n*-propanol) hasta

suministrar las composiciones para uso en bombas de rociado no presurizadas accionadas a mano.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede mezclar en el estado seco con una mezcla pirotécnica hasta formar una composición adecuada para generar, en
5 un espacio incluído, un humo que contenga el compuesto.

Las suspensiones en cápsula (CS) se pueden preparar de una manera similar a la preparación de las formulaciones de EW pero con una etapa adicional de polimerización de manera tal que se obtenga una dispersión acuosa de las gotitas de aceite, en la cual cada gotita de aceite es encapsulada por una
10 estructura polimérica y contiene un compuesto de la fórmula (I) y, de manera opcional, un portador o diluyente del mismo. La estructura polimérica se puede producir ya sea por medio de una reacción de interfaz de policondensación o por medio de un procedimiento de coacervación. Las composiciones se pueden suministrar para la liberación controlada del compuesto de la fórmula (I) y las
15 mismas se pueden utilizar para el tratamiento de las semillas. Un compuesto de la fórmula (I) se puede formular también en una matriz polimérica biodegradable para suministrar la liberación lenta y controlada del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición (por ejemplo por medio del mejoramiento
20 de la humedad, la retención o la distribución en las superficies; la resistencia a la lluvia en las superficies tratadas; o la captación o la movilidad de un compuesto de la fórmula (I)). Tales aditivos incluyen los agentes activos de la superficie, los aditivos del rociado sobre la base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites naturales de las plantas (como por ejemplo los porotos de soja
25 y el aceite de semilla de colza), y las mezclas de éstos con otros adyuvantes bio-realizadores (ingredientes que pueden contribuir a o modificar la acción de un compuesto de la fórmula (I)).

Un compuesto de la fórmula (I) también se puede formular para utilizar como un tratamiento para las semillas, por ejemplo como una composición en
30 polvo, que incluya un polvo para el tratamiento de las semillas secas (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo que se disperse en agua para el tratamiento acuoso (WS), o como una composición líquida, que incluya un

concentrado que fluya (FS), una solución (LS) o una suspensión en cápsula (CS). Las preparaciones de DS, SS, WS, FS y las composiciones de LS son muy similares a las de DP, SP, WP, SC respectivamente y a las composiciones DC que han sido descritas con anterioridad. Las composiciones para tratar las
5 semillas pueden incluir un agente para asistir a la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera que forma una película).

Los agentes humectantes, los agentes de dispersión y los agentes de emulsión pueden ser SFA de superficie del tipo catiónico, aniónico, amfotérico o no iónico.

10 Los AFS adecuados del tipo catiónico incluyen los compuestos cuaternarios de amonio (por ejemplo el bromuro de amonio de cetiltrimetilo), las imidazolinas y las sales de amino.

Las SFA aniónicas adecuadas incluyen las sales de álcalis de metales de los ácidos grasos, las sales de los monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por
15 ejemplo el lauril sulfato de sodio), las sales de los compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo el dodecibencenosulfonato de sodio, el dodecibencenosulfonato de calcio, el butilnaftaleno sulfonato y las mezclas de di-
/isopropil- y tri-isopropil-naftaleno sulfonatos de sodio), los sulfatos de éter, los sulfatos de éter de alcohol (por ejemplo el laureth-3-sulfato de sodio), los
20 carboxilados de éter (por ejemplo el laureth-3-carboxilato de sodio), los ésteres de fosfato (los productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y el ácido fosfórico (predominantemente mono ésteres) o el pentóxido de fósforo (predominantemente di-ésteres), por ejemplo la reacción entre el alcohol lauril y el
ácido tetrafosfórico; de manera adicional estos productos pueden ser etoxilados),
25 los sulfosuccinamatos, la parafina o los sulfonatos de olefina, los tauratos y los lignosulfonatos.

Los SFA adecuados del tipo amfotérico incluyen las betaínas, los propionatos y los glucinatos.

Los SFA adecuados del tipo no iónico incluyen los productos de
30 condensación de los óxidos de aquileno, tales como el óxido de etileno, el óxido de propileno, el óxido de butileno o las mezclas de los mismos, con los alcoholes grasos (como por ejemplo el alcohol oleico o el alcohol cetilo) o con los

alquilfenoles (como por ejemplo el octilfenol, el nonilfenol, o el octilcresol); los ésteres parciales derivados de los ácidos grasos de cadena larga o los anhídridos de hexitol; los productos de la condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; los polímeros en bloque (que comprenden el óxido de etileno y el óxido de propileno); las alcanolamidas; los ésteres simples (por ejemplo los ésteres de polietilenglicol de los ácidos grasos); los óxidos de aminas (por ejemplo el óxido de lauril dimetilamina); y las lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados incluyen los coloides hidrofílicos (como los polisacáridos, la polivinilpirrolidona o la carboximetilcelulosa de sodio) y las arcillas que aumentan (como por ejemplo la bentonita o la attapulgita).

Un compuesto de la fórmula (I) se puede aplicar por medio de cualquiera de los medios conocidos de aplicación de compuestos pesticidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formular o no formular, a las plagas o a un locus de las plagas (como por ejemplo un hábitat de las plagas, o una planta que crece responsable de la infestación por las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, los tallos, las ramas o las raíces, a la semilla antes de ser plantada o a otros medios en los cuales las plantas están creciendo o deben ser plantadas (como por ejemplo el suelo que rodea a las raíces, el suelo en general, el agua de los arrozales o los sistemas de cultivo hidropónico), en forma directa o pueden ser rociados, espolvoreados, aplicados por medio de desinfección, aplicados como una crema o una formulación en pasta, aplicados como un vapor o aplicados a través de la distribución o la incorporación de una composición (como por ejemplo como una composición granular o una composición empaquetada en una bolsa soluble en agua) en el suelo o en un medio acuoso.

Un compuesto de la fórmula (I) también se puede inyectar a las plantas o se puede rociar sobre la vegetación utilizando técnicas de rociado electrodinámico u otros métodos de bajo volumen, o se pueden aplicar por medio de sistemas de irrigación aéreos o por tierra.

Las composiciones para uso como preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) son por lo general suministradas en forma de un concentrado que contenga una alta proporción del ingrediente activo, siendo el concentrado agregado al agua antes de su uso. Estos concentrados, que pueden

incluir DC, SC, EC, EW, ME SG, SP, WP, WG y CS, se requieren a menudo para resistir el almacenamiento durante períodos prolongados, después de un almacenamiento de ese tipo, para ser capaces de adición al agua para formar preparaciones no acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo
5 suficiente para permitirles ser aplicados pro medio de un equipo convencional de rociado. Tales preparaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de la fórmula (I) (por ejemplo 0.0001 a 10%, por peso) que dependen del propósito para el cual se van a utilizar.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede utilizar en mezclas con
10 fertilizantes (por ejemplo los fertilizantes que contengan nitrógeno-, potasio- o fósforo). Los tipos de formulaciones adecuadas incluyen los gránulos de los fertilizantes. Las mezclas contienen de manera adecuada hasta un 25 % por peso del compuesto de la fórmula (I).

Por lo tanto la invención también proporciona una composición de
15 fertilizante que comprende un terfertilizante y un compuesto de la fórmula (I).

Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que tienen actividad biológica, por ejemplo los micronutrientes o los compuestos que tienen actividad fungicida o que poseen actividad que regula el crecimiento de la planta, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

20 El compuesto de la fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede ser agregado con uno o más ingredientes activos adicionales como un pesticida, fungicida, herbicida o regulador del crecimiento de la planta donde corresponda. Un ingrediente activo adicional puede: proporcionar una composición que tenga un espectro de actividad más amplio o una mayor
25 persistencia a un locus; sinergizar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo al aumentar la velocidad del efecto o venciendo la repelencia) del compuesto de la fórmula (I); o contribuir a vencer o impedir el desarrollo de la resistencia a los componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad de la composición a la cual esté destinado. Los
30 ejemplos de los pesticidas adecuados incluyen los siguientes:

a) Piretroides, como la permetrina, la cipermetrina, el fenvalerato, el esfenvalerato, el deltametrin, el cihalotrin (en particular lambda-cialotrin), el

- bifentrin, el fenpropatrin, el ciflutrin, el teflutrin, los piretroides seguros para los peces (por ejemplo el etofenprox), el piretrin natural, el tetrametrin, el s-bioalletrin, el fenflutrin, el pralletrin o el 5-bencilo-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenemetil)ciclopropano carboxilato;
- 5 b) Organofosfatos, como por ejemplo, los profenofos, los sulprofos, el acefato, el metil paratión, el azinfos-metilo, el demetón-s-metilo, el heptenofos, el tiometón, el fenamifos, el monocrotofos, el profenofos, el triazofos, el metamidofos, el dimetoato, el fosfoalmidón, el malatión, el clorpirifos, la fosalona, el terbufos, el fensulfotión, el fonofos, el forato, el foxim, el pirimifos-metilo, el pirimifos-etilo, el
- 10 fenitrotión, el fostiazato o el diazinón;
- c) Los carbamatos (que incluyen los carbamatos de arilo), tales como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofurano, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfano, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomil o oxamil;
- d) Las ureas de benzoilo, tales como diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron,
- 15 flufenoxuron o clorfluazuron;
- e) Los compuestos tin orgánicos, como por ejemplo cihexatin, óxido de fenbutatin o azociclotin;
- f) Los pirazoles, tales como tēbufenpirad y fenpiroximato;
- g) Los macrólidos, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo
- 20 abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, espinosad or azadiractina;
- h) Las hormonas o las fenormonas;
- i) Los compuestos de organoclorina tales como endosulfano, hexacloruro de benceno , DDT, clordano o dieldrina;
- 25 j) Las amidinas, tales como clordimeform o amitraz;
- k) Los agentes fumigantes, tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;
- l) Los compuestos de cloronicotinil tales como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitenpiramo o tiametoxam;
- 30 m) Las diacilhidrazinas, tales como tēbufenozide, cromafenozide o metoxifenozone;
- n) Los éteres de difenilo, como por ejemplo diofenolan o piriproxifeno;

- o) El indoxacarb;
- p) El clorfenapir; o
- q) La pimetrozina.

Además de las principales clases químicas de pesticidas que se enumeraron con anterioridad, otros pesticidas que tienen objetivos particulares se pueden emplear en la composición, si es adecuado para la utilidad deseada de la composición. Por ejemplo, se pueden emplear los insecticidas selectivos para cultivos particulares, insecticidas específicos para el gorgojo (como por ejemplo cartap) o los insecticidas específicos de los saltamontes (tales como el buprofezin) para utilizar en el arroz. De manera alternativa se pueden incluir en las composiciones también los insecticidas o los acaricidas específicos para las etapas / especies particulares de insectos (por ejemplo los ovo-larvicidas acaricidas, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifon; los motilicidas acaricidas, tales como dicofol o propargita; acaricidas, tales como bromopropilato o clorobenciloato; o los reguladores del crecimiento, tales como hidrametilón, ciromazina, metopreno, clorfluazurón o diflubenzurón).

Los ejemplos de los compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición de la invención son (*E*)-*N*-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-*N,N*-dimetil-6-trifluorometil-benzimidazol-1-sulfonamida, α -[*N*-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]- γ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-*p*-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamida), 3-5-dicloro-*N*-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), *N*-alil-4,5,-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida (MON65500), *N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxy)propionamida (AC382042), *N*-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropano carboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorfo, anilazina, azaconazol, azoxistrobin, benalaxil, benomil, bixoxazol, bitertanol, blastidín S, bromuconazol, bupirinato, captafol, captan, carbendazim, clorhidrato de carbendazim, carboxin, carpropamid, carvone, CGA41396, CGA41397, chinometionato, clorotalonil, clorozolinato, clozilacon, los compuestos que contienen cobre tales como el oxiclورو de cobre, el oxiquinolato de cobre, el sulfato de cobre, el talato de cobre y la mezcla Bordeaux, cimoxanil,

ciproconazol, ciprodinil, debacarb, di-2-piridil disulfido 1,1'-dióxido, diclofluánida,
 diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim,
 O,O-di-/so-propil-S-bencilo tiofosfato, dimefluazol, dimetconazol, dimetomorf,
 dimetirimol, diniconazol, dinocap, dítianon, cloruro de amonio dodecil dimetil,
 5 dodemorfo, dodina, doguadina, edifenfos, epoxiconazol, etirimol,
 etil(Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioehilideneaminoxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato,
 etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol,
 fenfuram, fenhexamid (KBR2738), fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato
 de fentin, hidróxido de fentin, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover,
 10 fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, fuberidazol,
 furalaxil, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxisoxazol, himexazol, imazalil,
 imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfos,
 iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), isopropanil butil carbamato, isoprotiolano,
 kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb,
 15 maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metiram,
 metiram-zinc, metominostrobin, miclobutanilo, neoasozin, dimetilditiocarbamato
 de níquel, nitrothal-/isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos de organomercurio,
 oxadixil, oxasulfuron, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato,
 penconazol, pencicurón, óxido de fenazina, fosetil-Al, ácidos de fósforo, ftalido,
 20 picoxistrobin (ZA1963), polioxin D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona,
 propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofos, pirifenox,
 pirimetanilo, piroquilon, piroxifur, pirrolnitrin, compuestos cuaternarios de amonio,
 quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, esipconazol (F-155), pentaclorofeno de
 sodio, espiroxamina, estreptomycin. Sulfuro, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno,
 25 tetraconazol, tiabendazol, tífuzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato—
 metilo, tiram, timibenconazol, tolclófos-metilo, tolilfluánid, triadimefon, triadimenol,
 triazbutilo, triazoxido, triciclazol, tridemorfo, trifloxistrobin (CGA279202), triforina,
 triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden mezclar con el suelo, la turba
 30 u otros medios de raíces para la protección de las plantas contra las
 enfermedades micóticas originadas en las semillas, originadas en el suelo o en el
 follaje.

Los ejemplos de los sinergistas adecuados para utilizarse en las composiciones incluyen piperonil butóxido, sesamex, safroxan y dodecil imidazol.

Los herbicidas y los reguladores del crecimiento de las plantas que son adecuados para la inclusión en las composiciones dependerán del objetivo que se pretenda y del efecto que se requiera.

Un ejemplo de un herbicida selectivo del arroz que se puede incluir es el propanilo. Un ejemplo de un regulador del crecimiento de las plantas para utilizar en el algodón es PIX™.

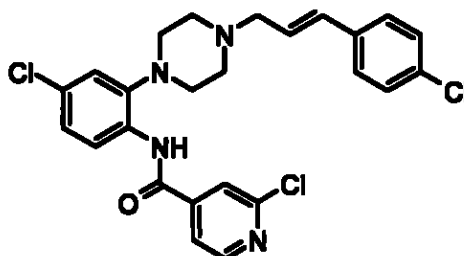
Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos los cuales tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes de tal manera que no se presten con facilidad para el mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulación. Por ejemplo, donde un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro un líquido insoluble en agua, sin embargo puede ser posible dispersar cada ingrediente activo en la misma fase continua por medio de la dispersión del ingrediente activo sólido como una suspensión (utilizando un análogo de la preparación al de un SC) pero dispersando el ingrediente activo líquido como una emulsión (utilizando una preparación análoga a la de un EW). La composición resultante es una formulación suspoemulsión (SE).

La invención se ilustra por medio de los ejemplos que figuran a continuación:

Los datos del espectro de masa se obtuvieron a partir de los compuestos seleccionados de los ejemplos siguientes utilizando LCMS: LC5: 254nm - gradiente 10 % A a 100 % B A=H₂O+0.01%HCOH B=CH₃CN/CH₃OH+0.01%HCOH electrospray positiv 150-1000 m/z.

EJEMPLO 1

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alilo]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida.



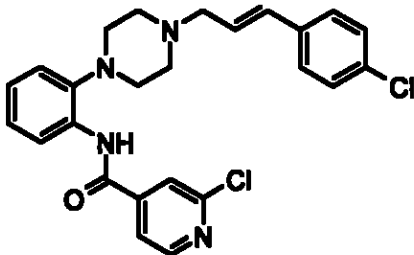
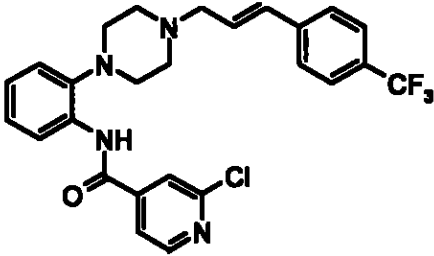
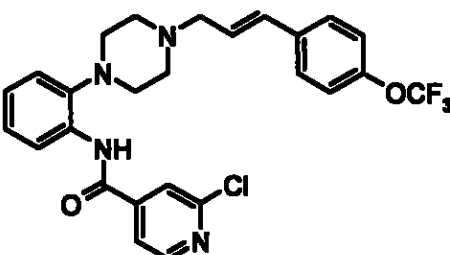
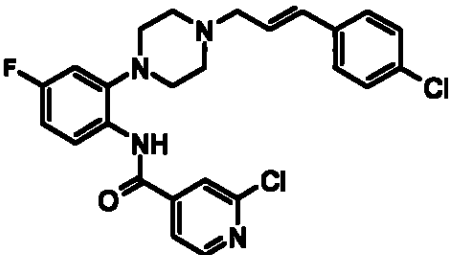
Paso A: Se agregó trietilamina (4.2 ml) a una solución revuelta de 2,4-dicloronitrobenceno (1.9 g) y 1-t-butoxicarbonil-piperazina (2.2 g) en dimetilsulfóxido (18 ml) bajo N₂. La solución resultante se revolvió a 70°C durante 5 48 horas y luego se enfrió hasta la temperatura ambiente. Se agregó agua y se extrajo la mezcla tres veces con acetato de etilo; las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 8:2) para proporcionar éster de 4-(5-cloro-2-nitrofenilo)-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (2.6 g) como una espuma. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (br s, 4H), 3.5 (br s, 4H), 6.9 (d, J = 10 Hz, 1H), 7.0 (s, 1 H), 7.7 (d, J = 10 Hz, 1H); MS (ES+) 242/244 (M+H⁺-CO₂-isobuteno), 286/288 (M+H⁺-isobuteno).

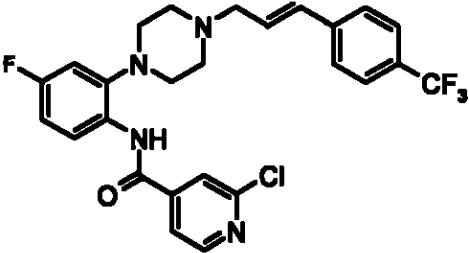
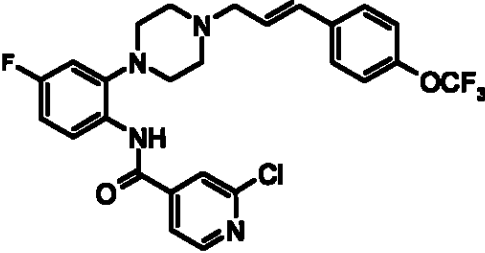
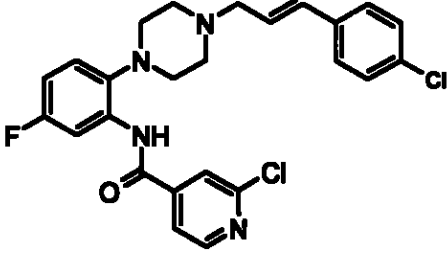
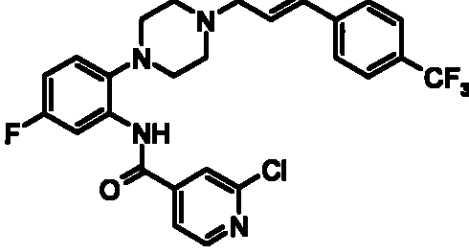
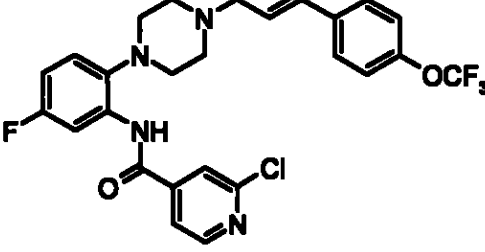
Paso B: A una suspensión revuelta del compuesto obtenido en el Paso A (2.5 g) en etanol (40 ml) y agua (30 ml) a 60°C se agregó ditionita de sodio (7.6 g). La 15 mezcla resultante se revolvió a 60 ° C durante 1 hora y luego se eliminó el etanol *in vacuo*. La suspensión se extrajo tres veces con acetato de etilo, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 1:1) para proporcionar éster de 4-(2-Amino-5-cloro-fenil)- 20 piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (1.0 g) como cristales de color blanco. M.p. 125-127 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.8 (m, 4H), 3.5 (m, 4H), 3.9 (s, 2H), 6.6 (d, J = 10 Hz, 1H), 6.8 (d, J = 10 Hz, 1H), 6.9 (s, 1H); MS (ES+) 212/214 (M + H⁺-CO₂-isobuteno), 256/258 (M+H⁺-isobuteno), 312/314 (M + H⁺).

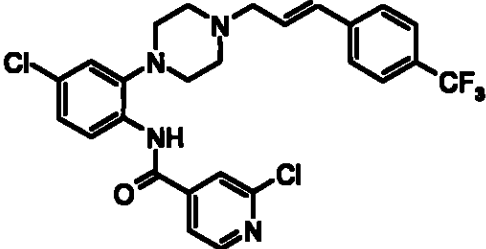
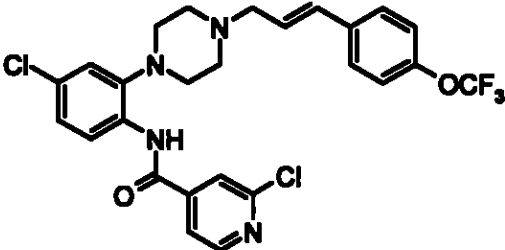
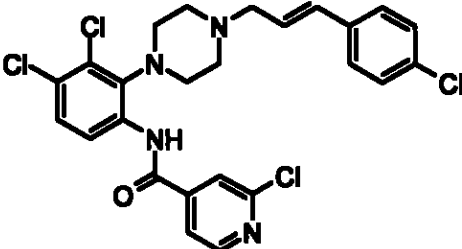
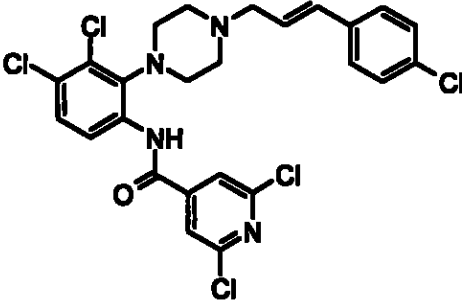
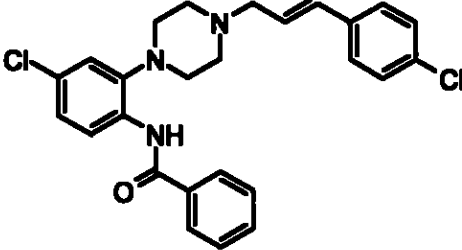
Paso C: Se agregó trietilamina (2 ml) a una solución revuelta del compuesto 25 obtenido en el Paso B (1.0 g) en diclorometano (20 ml); la solución se enfrió hasta 0 ° C y se agregó 2-cloro-isonicotinoil cloruro (1.2 g) . La mezcla resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 12 horas, se volcó en agua, se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre

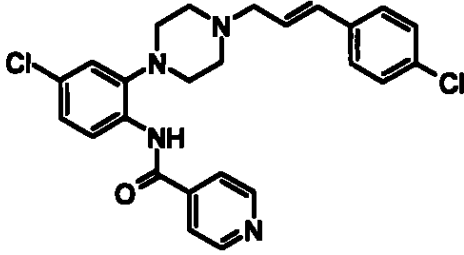
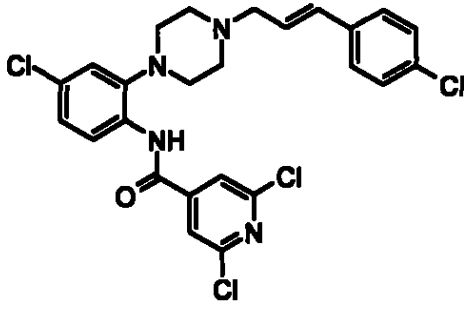
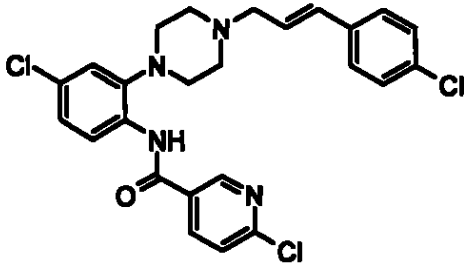
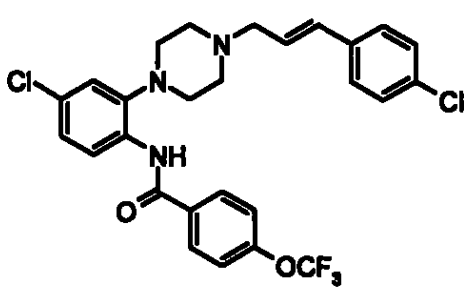
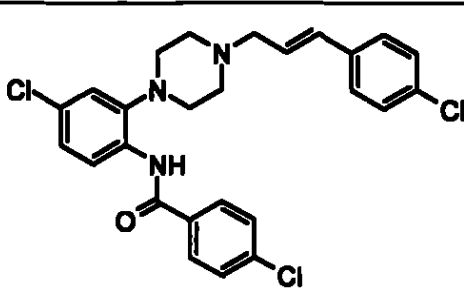
- sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 7:2) para proporcionar éster de 4-[5-Cloro-2-[(2-cloro-piridina-4-carbonilo)-amino]-fenil]-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo, el cual se volvió a cristalizar (845 mg) a partir del hexano / acetato de etilo para dar cristales blancos. M.p. 185-189 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (m, 4H), 3.7 (m, 4H), 7.2 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.2 (dd, J = 1.5, 10 Hz, 1H), 7.6 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.8 (s, 1H), 8.5 (d, J = 10 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 9.4 (s, 1H, NH); MS (ES+) 351/353 (M+H⁺-CO₂-isobuteno), 395/397 (M+H⁺-isobuteno), 451/453 (M+H⁺).
- 10 Paso D: Una solución del compuesto obtenido en el Paso C (200 mg) en diclorometano (10 ml) se trató con ácido trifluoroacético (0.3 ml) durante 48 horas a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se basificó con bicarbonato de sodio acuoso saturado, se extrajo dos veces con diclorometano, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se disolvió en acetonitrilo (20 ml), diisopropiletilamina (0.16 ml) y se agregaron 4-clorocinamilo cloruro (96 mg) . La solución se revolvió 50 horas a temperatura ambiente, el solvente se eliminó *in vacuo* y el residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 7:2) para proporcionar el producto del título (162 mg) como un sólido de color amarillo. M.p. 129-132 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1-7.3 (m, 6H), 7.6 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 8.4 (d, J = 10 Hz, 1H), 8.5 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 9.4 (s, 1H, NH); Tiempo de Retención HPLC 2.46 min; MS (ES+) 501/503/505 (M+H⁺).

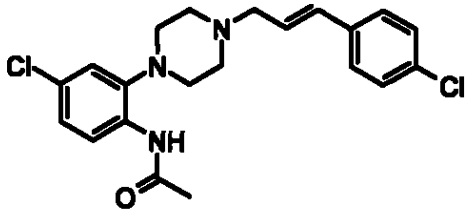
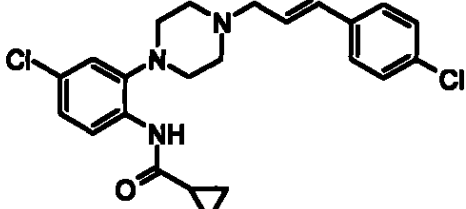
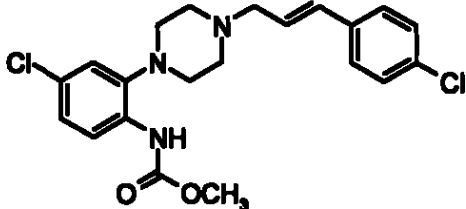
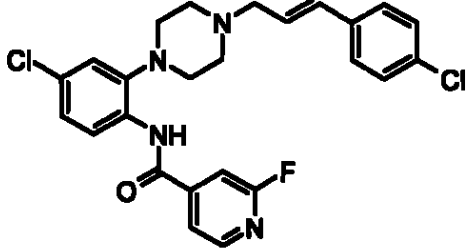
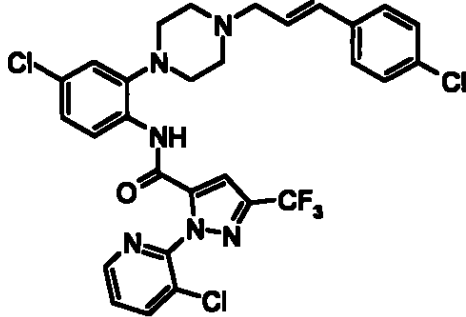
Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 1:

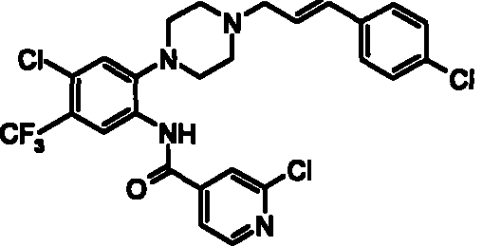
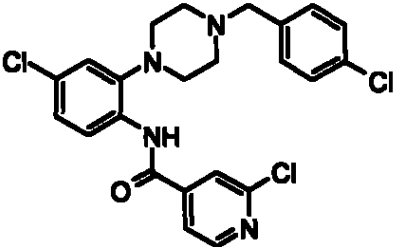
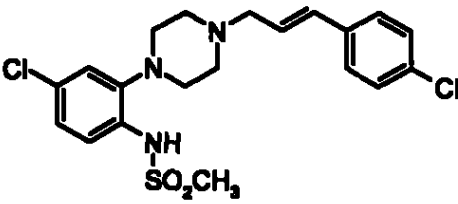
Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenilo)-allilo]-piperazin-1-il}-fenilo)-isonicotinamide			467/469	2.26
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenilo)-allilo]-piperazin-1-il}-fenilo)-isonicotinamida			501	2.32
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenilo)-allilo]-piperazin-1-il}-fenilo)-isonicotinamida			517	2.46
2-cloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenilo)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		145-147	485/487	2.29

2-cloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenilo)-isonicotinamida		98-100	519	1.91
2-cloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		85-89	535/537	2.44
2-cloro-N-(5-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		80-83	485/487	2.28
2-cloro-N-(5-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenilo)-allilo]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		105-109	519	2.51
2-cloro-N-(5-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		110-114	535	2.48

isonicotinamida				
2-cloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		129-131	535/537	2.56
2-cloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		92-95	551/553	2.63
2-cloro-N-(3,4-dicloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		154-156	537/539	2.38
2,6-dicloro-N-(3,4-dicloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		178-181	571/573	2.67
N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-benzamida		79-81	466/468	2.49

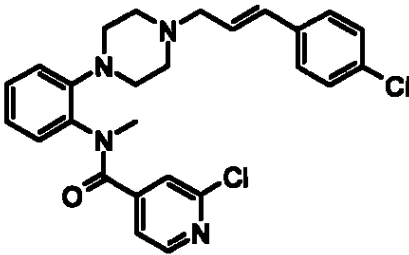
N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		152-154	467-469	2.11
2,6-dicloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		121-123	537/539	2.77
6-cloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-nicotinamida		120-123	467/469	2.10
N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenilo)-4-trifluorometoxi-benzamida		104-107	550/552	3.22
N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-4-cloro-benzamida		62-64	502/504	2.85

N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)- acetamida		145-148	404/406	1.95
Ciclopropano ácido carboxílico (4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-amida		87-89	430/432	2.17
Éster de (4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-ácido metil carbámico		73-76	420/422	2.17
2-fluoro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		162-165	485/487	2.31
2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-ácido carboxílico (4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-		97-100	637/639	2.65

fenil)-amida				
2-cloro-N-(4-cloro-5-trifluorometil-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-isonicotinamida		135-136	569/571	2.92
2-Cloro-N-{4-cloro-2-[4-(4-clorobencil)-piperazin-1-il]-fenil}-isonicotinamida		116-118	475/477	2.50
N-(4-Cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-methanesulfonamida		81-83	440-442	2.01

EJEMPLO 2

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-N-metil-isonicotinamida.

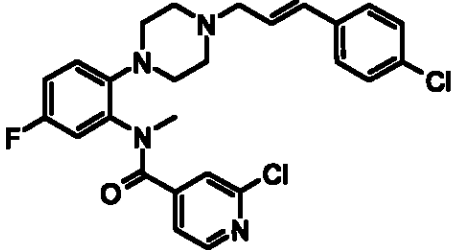
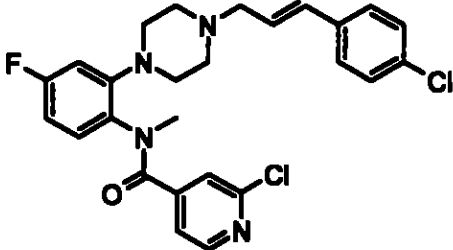
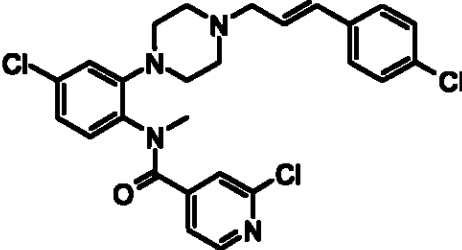
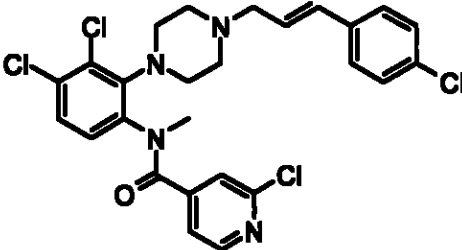


5

Se agregó éster de 4-{2-[(2-cloro-piridina-4-carbonil)-amino]fenil}piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (100 mg, preparado como se describió en el Ejemplo

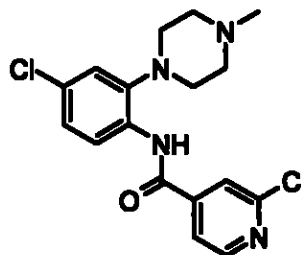
1, en los Pasos A-C) a una suspensión de hidruro de sodio (50% en aceite, 24 mg) en tetrahidrofurano a 0°C y la mezcla resultante se revolvió a 0°C durante 1 hora en cuyo tiempo se agregó iodometano (0.03 ml). La mezcla de la reacción se revolvió a temperatura ambiente durante 3 horas, se diluyó en acetato de etilo, se lavó tres veces con agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 7:3) para proporcionar éster de 4-{2-[(2-Cloro-piridina-4-carbonilo)-metil-amino]-fenil}-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butil como cristales de color blanco. M.p. 59-61 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.2 (m, 2H), 2.8 (m, 2H), 3.4 (m, 2H), 3.4 (s, 3H), 3.5 (m, 2H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.0-7.3 (m, 4H), 8.1 (m, 1H); MS (ES+) 331 (M + H⁺-CO₂-isobuteno), 375 (M + H⁺-isobuteno), 431 (M + H⁺). El compuesto se trató de acuerdo con el Ejemplo 1, Paso D para proporcionar el producto del título como cristales de color amarillo. M.p. 117-120 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (m, 2H), 2.5 (m, 2H), 2.6 (m, 2H), 2.9 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 3.5 (s, 3H), 3.5 (m, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.8 (d, J = 9 Hz, 1H), 6.9 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.0-7.3 (m, 6H), 8.1 (d, J = 5 Hz, 1H); Tiempo de Retención HPLC 2.17 min; MS (ES+) 481/483 (M + H⁺).

Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 2:

Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
2-cloro-N-(5-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-N-metil-isonicotinamida		60-64	499/501	2.12
2-cloro-N-(4-fluoro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-N-metil-isonicotinamida		110-117	499/501	2.09
2-cloro-N-(4-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-N-metil-isonicotinamida		130-133	517-519	2.28
2-cloro-N-(3,4-dicloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-fenil)-N-metil-isonicotinamida		112-115	551/553	2.42

EJEMPLO 3

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-Cloro-N-[4-cloro-2-(4-metil-piperazin-1-il)-fenil]-isonicotinamida.

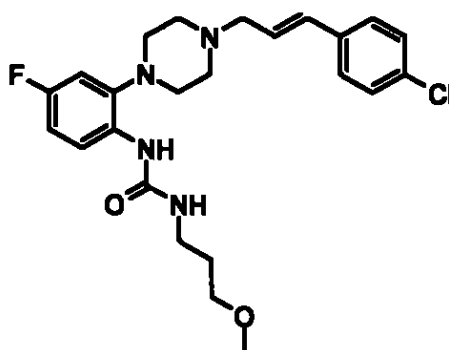


- 5 Paso A: Una solución de éster de 4-[5-cloro-2-[(2-cloro-piridina-4-carbonil)-amino]fenil]piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (6.7 g, Ejemplo 1, Paso C) en diclorometano (20 ml) se trató con ácido trifluoroacético (10 ml) durante 20 horas a temperatura ambiente. La concentración de la solución bajo presión reducida proporcionó 2-cloro-N-[4-cloro-2-(piperazin-1-il)-fenil]-isonicotinamida
- 10 trifluoroacetato (6.9 g) como un sólido de color marrón. MS (ES+) 351/353 (M+H⁺).

- Paso B: El producto obtenido en el Paso A (300 mg), ácido fórmico (16 ml) y 37 % de formaldehído acuoso (0.47 ml) fueron sometido a reflujo durante 2 horas. La mezcla de la reacción se diluyó con agua, se hizo básica con bicarbonato de
- 15 sodio acuoso y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (acetato de etilo: metanol 8:2) para proporcionar el producto del título. M.p. 118-120 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (s, 3H), 2.7 (m, 2H), 3.0 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.6 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.4 (d, J =
- 20 9.0 Hz, 1H), 8.5 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 9.4 (br s, 1H); MS (ES+) 365/367 (M+H⁺).

EJEMPLO 4

Este Ejemplo ilustra la preparación de 1-(2-[4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alilil]-piperazin-1-il]-4-fluor-fenil)-3-(3-metoxi-propil)-urea.

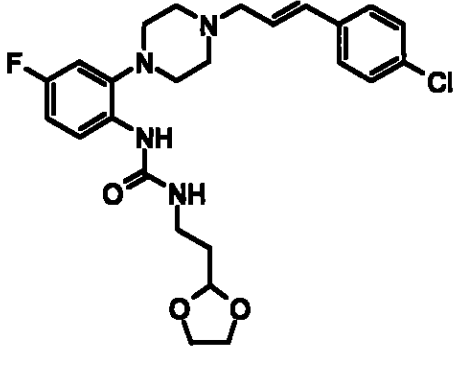
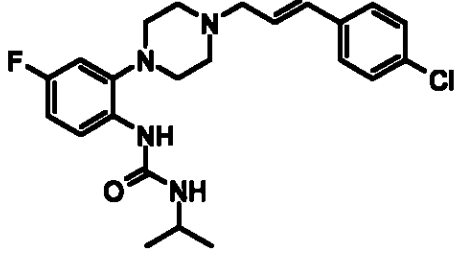


- Paso A: Una solución de éster de 4-(5-fluoro-2-nitrofenil)-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (10 g, preparado a partir de 2,4-difluoronitrobenceno tal como se describió en el Ejemplo 1, Paso A) en diclorometano (80 ml) se trató con ácido trifluoroacético (23 ml) durante 24 horas a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se concentró *in vacuo*. El residuo se diluyó en acetonitrilo (100 ml), se agregaron diisopropiletilamina (27 ml) y 4-cloro-cinamil cloruro (6.8 g). La solución se revolvió durante 17 horas a temperatura ambiente, el solvente se eliminó *in vacuo* y el residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 1:1) para proporcionar 1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-(5-fluoro-2-nitro-fenil)-piperazina (10.5 g); ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 2.7 (t, J = 8 Hz, 4H), 3.1 (t, J = 8 Hz, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.6 (dt, J = 1.0, 7.0 Hz, 1H), 6.7 (dd, J = 1.0, 10 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H), 7.8 (d, J = 7.0, 10.0 Hz, 1H); MS (ES +) 151/153, 376/378 ($\text{M} + \text{H}^+$).
- 15 Paso B: A una suspensión revuelta del compuesto obtenido en el Paso A (8.0 g) en etanol (66 ml) en agua (80 ml) a 60 ° C se agregó diclonato de sodio (11 g). La mezcla resultante se revolvió a 60 ° C durante 1 hora y luego el etanol se eliminó *in vacuo*. La suspensión se extrajo tres veces con acetato de etilo, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El vacío se filtró sobre gel de sílice (eluyente de acetato de etilo) para proporcionar 1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-(5-fluoro-2-amino-fenil)-piperazina (4.1 g). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 2.8 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.7 (m, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.6 (m, 2H), 6.7 (d, J = 10 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H); MS (ES+) 151/153, 346/348 ($\text{M} + \text{H}^+$).
- 20 Paso C: A una solución revuelta de di-tert-butil carbonato (266 mg) en diclorometano (4 ml) bajo nitrógeno se agregó 4-dimetilaminopiridina (106 mg) en

diclorometano (4 ml) seguido del producto obtenido en el Paso B (300 mg). La solución se revolvió a temperatura ambiente hasta que cesó la evolución del gas. 3-Metoxipropilamina (155 mg) disuelta en diclorometano (4 ml) se agregó luego en forma de gotas y la solución resultante se revolvió mientras se agitaba a temperatura ambiente durante 1 hora. El solvente se eliminó bajo una presión reducida y el residuo se purificó por medio de cromatografía por gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 1:9) para proporcionar el producto del título (210 mg). M.p. 86-90 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.8 (quint, J = 7 Hz, 2H), 2.6 (m, 4H), 2.9 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.2 (s, 3H), 3.3 (q, J = 7 Hz, 2H), 3.4 (t, J = 7 Hz, 2H), 5.3 (m, 1H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.8 (m, 2H), 6.9 (s, 1H), 7.2-7.3 (m, 6H), 7.7 (m, 1H); Tiempo de Retención HPLC 1.93; MS (ES+) 372/374, 461/463 (M + H⁺).

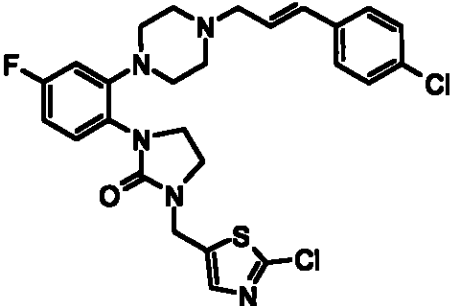
Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 4:

Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
1-(4-Cloro-2-{4-[(E)-3-(4-clorofenil)-alil]-piperazin-1-il}-fenil)-3-(2-metoxietil)-urea		178	463/465	1.97
1-(2-{4-[(E)-3-(4-clorofenil)-alil]-piperazin-1-il}-4-fluorofenil)-3-(2-cloro-tiazol-5-ilmetil)-urea		94-98	520/522	2.12

1-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4-fluoro-fenil)-3-(2-[1,3]dioxolan-2-il-etil)-urea		76-80	489	2.02
1-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4-fluoro-fenil)-3-isopropil-urea		162-166	431	2.08

EJEMPLO 5

Este Ejemplo ilustra la preparación de 1-(2-{4-[(E)-3-(4-Cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4-fluoro-fenil)-3-(2-cloro-tiazol-5-ilmetil)-imidazolidin-2-ona.



5

Paso A: A una solución de 1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-4-(5-fluoro-2-amino-fenil)-piperazina (1.0 g, Ejemplo 3, Paso B) en tetrahidrofurano (10 ml) a 0°C se agregó 2-cloroetilisocianato (327 mg) y la solución resultante se revolvio bajo nitrógeno a temperatura ambiente durante 18 horas. El residuo se disolvió en un volumen mínimo de tetrahidrofurano, luego se agregó a una suspensión de hidruro de sodio (146 mg, 50% en aceite) en tetrahidrofurano (10 ml). La mezcla de la reacción se revolvió mientras se agitaba a temperatura ambiente durante 3 horas, se concentró bajo presión reducida, luego se trituró con éter de dietilo para proporcionar 1-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4-fluoro-fenil)-

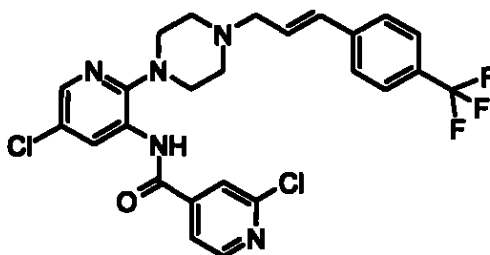
10

imidazolidin-2-ona (677 mg) como cristales de color blanco. M.p. 170-172°C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.11 (m, 4H), 3.26 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 3.63 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.99 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 5.12 (br s, 1H), 6.32 (dt, J = 15.6, 6.8 Hz, 1H), 6.57 (d, J = 15.6 Hz, 1H), 6.82 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 4H); MS (ES+) 415/417 (M + H⁺).

Paso B: El producto obtenido en el Paso A (250 mg) disuelto en dimetilacetamida (4 ml) se agregó a una suspensión de hidruro de sodio (50% en aceite, 29 mg) en dimetilacetamida (4 ml) a 0 ° C y la mezcla resultante se revolvió a 0 ° C durante 30 min en cuyo tiempo se agregó C-(2-cloro-tiazol-5-il)-metilamina (102 mg) disuelto en dimetilacetamida (4 ml). La mezcla de la reacción se revolvió mientras se agitaba a temperatura ambiente durante 2 horas, se apagó por medio de la adición de agua, se extrajo con acetato de etilo (tres veces), se secó sobre sulfato de sodio y se concentró *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 1:9) para proporcionar el producto del título como un sólido de color amarillo. M.p. 72-77 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.0 (m, 4H), 3.2 (d, J = 7 Hz, 2H), 3.35 (t, J = 6 Hz, 2H), 3.8 (t, J = 6 Hz, 2H), 4.5 (s, 2H), 6.3 (dt, J = 16, 7 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 16 Hz, 1H), 6.8 (m, 2H), 7.2-7.3 (m, 4H), 7.4 (s, 1H); MS (ES+) 546/548 (M + H⁺).

EJEMPLO 6

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(5-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-alil]-piperazin-1-il}-piridin-3-il)-isonicotinamida.

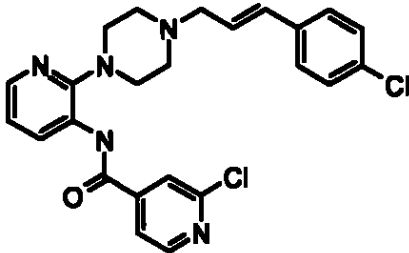
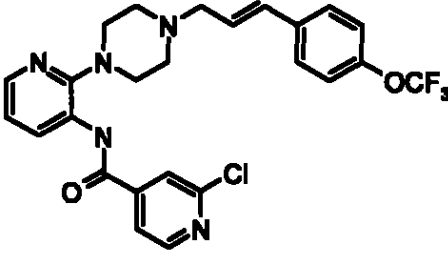
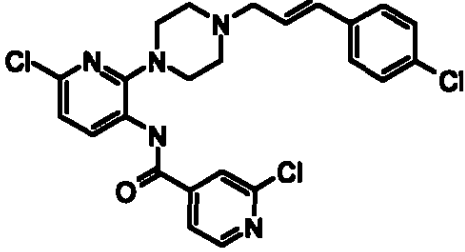
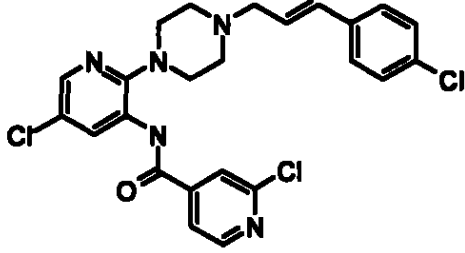
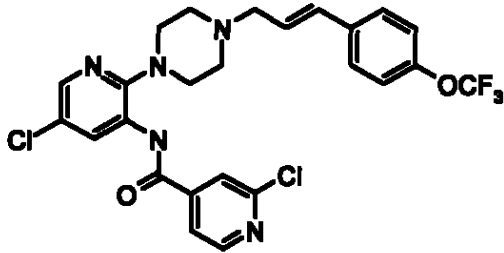


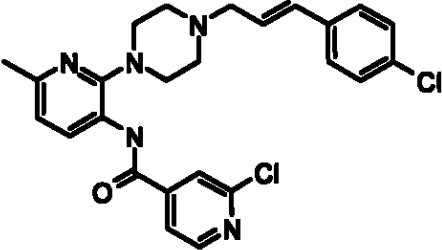
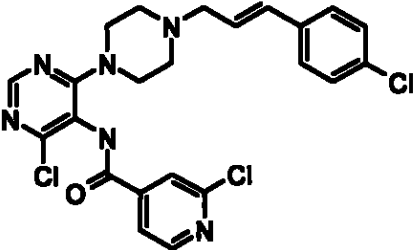
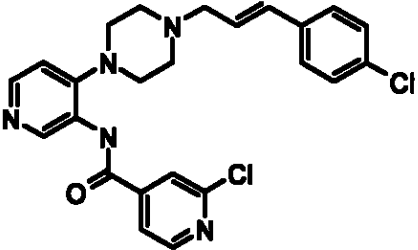
Paso A: Se agregó piperazina (1.38 g) a una solución revuelta de 2,6-dicloro-3-nitropiridina (3.0 g, preparada de acuerdo con *J. Heterocyclic Chem.* 1994, 31, 73) y diisopropiletilamina (3.0 ml) en diclorometano (100 ml) a 0 ° C bajo N₂. La solución resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 2 horas y luego se volcó en bicarbonato de sodio acuoso saturado, extracted with dicloromethane, se

- secó sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (acetato de etilo : metanol 8:2) para proporcionar 1-(6-Cloro-3-nitro-piridin-2-il)-piperazina (2.99 g) como un sólido de color rojo. M.p. 50-53°C; MS (ES+) 243/245 (M + H⁺).
- 5 Paso B: El producto obtenido en el Paso A (800 mg) se disolvió en acetonitrilo (320 ml), diisopropiletilamina (1.2 ml) y se agregaron 4-trifluorometilcinamilo cloruro (728 mg). La solución se revolvió a temperatura ambiente durante 24 horas, el solvente se eliminó *in vacuo* y el residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 7:3) para proporcionar 1-(5-Cloro-3-
- 10 nitro-piridin-2-il)-4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-alil]-piperazina (0.79 g) como una espuma de color amarillo. M.p. 129-132 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.3 (d, J = 9 Hz, 1H), 3.5 (m, 4H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.4 (m, 4H), 8.2 (d, J = 2 Hz, 1H), 8.3 (d, J = 2 Hz, 1H); MS (ES+) 427/429 (M + H⁺).
- 15 Paso C: El producto obtenido en el Paso B (435 mg) se redujo y se aciló como se describió en el Ejemplo 1 Paso B y C para proporcionar después de la cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 7:3) el producto del título (185 mg). M.p. 156-159 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.7 (m, 4H), 3.1 (m, 4H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.4 (d,
- 20 J = 9 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 9 Hz, 2H), 7.5 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.6 (s, 1H), 8.0 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 5 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.8 (s, 1H, NH); HPLC Tiempo de Retención 2.12 min; MS (ES+) 536/538 (M + H⁺).

Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 6:

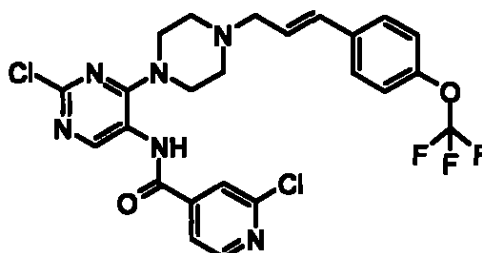
Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
----------------------	------------	----------	-----------------	---------------------------

2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-piridin-3-il)-isonicotinamida		106-109	468/470	2.05
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-piridin-3-il)-isonicotinamida			518/520	2.19
2-cloro-N-(6-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-piridin-3-il)-isonicotinamida		70-73	502/504	2.16
2-cloro-N-(5-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-piridin-3-il)-isonicotinamida		127-129	502/504	2.29
2-cloro-N-(5-cloro-2-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-		115-117	552/554	2.40

piperazin-1-il)- piridin-3-il)- isonicotinamida				
2-cloro-N-(6- metil-2-{4-[(E)- 3-(4-cloro-fenil)- allil]-piperazin- 1-il}-piridin-3- il)- isonicotinamida		67- 70	482/484	2.44
2-Cloro-N-(4- cloro-6-{4-[(E)- 3-(4-cloro-fenil)- allil]-piperazin- 1-il}-pirimidin- 5-il)- isonicotinamida		84- 87	503/505	2.48
2-Cloro-N-(4-{4- [(E)-3-(4-cloro- fenil)-allil]- piperazin-1-il}- piridin-3-il)- isonicotinamida		77- 79	468/470	1.99

EJEMPLO 7

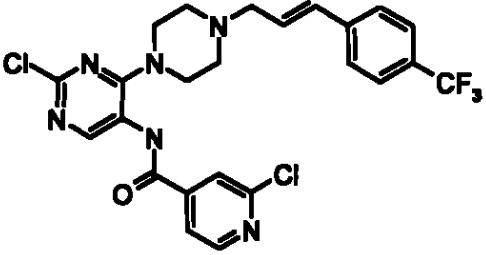
Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-cloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-pirimidin-5-il)-isonicotinamida.



Se condensó 1-t-Butoxicarbonil-piperazina (2.36 g) con 2,4-dicloro-pirimidin-5-ilamina (2.0 g) en dimetilsulfóxido (20 ml) en presencia de Trietilamina (5.3 ml) de acuerdo con el método que se describió en el Ejemplo 1, Paso A. Se obtuvo éster de 4-(5-Amino-2-cloro-pirimidin-4-il)-piperazin-1-ácido carboxílico tert-butilo (3.4 g) como cristales de color violeta. MS (ES⁺) 314/316 (M+H⁺). El producto del título (120 mg) se obtuvo a partir de este intermediario de acuerdo con los métodos que se describieron en el Ejemplo 1, Paso C y D. 2-Cloro-N-(2-cloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-pirimidin-5-il)-isonicotinamida. M.p. 210-211 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.5 (m, 4H), 3.1 (d, J = 9 Hz, 1H), 3.6 (m, 4H), 6.1 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.4 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1 (d, J = 11 Hz, 2H), 7.3 (d, J = 11 Hz, 2H), 7.6 (d, J = 5 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 7.8 (s, 1H, NH), 8.4 (s, 1H), 8.5 (d, J = 5 Hz, 1H); MS (ES⁺) 553/555 (M + H⁺).

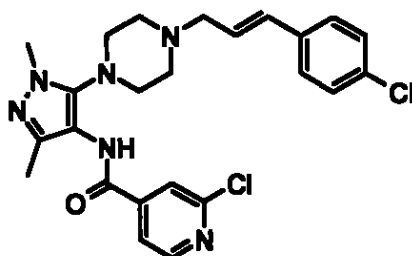
Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 7:

Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
2-cloro-N-(2-cloro-4-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-pirimidin-5-il)-isonicotinamida		187-189	503/505	2.09

2-cloro-N-(2-cloro-4-{4-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-pirimidin-5-il)-isonicotinamida		169-173	537/539	2.21
--	--	---------	---------	------

EJEMPLO 8

Este Ejempló ilustra la preparación de 2-Cloro-N-(5-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-il)-isonicotinamida.



Paso A: Una solución de N-BOC-piperazina (4.3 g) y Trietilamina (9 ml) en dimetilsulfóxido (40 ml) a 0 ° C bajo nitrógeno se trató con 4-clorocinamilo cloruro (5 g) y la solución resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 18 horas, se volcó en agua, se extrajo con acetato de etilo (tres veces), se secó sobre sulfato de sodio y se concentró *in vacuo*. El residuo se filtró sobre gel de sílice para proporcionar el crudo de éster 4-[(E)-3-(4-Cloro-fenil)-allil]-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo. El compuesto se disolvió en diclorometano (30 ml) y se trató con ácido trifluoroacético (10 ml) a temperatura ambiente durante 18 horas. La concentración proporcionó 1-[(E)-3-(4-Cloro-fenil)-allil]-piperazina (5.8 g), que se caracterizó por su masa y el espectro NMR. MS (ES⁺) 151/153 (M-piperazina), 237/239 (M+H⁺).

Paso B: El producto obtenido en el Paso A (3.1 g) se condensó con 5-Cloro-1,3-dimetil-4-nitro-1H-pirazol (1.5 g) en dimetilsulfóxido (20 ml) en presencia de Trietilamina (3.4 ml) de la manera como se describió en el Ejemplo 1, Paso A para proporcionar 1-[(E)-3-(4-Cloro-fenil)-allil]-4-(2,5-dimetil-4-nitro-2H-pirazol-3-il)-

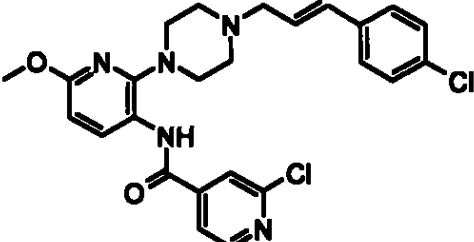
piperazina (1.82 g) como un sólido de color marrón. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.4 (s, 3H), 2.6 (m, 4H), 3.2 (m, 6H), 3.7 (s, 3H), 6.3 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H); MS (ES+) 151/153, 376/378 (M + H⁺).

Paso C: A una solución del producto obtenido en el Paso B (800 mg) en tetrahidrofurano (8 ml) y metanol (8 ml) a temperatura ambiente bajo nitrógeno se agregó tin(II)cloruro monohidrato (2.9 g) y trihidrato de acetato de sodio (3.5 g). La mezcla resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 34 horas. La mezcla de la reacción se dividió entre 1M de hidróxido de sodio y acetato de etilo, se revolvió durante 10 min, la capa orgánica se separó, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. Se obtuvo 1-[(E)-3-(4-Clorofenil)-alilo]-4-(2,5-dimetil-4-amino-2H-pirazol-3-il)-piperazina (510 mg) como un sólido de color rojo. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.3 (s, 3H), 2.8 (m, 4H), 3.3 (m, 4H), 3.4 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.8 (s, 3H), 6.4 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.7 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.3-7.4 (m, 4H); MS (ES+) 151/153 (cinamilo), 196(M-cinamilo), 346/348 (M + H⁺).

Paso D: Se agregó trietilamina (0.46 ml) a una solución revuelta del compuesto obtenido en el Paso C (250 mg) en diclorometano (10 ml); la solución se enfrió a to 0 ° C y se agregó 2-cloro-sonicotinoil cloruro (250 mg). La mezcla resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 12 horas, se volcó en agua, se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (acetato de etilo : etanol 9:5) para proporcionar el compuesto del título (158 mg). M.p. 85-88 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.0 (s, 3H), 2.52 (br s, 4H), 3.05 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.1 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 3.58 (s, 3H), 6.13 (dt, J = 15.6, 6.8 Hz, 1H), 6.40 (d, J = 15.6 Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.55 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.49 (d, J = 5.2 Hz, 1H); Tiempo de Retención LCMS 2.26 min; MS (ES+) 485/487 (M + H⁺).

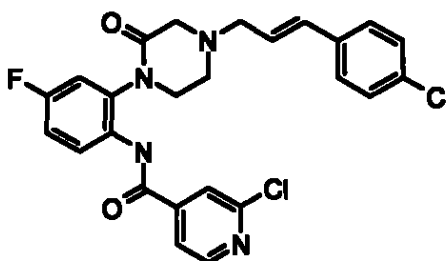
Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 8:

Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
----------------------	------------	----------	-----------------	---------------------------

2-Cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-6-metoxi-piridin-3-il)-isonicotinamida		65-69	498/500	2.39
--	--	-------	---------	------

EJEMPLO 9

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-Cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-2-oxo-piperazin-1-il}-4-fluoro-fenilo)-isonicotinamide.



5

Paso A: Se preparó piperazinona de acuerdo con el método que se describió en US6433134: se agregó cloroformato de etilo (10 g) en etanol (50 ml) en forma de gotas a una solución de etilendiamina (32.85 ml) en etanol (150 ml) a temperatura ambiente bajo nitrógeno. La solución resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 48 hrs, luego se trató en forma de gotas después de 30 min con una solución recién preparada de etanolato de sodio en etanol (preparada a partir de 1.9 g de sodio y 90 ml de etanol). La solución se revolvió a temperatura ambiente durante 2 horas, se filtró sobre Hyflo (se enjuagó con etanol), luego el solvente y el exceso de diamina se eliminaron in vacuo. El residuo aceitoso se sometió a reflujo en tolueno (400 ml) durante 3 horas, la capa de tolueno se decantó y se separó del aceite que quedaba; la capa de tolueno se conservó a 0 ° C durante toda la noche y el sólido se recolectó por medio de filtrado para proporcionar piperazinona (3.6 g). M.p. 108-109°C.

Paso B: Piperazinona (3.6 g) se disolvió en acetonitrilo (100 ml) luego se trató con diisopropiletilamina (9 ml) y 4-clorocinamilo cloruro (6.7 g). La mezcla resultante de la reacción se revolvió mientras se agitaba a temperatura ambiente bajo

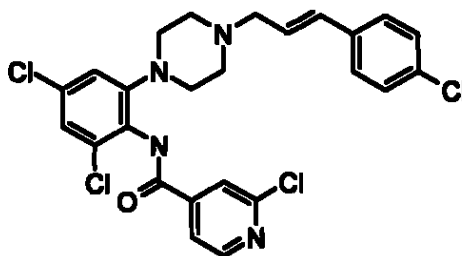
20

- nitrógeno durante 48 horas. El precipitado blanco se recolectó por medio de filtración, se lavó con acetonitrilo frío y se secó bajo vacío (sólido blanco, 4.35 g). El filtrado se concentró en vacío y el residuo se cristalizó a partir del acetonitrilo (cristales de color blanco, 1.4 g). M.p. 129-130°C. Ambas fracciones mostraron
- 5 datos analíticos satisfactorios: N-4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]- piperazin-2-ona. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.63 (t, J = 5 Hz, 2H), 3.12 (s, 2H), 3.15 (d, J = 7 Hz, 2H), 3.32 (m, 2H), 6.1 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 4H).
- Paso C: A una solución del producto obtenido en el Paso B (2.51 g) en dimetilformamida (50 ml) a temperatura ambiente bajo nitrógeno se agregó
- 10 carbonato de potasio (3.45 g) y 2,4-difluoronitrobenceno (1.59 g). La mezcla resultante se revolvió a 100 ° C durante 24 horas. Se agregaron carbonato de potasio (1.4 g) y 2,4-difluoronitrobenceno (1.4 g) otra vez y la mezcla resultante se revolvió mientras se agitaba a 110 ° C durante 48 horas. La mezcla de la reacción se enfrió a temperatura ambiente, se volcó en agua, se extrajo tres veces con
- 15 acetato de etilo; las capas orgánicas combinadas se lavaron con solución salina, se secaron (Na₂SO₄) y se concentraron *in vacuo*. La columna de cromatografía (ciclohexano / acetato 6:4) proporcionó 4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1-(5-fluoro-2-nitro-fenil)-piperazin-2-ona (1.9 g) como un sólido de color marrón. M. p. 57°C; MS (ES+) 151/153 (cinamilo), 390/392 (M + H⁺).
- 20 Paso D: Se agregó níquel Raney (50 % acuoso en agua, 200 mg) a una solución del compuesto obtenido en el Paso C (389 mg) en etanol (10 ml); se agregó hidrato de hidrazina (0.5 ml) y la mezcla de la reacción se revolvió mientras se agitaba a temperatura ambiente hasta que cesó la evolución del gas (1 hora). La mezcla de la reacción se filtró sobre Hyflo, el solvente se eliminó en vacío y el
- 25 residuo se purificó por medio de columna de cromatografía (2.5% metanol en acetato de etilo) para proporcionar 1-(2-Amino-5-fluoro-fenilo)-4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperazin-2-ona (162 mg). Tiempo de Retención LCMS 2.81 min; MS (ES+) 360/362 (M + H⁺).
- Paso E: Se agregó trietilamina (0.14 ml) a una solución revuelta del compuesto
- 30 obtenido en el Paso D (140 mg) en diclorometano (10 ml); la solución se enfrió hasta 0 ° C y se agregó 2-cloro-isonicotinoil cloruro (200 mg). La mezcla resultante se revolvió a temperatura ambiente durante 3 horas, se volcó en agua,

se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (acetato de etilo : ciclohexano 1:1) para proporcionar el compuesto del título como un polvo de color blanco (130 mg). M.p. 75-77 ° C; Tiempo de Retención LCMS 3.46 min; MS (ES+) 150/152, 499/501 (M + H⁺).

EJEMPLO 10

Este Ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperazin-1-il}-4,6-dicloro-fenil)-isonicotinamida.



10

Paso A: Una solución de 1,3,5-tricloronitrobenceno (800 mg) y 1-t-butoxicarbonil-piperazina (790 mg) en tolueno (20 ml) se revolvió a 80 °C under N₂ durante 15 horas. La mezcla de la reacción se enfrió a temperatura ambiente, se dividió entre el agua y el acetato de etilo, la capa orgánica se secó (Na₂SO₄) y se concentró *in vacuo*. El residuo se sometió a cromatografía con gel de sílice (ciclohexano : acetato de etilo 8:2) para proporcionar éster de 4-(3,5-dicloro-2-nitrofenilo)-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butilo (0.37 g). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 2.9 (m, 4H), 3.5 (m, 4H), 7.0 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 2 Hz, 1H); Tiempo de Retención HPLC 2.33 min; MS (ES+) 276/278 (M-BOC), 317/319 (M-isopreno).

20

Paso B: El producto obtenido en el Paso A (200 mg) se redujo con tin cloruro y luego se aciló con 2-cloroisonicotinoilo cloruro de la manera como se describió en el Ejemplo 8, Paso C y D para proporcionar éster de 4-{2-[(2-Cloro-piridina-4-carbonilo)-amino]-3,5-dicloro-fenil}-piperazina-1-ácido carboxílico tert-butil (1.04 g). Tiempo de Retención HPLC 2.05 min; MS (ES+) 431/433, 485/487/489 (MH⁺).

25

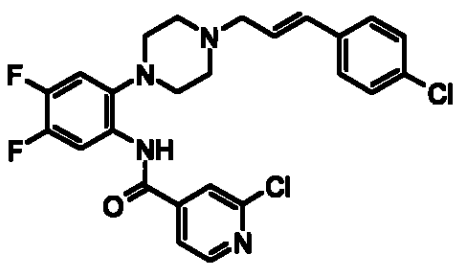
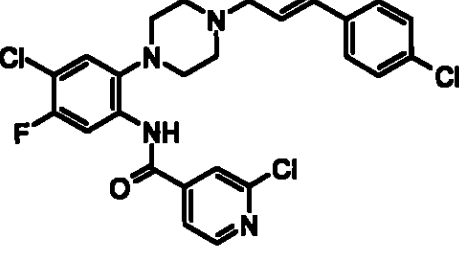
Paso C: Una solución del compuesto obtenido en el Paso C (0.08 g) en diclorometano (1 ml) se trató con ácido trifluoroacético (0.1 ml) durante 24 horas a

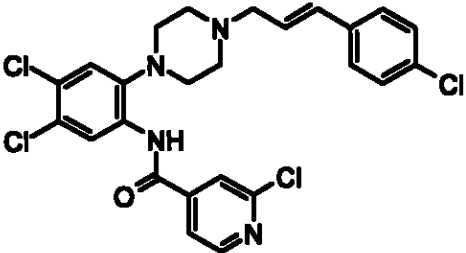
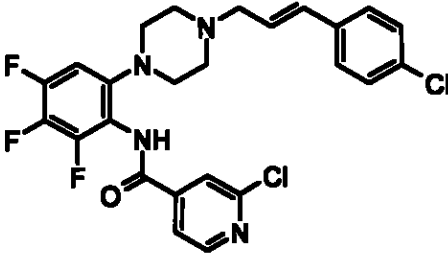
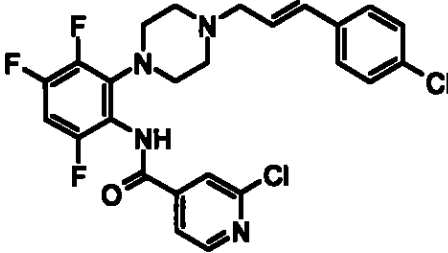
temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se concentró *in vacuo*. El residuo se diluyó en acetonitrilo (1 ml), diisopropiletilamina (0.15 ml) y se agregaron 4-clorocinamilo cloruro (0.05 g). La solución se revolvió 24 horas a temperatura ambiente, el solvente se eliminó *in vacuo* y el residuo se sometió a

5 cromatografía con gel de sílice para proporcionar el producto del título (66 mg) como un sólido. M.p. 79-80 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 2.37 (m, 4H), 2.6 (m, 4H), 3.1 (d, J = 9 Hz, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 6.9 (d, J = 2 Hz, 1H), 7.2-7.3 (m, 5H), 7.5 (s, 1H, NH), 7.6 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.5 (d, J = 5.5 Hz, 1H); Tiempo de Retención HPLC 1.44 min; MS (ES+)

10 535/537/539 (M + H⁺).

Los compuestos siguientes se prepararon de acuerdo con los procedimientos análogos a los que se describieron en el Ejemplo 10:

Nombre del Compuesto	Estructura	M.p (°C)	MH ⁺	Tiempo de Retención (min)
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperazin-1-il}-4,5-difluoro-fenilo)-isonicotinamida		55-58	503-505	1.62
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperazin-1-il}-4-cloro-5-fluoro-fenil)-isonicotinamida		122-123	519	1.52

2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4,5-dicloro-fenil)-isonicotinamida		154-155	535/537/539	1.57
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-4,5,6-trifluoro-fenil)-isonicotinamide		94-96	521/523	1.39
2-cloro-N-(2-{4-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-allil]-piperazin-1-il}-3,4,6-trifluoro-fenilo)-isonicotinamida		80-82	521/523	1.36

EJEMPLO 11

Este Ejemplo ilustra las propiedades pesticidas / insecticidas de los compuestos de la fórmula (I). Se realizaron las pruebas contra los elementos que figuran a continuación:

Spodoptera littoralis (Gusano egipcio del algodón)

Se colocaron discos de hojas de algodón sobre ágar en una placa de microtíter de 24 cavidades y se rociaron con las soluciones de prueba a una velocidad de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, los discos de hojas se infestaron con 5 L₁ larvas. Se verificaron las muestras para detectar la mortalidad, los efectos repelentes, el comportamiento del suministro y la regulación del crecimiento 3

días después del tratamiento (DAT). Los compuestos siguientes dieron por lo menos un control del 80 % de *Spodoptera littoralis*:

I-3, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-75, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, II-49, III-49, V-49, XII-49, XIV-26, XV-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94, XXV-26 y XXV-49.

Heliothis virescens (Gusano cogollero del tabaco):

Se colocaron huevos (de 0-24 h) en una placa de microtíter de 24 cavidades con una dieta artificial y se trataron con las soluciones de prueba a una velocidad de aplicación de 200 ppm por medio de pipeteado. Después de un período de incubación de 4 días, se verificaron las muestras para detectar la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento. Los compuestos siguientes dieron por lo menos un control del 80 % de *Heliothis virescens*:

I-3, I-6, I-7, I-26, I-29, I-30, I-47, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, III-49, V-49, XII-49, XIV-26, XIV-49, XV-26, XVI-26, XVII-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94, XXV-2, XXV-26, XXV-49 and XXV-68.

Plutella xilostella (Polilla de espalda de diamante):

Una placa de microtíter con 24 perforaciones (MTP) con dieta artificial se trató con soluciones de prueba a una velocidad de aplicación de 18.2 ppm por medio de pipeteado. Después de secarse, las MTP fueron infestadas con larvas (L2) (10-15 por cavidad). Después de un período de incubación de 5 días, se verificaron las muestras para detectar la mortalidad de las larvas, la regulación antialimentación y del crecimiento. Los compuestos siguientes dieron por lo menos un control del 80 % de *Plutella xilostella*:

I-26, I-29, I-30, I-49, I-417, I-532, I-578, I-785, I-854, I-877, V-49, IX-49, XII-49, XIV-26, XV-26, XXIV-46, XXIV-90 y XXV-26.

Aedes aegypti (Mosquito de la fiebre amarilla):

Se colocaron 10-15 larvas de *Aedes* (L2) junto con una mezcla de nutrición en placas de microtíter de 96 cavidades. Se pipetearon las soluciones de prueba a una velocidad de aplicación de 2 ppm en las cavidades. 2 días más tarde, los insectos se verificaron para detectar la mortalidad y la inhibición del crecimiento.

Los compuestos siguientes dieron por lo menos un control del 80 % de *Aedes aegypti*

I-3, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, I-76, III-49, III-118, XIV-26, XV-26, XXIV-2, XXIV-46, XXIV-90, XXIV-93, XXIV-94 y XXV-68.

5 *Myzus persicae* (Pulgón verde del duraznero):

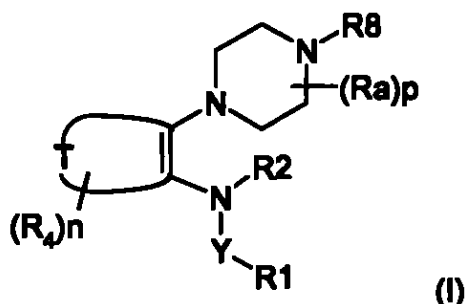
Se colocaron discos de hojas de girasol sobre ágar en una placa de microtíter de 24 cavidades y se rociaron con soluciones de prueba a una velocidad de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, los discos de hojas fueron infestados con una población de áfido de edades mezcladas. Después de un

10 período de incubación de 6 DAT, las muestras se verificaron para detectar la mortalidad. Los compuestos siguientes dieron por lo menos un control del 80 % de *Myzus persicae*:

I-3, I-26, I-29, I-26, I-29, I-30, I-49, I-52, I-53, I-72, I-75, III-49, V-49, XXIV-46, XXIV-90 y XXIV-94.

REIVINDICACIONES

1. Un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende la aplicación a una peste, a un locus de una peste o a una planta susceptible de ataque por una peste una cantidad efectiva desde el punto de vista insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de la fórmula I.



Y es un enlace simple, C=O, C=S or S(O)_m donde m es 0, 1 ó 2;
el anillo



es un anillo aromático de 6 miembros o es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros;

R¹ es hidrógeno, alquilo sustituido de manera opcional, alcoxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, heterocicliloxi sustituido de manera opcional, ciano, alquenilo sustituido de manera opcional, alquinilo sustituido de manera opcional, cicloalquilo sustituido de manera opcional, cicloalquenilo sustituido de manera opcional, formilo, heterociclilo sustituido de manera opcional, alquiltio sustituido de manera opcional, NO o NR¹³R¹⁴

donde R^{13} y R^{14} son independientemente hidrógeno, COR^{15} , alquilo
 sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional,
 heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclilo sustituido de
 manera opcional o R^{13} y R^{14} junto con el átomo N al cual están unidos
 5 forman un grupo $-N=C(R^{16})-NR^{17}R^{18}$ o R^{13} y R^{14} junto con el átomo N al
 cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete
 miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados
 a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con
 uno o dos grupos C_{1-6} alquilo; R^{15} es H, alquilo sustituido de manera
 10 opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera
 opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de
 manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional o $NR^{19}R^{20}$;
 R^{16} , R^{17} y R^{18} son cada uno de manera independiente H o el alquilo
 inferior; R^{19} y R^{20} son de manera independiente alquilo sustituido de
 15 manera opcional, arilo sustituido de manera opcional o heteroarilo
 sustituido de manera opcional;
 R^2 es H o alquilo sustituido de manera opcional; o R^1 y R^2 junto con los
 grupos Y y N forman un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que de
 manera opcional puede contener un heteroátomo adicional seleccionado a
 20 partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con C_{1-4}
 alquilo, C_{1-4} haloalquilo o halógeno;
 cada R^4 es de manera independiente halógeno, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo
 sustituido de manera opcional, C_{2-6} alquenilo sustituido de manera
 opcional, C_{2-6} alquinilo sustituido de manera opcional, alcóxicarbonilo
 25 sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera
 opcional, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional,
 dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C_{3-7} cicloalquilo
 sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional,
 heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclilo sustituido de
 30 manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de
 manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, alquiltio
 sustituido de manera opcional o $R^{21}R^{22}N$ donde R^{21} y R^{22} son, de manera

independiente, hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₃₋₆ alquenilo, C₃₋₆ alquinilo, C₃₋₇ cicloalquil(C₁₋₄)alquilo, C₂₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alcóxicarbonilo o R²¹ y R²² junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C₁₋₆ alquilo, o 2 grupos adyacentes R⁴ junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6, ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno; n es 0, 1, 2, 3 ó 4;

R⁶ es alquilo sustituido de manera opcional, alquenilo sustituido de manera opcional, alquinilo sustituido de manera opcional, cicloalquilo sustituido de manera opcional, ariilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, arioxi sustituido de manera opcional, alcóxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional o alquenilcarbonilo sustituido de manera opcional;

cada Ra es de manera independiente halógeno, hidroxilo, ciano, C₁₋₆ alquilo sustituido de manera opcional C₂₋₆ alquenilo, C₂₋₆ alquinilo sustituido de manera opcional, alcóxicarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C₃₋₇ cicloalquilo sustituido de manera opcional, ariilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterocíclico sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, arioxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, alquiltio sustituido de manera opcional, ariiltio sustituido de manera opcional o R²³R²⁴N donde R²³ y R²⁴ son, de manera independiente, hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₃₋₆ alquenilo, C₃₋₆ alquinilo, C₃₋₇ cicloalquil(C₁₋₄)alquilo, C₂₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alcóxicarbonilo o R²³ y R²⁴ junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y

que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C_{1-6} alquilo, o dos grupos R_a unidos al mismo átomo de carbono son $=O$, $=S$, $=NR_b$, $=CR_cR_d$ donde R_b , R_c y R_d son de manera independiente H o alquilo sustituido de manera opcional; p es 0, 1, 2, 3 ó 4 o las sales o los N-óxidos de los mismos.

5

2. Un método de acuerdo con la reivindicación 1 donde el anillo



es un anillo aromático de 6 miembros o es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros donde los miembros del anillo son cada uno de manera independiente CH , S , N , NR^4 , O , o CR^4 con tal que por lo menos un miembro del anillo sea diferente de CH o CR^4 y que no haya más de un átomo O o S presente en el anillo.

10

3. Un método de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2 donde Y es un enlace simple, $C=O$ o $C=S$.

15

4. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores donde R^1 es hidrógeno, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} cianoalquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{3-7} cicloalquil(C_{1-4})alquilo, C_{1-6} alcoxi(C_{1-6})alquilo, heteroaril(C_{1-6})alquil (donde el grupo heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalcoxi, C_{1-6} alquilsulfonilo, C_{1-6} alquilsulfinilo, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), aril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C_{1-6} alquilo, C_{1-6} haloalquilo, C_{1-6} alcoxi, C_{1-6} haloalcoxi, C_{1-6} alquilsulfonilo, C_{1-6} alquilsulfinilo, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema de arilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno), C_{1-6} alquilcarbonilamino(C_{1-6})alquilo, arilo (que puede estar sustituido de manera opcional con halo,

20

25

30

nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆
 alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, C₁₋₆
 alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el
 sistema arilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o
 heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional
 con halógeno), heteroarilo (que puede estar sustituido de manera opcional
 con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆
 haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆
 alcoxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones
 adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ciclarse para formar un anillo
 carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de
 manera opcional con halógeno), C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (donde
 el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄
 alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo,
 heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (sustituido de manera
 opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆
 haloalcoxi), heterocicliloxi (sustituido de manera opcional con halo, C₁₋₆
 alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), ciano, C₂₋₆ alquenilo,
 C₂₋₆ alquinilo, C₃₋₆ cicloalquilo, C₅₋₇ cicloalquenilo, heterociclilo (sustituido
 de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆
 alcoxi or C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ haloalquiltio o NR¹³R¹⁴ donde
 R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo,
 C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, fenilo (que puede estar sustituido de manera
 opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄
 haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o C₁₋₄
 alcoxicarbonilo), fenil(C₁₋₆)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar
 sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄
 haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino,
 dialquilamino, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, o dos posiciones
 adyacentes en el anillo de fenilo pueden ciclarse para formar un anillo
 carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de
 manera opcional con halógeno), heteroaril (C₁₋₆)alquilo (donde el grupo

- heteroarilo puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₆ alquilsulfonilo, C₁₋₆ alquilsulfinilo, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ alcoxicarbonilo, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros, él mismo sustituido de manera opcional con halógeno) o heteroarilo (que puede estar sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi, C₁₋₄ alcoxicarbonil C₁₋₆ alquilcarbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, C₁₋₆ alquilamino o fenilamino (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino)).
5. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores donde R² es hidrógeno, hidroxilo, C₁₋₆ alquilo o C₁₋₆ haloalquil.
6. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores donde cada R⁴ es de manera independiente halógeno, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ cianoalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₇ cicloalquil(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₆ cicloalquenilo(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₆ alquenilo(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₆ alquinoxil(C₁₋₆)alquilo, ariloxil(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ carboxialquilo, C₁₋₆ alquilcarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquenilcarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₂₋₆ alquinoxilcarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alcoxicarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₆ alqueniloxycarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₃₋₆ alquinoxycarbonil(C₁₋₆)alquilo, ariloxycarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alquiltio(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alquilsulfinil(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alquilsulfonil(C₁₋₆)alquilo, aminocarbonil(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonil(C₁₋₆)alquilo, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil(C₁₋₆)alquilo, fenil(C₁₋₄)alquilo (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C₁₋₄)alquilo (donde

el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), heterociclil(C₁₋₄)alquilo (donde el grupo heterociclilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₂₋₆ alquenilo, aminocarbonil(C₂₋₆)alquenilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonil(C₂₋₆)alquenilo, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil(C₂₋₆)alquenilo, fenil(C₂₋₄)-alquenilo, (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C₂₋₆ alquinilo, trimetilsilil(C₂₋₆)alquinilo, aminocarbonil(C₂₋₆)alquinilo, C₁₋₆ alquilaminocarbonil(C₂₋₆)alquinilo, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil(C₂₋₆)alquinilo, C₁₋₆ alcoxycarbonilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₃₋₇ halocicloalquilo, C₃₋₇ cianocicloalquilo, C₁₋₃ alquil(C₃₋₇)-cicloalquilo, C₁₋₃ alquil(C₃₋₇)halocicloalquilo, fenilo (sustituido de manera opcional con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), heterociclilo (donde el grupo heterociclilo está sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), o 2 grupos adyacentes R⁴ junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 ó 7 miembros que pueden estar sustituidos de manera opcional con halógeno, C₁₋₆ alcoxi, C₁₋₆ haloalcoxi, fenoxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), heteroariloxi (sustituido de manera opcional con halo, nitro, ciano, C₁₋₆ alquilo, C₁₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi o C₁₋₆ haloalcoxi), C₁₋₆ alquiltio o R¹⁹R²⁰N donde R¹⁹ y R²⁰ son, de manera independiente, hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₃₋₆ alquenilo, C₃₋₆ alquinilo, C₂₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxycarbonilo o R¹⁹ y R²⁰ junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos

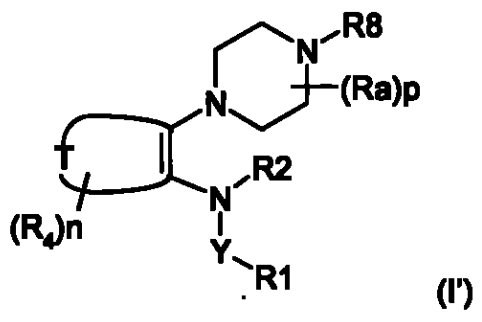
más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C_{1-6} alquilo; n es 0, 1, 2 ó 3.

7. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores donde R^8 es C_{1-10} alquilo, C_{1-10} haloalquilo, aril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroaril(C_{1-6})alquilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonil-(C_{1-6})alquilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino y el grupo alquilo puede estar sustituido de manera opcional con arilo), C_{2-8} alquenilo, C_{2-8} haloalquenilo, aril(C_{2-6})-alquenilo (donde el grupo arilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), heteroaril(C_{2-6})-alquenilo (donde el grupo heteroarilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, C_{1-6} alcoxycarbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 ó 7 miembros), C_{2-8} alquinilo, fenil(C_{2-6})alquinil (donde el grupo fenilo está sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C_{3-7} cicloalquilo, C_{1-6} alcoxycarbonilo, C_{1-6} alquilcarbonilo, C_{1-6} haloalquilcarbonilo o aril(C_{2-6})alquenilcarbonilo (donde el grupo arilo puede estar sustituido de manera opcional con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ donde z es 1 ó 2, R^{51} y R^{52} son cada uno de manera independiente H, halo o C_{1-2} alquilo, R^{53} y R^{54}

son cada uno de manera independiente H, halógeno, C₁₋₄ alquilo o C₁₋₄ haloalquilo y R⁵⁵ es arilo sustituido de manera opcional o heteroarilo sustituido de manera opcional.

8. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores
5 donde Ra es de manera independiente halo, ciano, C₁₋₃ alquilo, hidroxí o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman =O, =S, =NRb, =CRcRd donde Rb, Rc y Rd son independientemente H o alquilo sustituido de manera opcional, y p es 0, 1 ó 2.

9. Un compuesto de la fórmula I'



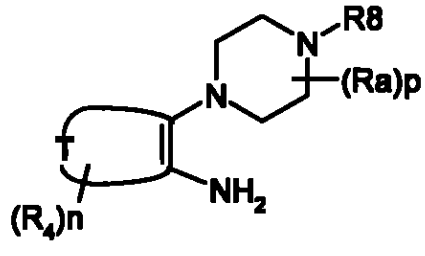
10

donde R¹, R², R⁴, Ra, T, Y, n y p son como se define en relación con la fórmula I y R⁶ es

-C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ donde z es 1 ó 2, con preferencia 1, R⁵¹ y R⁵² son cada uno de manera independiente H o C₁₋₂ alquilo, R⁵³ y R⁵⁴ son
15 cada uno de manera independiente H, halógeno, C₁₋₄ alquilo o C₁₋₄ haloalquilo y R⁵⁵ es fenilo sustituido con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido con halógeno, C₁₋₄ alquilo, C₁₋₄ alcoxi, C₁₋₄ haloalquilo, C₁₋₄ haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o
20 dialquilamino.

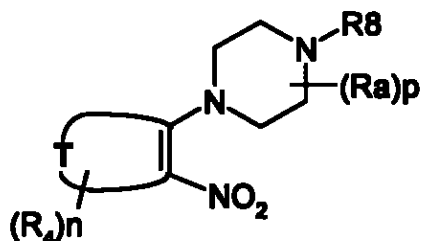
20

10. Un compuesto de la fórmula



donde R^4 , R^6 , Ra, T, Y, n y p son como se define en relación con la fórmula I' en la reivindicación 9 con tal que el compuesto sea diferente de 4,5-diamino-6-(4-cinamil-1-piperazinil)-pirimidina.

11. Un compuesto de la fórmula



5

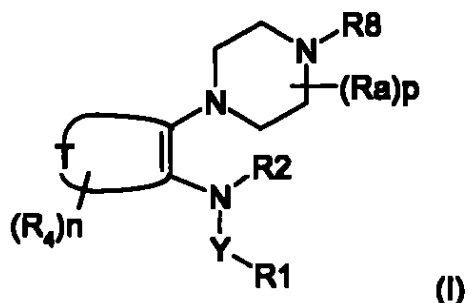
donde R^4 , R^6 , Ra, T, Y, n y p son como se define en relación con la fórmula I' en la reivindicación 9 con tal que cuando T sea un anillo de fenilo, R^6 sea Cinamilo y p sea 0 luego R^4 no sea un grupo CF_3 o NO_2 para en el anillo de piperazina y además con tal que el compuesto sea diferente de 4-amino-6-(4-cinamilo-1-piperazinilo)-5-nitro-pirimidina.

10

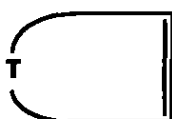
12. Una composición insecticida, acaricida o nematocida que comprende una cantidad efectiva desde el punto de vista insecticida, acaricida o nematocida de un compuesto de la fórmula I como se definió en la reivindicación 1.

RESUMEN

El uso de un compuesto de la fórmula I



donde Y es un enlace simple, C=O, C=S o S(O)_m donde m es 0, 1 ó 2;
el anillo



10 es un anillo aromático de 6 miembros o es un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros; Ra, R¹, R², R⁴ y R⁸ son grupos orgánicos especificados; n y p son de manera independiente 0-4; o las sales o los N-óxidos de los mismos o las composiciones que los contienen en el control de insectos, acarinas, nematodos o moluscos. También se proporcionan los compuestos novedosos.

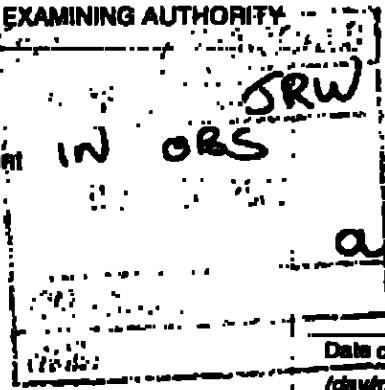
PATENT COOPERATION TREATY

247

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

To:

WATERMAN, John, Richard
Intellectual Property Department
Syngenta Limited
P O Box 3538
Bracknell, Berks RG42 6YA
GRANDE BRETAGNE



PCT

NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF
THE INTERNATIONAL PRELIMINARY
REPORT ON PATENTABILITY
(PCT Rule 71.1)

Date of mailing
(day/month/year)

05.09.2006

Applicant's or agent's file reference
RPD70383WO

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/B2005/001468

International filing date (day/month/year)
12.05.2005

Priority date (day/month/year)
28.05.2004

Applicant
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

1. The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary report on patentability and its annexes, if any, established on the international application.
2. A copy of the report and its annexes, if any, is being transmitted to the International Bureau for communication to all the elected Offices.
3. Where required by any of the elected Offices, the International Bureau will prepare an English translation of the report (but not of any annexes) and will transmit such translation to those Offices.
4. **REMINDER**

The applicant must enter the national phase before each elected Office by performing certain acts (filing translations and paying national fees) within 30 months from the priority date (or later in some Offices) (Article 39(1)) (see also the reminder sent by the International Bureau with Form PCT/IB/301).

Where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary report on patentability. It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned.

For further details on the applicable time limits and requirements of the elected Offices, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The applicant's attention is drawn to Article 33(5), which provides that the criteria of novelty, inventive step and industrial applicability described in Article 33(2) to (4) merely serve the purposes of international preliminary examination and that "any Contracting State may apply additional or different criteria for the purposes of deciding whether, in that State, the claimed invention is patentable or not" (see also Article 27(5)). Such additional criteria may relate, for example, to exemptions from patentability, requirements for enabling disclosure, clarity and support for the claims.

Name and mailing address of the international preliminary examining authority:



European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx 523855 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Authorized Officer

Roche, S
Tel. +49 89 2399-8031



PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PPD70363/WO		FOR FURTHER ACTION	See Form PCT/PEAA16
International application No. PCT/IB2005/001488	International filing date (day/month/year) 12.05.2005	Priority date (day/month/year) 28.05.2004	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC INV. A01N43/80 A01N47/30 A01N47/20 C07D401/00 C07D295/00			
Applicant SYNGENTA PARTICIPATIONS AG			
1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☒ sent to the applicant and to the International Bureau) a total of 11 sheets, as follows: ☒ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 807 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in electronic form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).			
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the report ☐ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement ☐ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☒ Box No. VIII Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 27.03.2008		Date of completion of this report 05.09.2006	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523858 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4485		Authorized officer Molina de Alba, J Telephone No. +49 89 2399-7823	



by one or two C₁₋₄ alkyl groups; R¹⁵ is H, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy or NR¹⁹R²⁰; R¹⁶, R¹⁷ and R¹⁸ are each independently H or lower alkyl; R¹⁹ and R²⁰ are independently optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; R² is H or optionally substituted alkyl; or R¹ and R² together with the groups Y and N form a 5- or 6-membered heterocyclic ring which may optionally contain one further heteroatom selected from O, N or S and which may be optionally substituted by C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl or halogen; each R⁴ is independently halogen, nitro, cyano, optionally substituted C₁₋₄ alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C₃₋₇ cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio or R²¹R²²N where R²¹ and R²² are, independently, hydrogen, C₁₋₄ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, C₃₋₆ alkynyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ haloalkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxycarbonyl or R²¹ and R²² together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₄ alkyl groups, or 2 adjacent groups R⁴ together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6, or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen; n is 0, 1, 2, 3 or 4; R⁸ is phenyl(C₁₋₄)alkyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C₁₋₄)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), phenyl(C₂₋₆)alkenyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by

AMENDED SHEET

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/IB2005/001468

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of:
 - ☐ international search (under Rules 12.3(a) and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4(a))
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2(a) and/or 55.3(a))
2. With regard to the elements* of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report):*

Description, Pages

2-101	as originally filed
1, 1a	received on 27.03.2006 with letter of 24.03.2006

Claims, Numbers

1-12	received on 27.03.2006 with letter of 24.03.2006
------	--

- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing
3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing *(specify):*
 - ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify):*
 4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing *(specify):*
 - ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify):*

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

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/IB2005/001468

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	4,7,9-12
	No: Claims	1-3,5,6,8
Inventive step (IS)	Yes: Claims	
	No: Claims	1-12
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-12
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

Box No. VIII Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

see separate sheet

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

International application No.

PCT/IB2005/001468

1) Reference is made to the following documents:

D1: WO 02/42310 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; GESING, ERNST, RUDOLF, F; ERDELEN, CHRISTOPH) 30 May 2002 (2002-05-30)

D2: US-A-3 457 263 (GILBERT REGNIER ET AL) 22 July 1969 (1969-07-22)

2) The present application relates to piperazine derivatives, to processes for their preparation, to insecticidal, acaricidal, molluscicidal, and nematicidal compositions comprising them, and to methods of control of insect, mites, molluscs, and nematode pests involving the application of said piperazine derivatives.

3) Re Item V

3.1 Novelty (Art. 33(2) PCT)

Document D1 relates to (cf. abstract) 7-oxabicyclo[2.2.1]heptane derivatives, a process for their preparation, and their use in controlling undesired microorganisms and animal pests. The compounds prepared in D1 have been tested for their resistance-inducing activity on barley as well as for their acaricidal, insecticidal, and nematicidal properties on rice and vegetables (cf. examples A-F). One of the compounds prepared is the piridazine derivative 202 shown on pg. 150. This piridazine falls under the scope of formula (I) of the application when: ring=phenyl; R₁=alkyl; p=0; n=0; R₂=H; Y=CO; and R₃=optionally substituted cycloalkyl. Accordingly, the use of a compound as defined in claims 1 to 3, 5, 6, and 8 of the application has been described for controlling insects, mites, or nematodes and cannot be regarded as novel.

Document D2 discloses (cf. abstract) the preparation of 2- or 6-purine derivatives and their use as antihypertensive, analgesic, or central nervous system depressant agents. For the preparation of compound 9 (cf. col. 5, l. 6-10), 4-(4'-cinnamyl-piperazin-1'-yl)-5-nitro-6-amino-pyrimidine is reduced to 4-(4'-cinnamyl-piperazin-1'-yl)-5,6-diamino-pyrimidin . The latter has been disclaimed in claims 9 and 10 and the former in Claim 11. Hence the content of D2 does not anticipate the subject-matter of claims 9 to 11.

3.2 Inventive Step (Art. 33(3) PCT)

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

International application No.

PCT/IB2005/001468

An examination in terms of inventive step may only be reasonably carried out on the basis of subject-matter which is not anticipated by the prior art. Accordingly, the following examination in terms of inventive step has been restricted to the subject-matter of claims 4, 7, and 9 to 12.

D1 is considered to represent the closest state of the art.

The subject-matter of claim 4 differs from D1, namely from the compound 202 of D1, in the substituent R₁, whereas the subject-matter of claims 7, 9, and 12 differs in the particular substituent R₂.

The problem to be solved by claims 4, 7, 9, and 12 may thus be regarded as providing alternative pesticidal methods, compounds, and compositions.

It does not seem obvious to the skilled person confronted with the problem posed, to select the particular compound 202 from D1 and to further modify it as to arrive at the claimed subject-matter. However, it is to be noted, that the scope of the claims is so broad, that many of the compounds claimed are structurally further from the compounds tested in the examples than the closest prior art. Furthermore, the presence of an insecticidal effect shown in the examples of the application does not necessarily imply that further pesticidal effects (e.g. molluscicidal or nematocidal) are also present. Therefore, the application does not provide sufficient evidence to reasonably expect that the claimed effects will arise within the whole scope of protection. The subject-matter of claims 7, 9, and 12 may thus not be regarded as inventive.

The compounds of claims 10 and 11 correspond to intermediates used in making the compounds of Formula (I') (see wording of claims 10 and 11 and Scheme 1 on pg. 62). Considering that, as discussed above, the compounds of Formula (I') (subject-matter of Claim 9) cannot be regarded as inventive, it is also not possible to acknowledge an inventive step for the intermediates used to produce them. Hence, the compounds of claims 10 and 11 cannot be regarded as inventive.

3.3 Industrial applicability (Art. 33(4) PCT)

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

International application No.

PCT/IB2005/001468

Is acknowledged for the whole set of claims.

4) Re Item VIII

Claims 1-8 and 12 are not supported by the description as required by Article 6 PCT, as their scope is broader than justified by the variety of substituents of the compounds actually tested and/or by the kind of pesticidal activity actually tested.

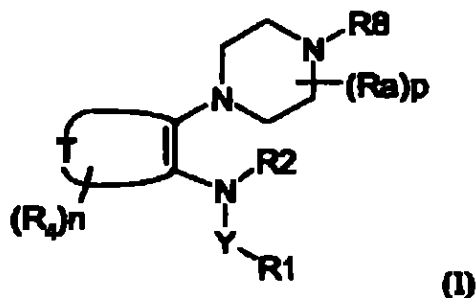
PIPERAZINE DERIVATIVES AND THEIR USE IN CONTROLLING PESTS

The present invention relates to piperazine derivatives, to processes for preparing them, to insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising them and to methods of using them to combat and control insect, acarine, mollusc and nematode pests.

Piperazine derivatives with antiprotazoal properties are disclosed in for example in US3331845 and EP103464 discloses pyrimidinyl piperazine compounds with antibacterial properties. WO02/42310 discloses 7-oxabicyclo[2.2.1]heptanes as insecticides. Piperazine derivatives with pharmaceutical properties are described in US 3457263 and WO2004/089905. The synthesis of piperazine compounds is described in J. Het. Chem., 38, 2001, 985-988.

It has now surprisingly been found that certain piperazines have insecticidal properties.

The present invention therefore provides a method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I):



Y is a single bond, C-O, C-S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2;
the ring



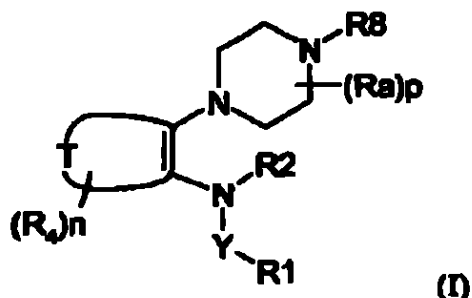
is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

R¹ is hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy carbonyl, optionally substituted alkyl carbonyl, aminocarbonyl, optionally substituted alkyl aminocarbonyl, optionally substituted dialkyl aminocarbonyl, optionally

AMENDED SHEET

CLAIMS

1. A method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I



Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2;
the ring



is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

R¹ is hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy carbonyl, optionally substituted alkyl carbonyl, aminocarbonyl, optionally substituted alkyl aminocarbonyl, optionally substituted dialkyl aminocarbonyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heterocycloxy, cyano, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted cycloalkenyl, formyl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkylthio, NO or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, COR¹⁵, optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl or R¹³ and R¹⁴ together with the N atom to which they are attached form a group -N=C(R¹⁶)-NR¹⁷R¹⁸ or R¹³ and R¹⁴ together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted

AMENDED SHEET

halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C₂₋₆)alkenyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino) or phenyl(C₂₋₆)alkynyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, or -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ where z is 1 or 2, R⁵¹ and R⁵² are each independently H, halo or C₁₋₃ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl;

each Ra is independently halogen, hydroxy, cyano, optionally substituted C₁₋₈ alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynyl, optionally substituted alkoxy carbonyl, optionally substituted alkyl carbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted C₃₋₇ cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio, optionally substituted arylthio or R²³R²⁴N where R²³ and R²⁴ are, independently, hydrogen, C₁₋₈ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, C₃₋₆ alkynyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₆ alkoxy carbonyl or R²³ and R²⁴ together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₆ alkyl groups, or two Ra groups attached to the same carbon atom are =O, =S, -NRb, -CRcRd where Rb, Rc and Rd are independently H or optionally substituted alkyl; p is 0, 1, 2, 3 or 4 or salts or N-oxides thereof.

2. A method according to claim 1 wherein the ring



AMENDED SHEET

is a 6-membered aromatic ring or is 5 or 6 membered heteroaromatic ring wherein the ring members are each independently CH, S, N, NR⁴, O, or CR⁴ provided that at least one ring member is other than CH or CR⁴ and that there are no more than one O or S atoms present in the ring.

3. A method according to claim 1 or claim 2 wherein Y is a single bond, C=O or C=S.
4. A method according to any preceding claim wherein R¹ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ cyanoalkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₇ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₆ alkoxy(C₁₋₆)alkyl, heteroaryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), aryl(C₁₋₆)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkylcarbonylamino(C₁₋₆)alkyl, aryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxycarbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (wherein the phenyl group is

AMENDED SHEET

optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ alkoxy or C₁₋₄ haloalkoxy), heterocyclyloxy (optionally substituted by halo, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ alkoxy or C₁₋₄ haloalkoxy), cyano, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₇ cycloalkenyl, heterocyclyl (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ haloalkylthio or NR¹³R¹⁴ where R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl, phenyl (which may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino or C₁₋₄ alkoxy carbonyl), phenyl (C₁₋₄)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ alkoxy carbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (C₁₋₆)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen) or heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₄ alkoxy carbonyl C₁₋₆ alkylcarbonylamino, phenyloxycarbonylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), amino, C₁₋₆ alkylamino or phenylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino)).

5. A method according to any preceding claim wherein R² is hydrogen, hydroxy, C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl.

AMENDED SHEET

substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heterocyclyloxy, cyano, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally

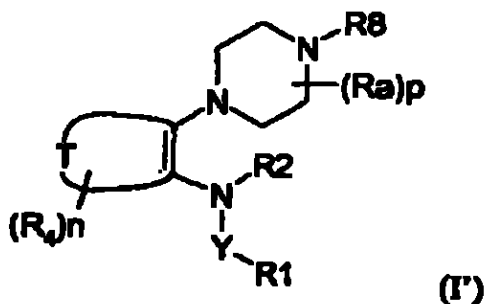
AMENDED SHEET

by halogen, C₁₋₃ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, phenoxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy or C₁₋₆ haloalkoxy), C₁₋₈ alkylthio or R¹⁹R²⁰N where R¹⁹ and R²⁰ are, independently, hydrogen, C₁₋₃ alkyl, C₃₋₇ cycloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, C₃₋₆ alkynyl, C₂₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxycarbonyl or R¹⁹ and R²⁰ together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C₁₋₆ alkyl groups; n is 0, 1, 2 or 3.

7. A method according to any preceding claim wherein R⁸ is $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ where z is 1 or 2, preferably 1, R⁵¹ and R⁵² are each independently H or C₁₋₂ alkyl, R⁵³ and R⁵⁴ are each independently H, halogen, C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl and R⁵⁵ is phenyl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, CN, NO₂, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino.
8. A method according to any preceding claim wherein Ra is independently halo, cyano, C₁₋₃ alkyl, hydroxy or two Ra groups together with the carbon atom to which they are attached form =O, =S, =NRb, =CRcRd where Rb, Rc and Rd are independently H or optionally substituted alkyl, and p is 0, 1 or 2.

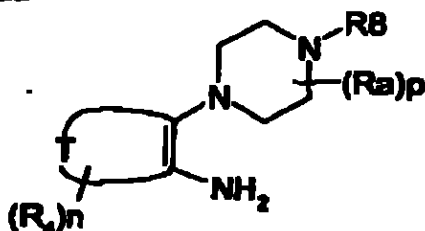
AMENDED SHEET

9. A compound of formula I'



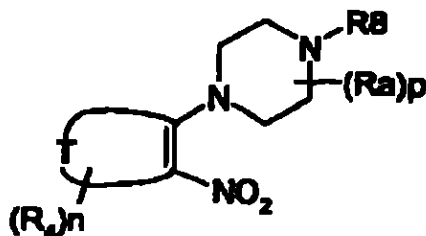
wherein R^1 , R^2 , R^4 , R_a , T , Y , n and p are as defined in relation to formula I and R^8 is $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}-CR^{54}]_z-R^{55}$ where z is 1 or 2, preferably 1, R^{51} and R^{52} are each independently H or C_{1-2} alkyl, R^{53} and R^{54} are each independently H, halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} haloalkyl and R^{55} is phenyl substituted by halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} haloalkoxy, CN, NO_2 , aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} haloalkoxy, CN, NO_2 , aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino provided that the compound is not 4,5-diamino-6-(4-cinnamyl-1-piperazinyl)-pyrimidine.

10. A compound of formula



wherein R^4 , R^8 , R_a , T , Y , n and p are as defined in relation to formula I' in claim 9 provided the compound is other than 4,5-diamino-6-(4-cinnamyl-1-piperazinyl)-pyrimidine.

11. A compound of formula



wherein R^4 , R^5 , R_a , T , Y , n and p are as defined in relation to formula I' in claim 9 provided that when T is a phenyl ring, R^5 is cinnamyl and p is 0 then R^4 is not a CF_3 or NO_2 group *para* to the piperazine ring and further provided the compound is other than 4-amino-6-(4-cinnamyl-1-piperazinyl)-5-nitro-pyrimidine.

12. An insecticidal, acaricidal or nematocidal composition comprising an insecticidally, acaricidally or nematocidally effective amount of a compound of formula I' as defined in claim 9.

Retiro folios 264, 265 y 266
" Tarjetas



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Departamento de...

264

Expediente No		06119543	No de Folio
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:

un sobre gr contiene
un Disquete

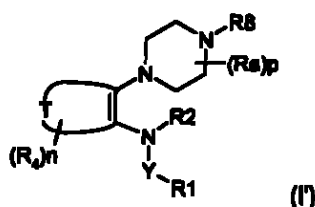
(21) N° de solicitud:	(51) Int Cl:
22) Fecha de solicitud:	(71) Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG
(30) Prioridad (31) No. Prioridad 32) Fecha (33) País 0412072.1 28/05/2004 GB	(72) Inventor(es) LOUIS-PIERRE MOLLEYRES, FREDRIK CEDERBAUM, JEROME CASSAYRE, PETER MAIENFISCH, THOMAS PITTERNA, CAMILLA CORSI
	(74) Apoderado: DRA. MARGARITA CASTELLANOS A.
(85) Fecha límite inicio fase nacional: (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 12/05/2005 No. de solicitud PCT/IB2005/001488	(87) Publicación internacional Fecha: 08/12/2005 N° publicación: WO 2005/115148
(54) Título: DERIVADOS DE PIPERAZINA Y SU USO EN EL CONTROL DE PESTICIDAS	

cada R⁴ es de manera independiente halógeno, nitrógeno, cloro, C₁₋₆ alquilo sustituido de manera opcional, C₂₋₆ alqueno sustituido de manera opcional, C₃₋₆ alquino sustituido de manera opcional, alcoxycarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C₃₋₇ cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterociclo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, alquilo sustituido de manera opcional o R²¹R²²N donde R²¹ y R²² son, de manera independiente, hidrógeno, C₁₋₆ alquilo, C₃₋₇ cicloalquilo, C₂₋₆ alqueno, C₃₋₆ alquino, C₃₋₇ cicloalquil(C₁₋₄)alquilo, C₂₋₆ haloalquilo, C₁₋₆ alcoxi(C₁₋₆)alquilo, C₁₋₆ alcoxycarbonilo o R²¹ y R²² junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con

uno o dos grupos C_{1-8} alquilo, o 2 grupos adyacentes R^4 junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6, ó 7 miembros que puede estar sustituido de manera opcional con halógeno; n es 0, 1, 2, 3 ó 4; R^6 es alquilo sustituido de manera opcional, alquenilo sustituido de manera opcional, alquililo sustituido de manera opcional, cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, alcoxycarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional o alquenilcarbonilo sustituido de manera opcional;

cada R_a es de manera independiente halógeno, hidroxilo, ciano, C_{1-8} alquilo sustituido de manera opcional, C_{2-8} alquenilo, C_{2-8} alquililo sustituido de manera opcional, alcoxycarbonilo sustituido de manera opcional, alquilcarbonilo sustituido de manera opcional, alquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, dialquilaminocarbonilo sustituido de manera opcional, C_{3-7} cicloalquilo sustituido de manera opcional, arilo sustituido de manera opcional, heteroarilo sustituido de manera opcional, heterocíclico sustituido de manera opcional, alcoxi sustituido de manera opcional, ariloxi sustituido de manera opcional, heteroariloxi sustituido de manera opcional, alquililo sustituido de manera opcional, arililo sustituido de manera opcional o $R^{23}R^{24}N$ donde R^{23} y R^{24} son, de manera independiente, hidrógeno, C_{1-8} alquilo, C_{3-7} cicloalquilo, C_{3-8} alquenilo, C_{3-8} alquililo, C_{3-7} cicloalquil(C_{1-4})alquilo, C_{2-8} haloalquilo, C_{1-8} alcoxi(C_{1-8})alquilo, C_{1-8} alcoxycarbonilo o R^{23} y R^{24} junto con el átomo N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados a partir de O, N o S y que puede estar sustituido de manera opcional con uno o dos grupos C_{1-8} alquilo, o dos grupos R_a unidos al mismo átomo de carbono son $=O$, $=S$, $=NR_b$, $=C(R_c)R_d$ donde R_b , R_c y R_d son de manera independiente H o alquilo sustituido de manera opcional; p es 0, 1, 2, 3 ó 4 o las sales o los N-óxidos de los mismos.

Un compuesto de la fórmula I'



donde R^1 , R^2 , R^4 , R_a , T, Y, n y p son como se define en relación con la fórmula I y R^3 es

$-C(R^{31})(R^{32})-(CR^{33}=CR^{34})_z-R^{35}$ donde z es 1 ó 2, con preferencia 1, R^{31} y R^{32} son cada uno de manera independiente H o C_{1-2} alquilo, R^{33} y R^{34} son cada uno de manera independiente H, halógeno, C_{1-4} alquilo o C_{1-4} haloalquilo y R^{35} es fenilo sustituido con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido con halógeno, C_{1-4} alquilo, C_{1-4} alcoxi, C_{1-4} haloalquilo, C_{1-4} haloalcoxi, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

267

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 _____

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

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

268

Doctor(a)
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA
Apoderado(a) y/o Representante de
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

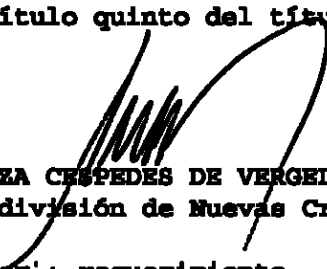
REFERENCIA	Radicación No.	6 119543
	Solicitud internacional	PCT/IB2005/001468
	Fecha inicio fase nacional	28/12/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio No.	14887

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

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CRESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 29 DIC. 2006
adpall