

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA



Organización y
Digitalización CSA Ltda



Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

08-75123

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

COMPUESTOS DE MALONITRILO

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF SE

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,

5



RECTORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-075123- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:22:48 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 232

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

22 Julio 2008

1 SOLICITUD DE:	
☒ Patente de Invención.	☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo I.	☒ Capítulo II.
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BASF SE sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania. Dirección: 67056 Ludwigshafen, Alemania Domicilio: Ludwigshafen, Alemania IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: <u>clientes@camyp.com.</u> Domicilio: Bogotá, Colombia. IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>438.019</u> T.P <u>31.929</u>
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Matthias POHLMAN Jahnstrasse 8, 67251 Freinsheim, Alemania 2. Michael HOFMANN Traminerweg 1, 67098 Bad Dürkheim, Alemania 3. Henricus Maria Martinus BASTIAANS Bartholomaeus-Arnoldi-Strasse 35, 61250 Usingen, Alemania 4. Michael RACK Hildastrasse 11/1, 69214 Eppelheim, Alemania 5. Deborah L. CULBERTSON 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, North Caroline 27526, Estados Unidos de América 6. Hassan OLOUMI-SADEGHI 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, North Caroline 27614, Estados Unidos de América 7. Takeo HOKAMA 707 Continental Circle, Apt. 625, Mountain View, California 94040, Estados Unidos de América 8. Jürgen LANGEWALD Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim, Alemania 9. Christopher PALMER 2094 Walnut Grove Avenue, San Jose, Caloifornia 92158, Estados Unidos de América
5 PCT (86)	Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2006/069686</u> Fecha: <u>13 de diciembre de 2006</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2007/071609 A1</u> Fecha: <u>28 de junio de 2007</u>
6 Título (54)	<u>COMPUESTOS DE MALONITRILO</u>

7

Clasificación Internacional (51) A01N 037/034

8

PrioridadSI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

US

(32) Fecha

22 de diciembre de 2005

(31) Número de Solicitud

60/753,346

9

Comprobante de pago No.: 08-56,245**Fecha: 14 de julio de 2008**

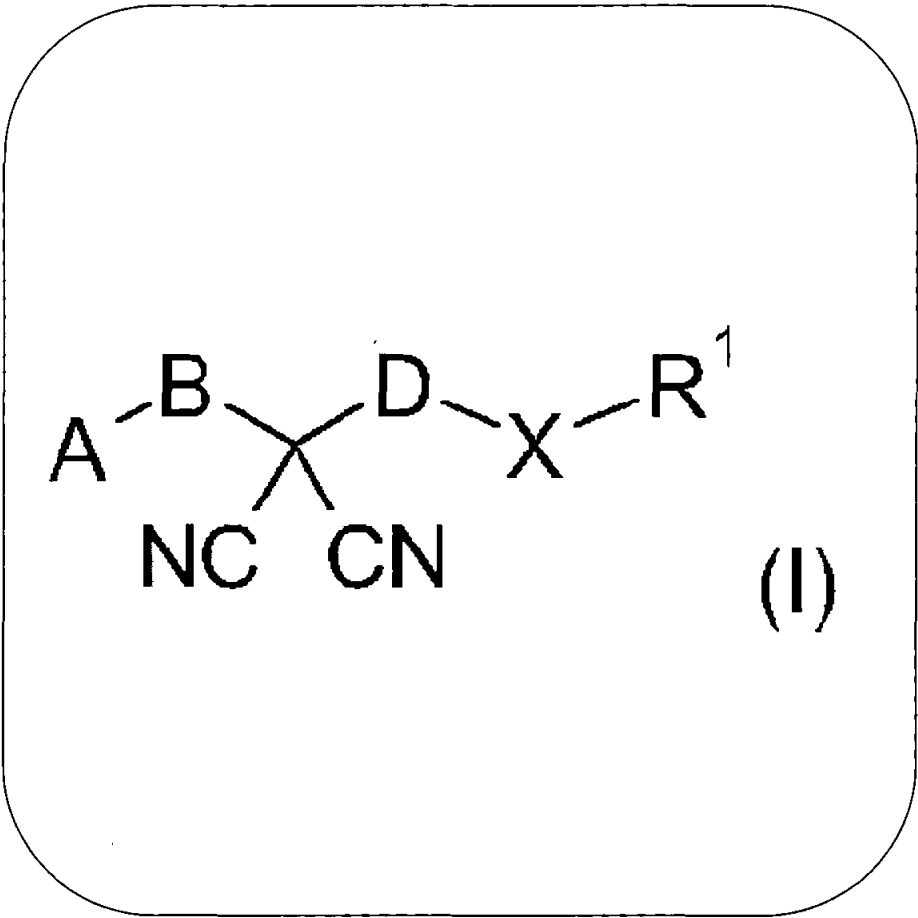
10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 501.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : *Emilio Ferrero*

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2007/071609 A1

Descripción:

Páginas 62 en el idioma original

Páginas 88 en español

Reivindicaciones: Número (s) 11

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210.** Informe de Búsqueda Internacional.
3. ☒ **Forma PCT/IB/310.** Notificación de la inscripción del cambio de Solicitante de **BASF AKTIENENGESSELLSCHAFT** a **BASF SE.**
4. ☒ **Formas PCT/IB/310.** Notificación de la inscripción del cambio de dirección de los inventores **Michael HOFMANN, Matthias POHLMAN, Takeo HOKAMA,** y la adición del inventor **Christopher PALMER.**
5. ☒ Traducción Al Español De Los Anexos Presentados Junto Con El Informe Del Examen Preliminar Internacional.
6. ☒ Extracto de publicación.

**SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a N° 72-35
BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

179

Representación y Poder de autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of- Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER- OF- ATTORNEY

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned

BASF SE

domiciliado (s) en/of 67056 Ludwigshafen, Germany

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y DANIEL PEÑA, tpa. 65620, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se presentare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and DANIEL PEÑA, tpa. 65620, domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal,

protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Dado y firmado hoy/Given and signed this 3rd day of April 2008

en/in Ludwigshafen am Rhein

por/by _____

Firma

BASF SE

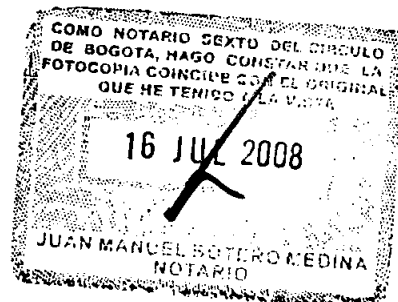
Signatura

ppa. Cimniak *ppa. Wallon*

Dr. Thomas Cimniak

Dr. Alexander Wallon

directors



U.R.Nr. 819 /2008

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

1. graduate chemist Dr. Thomas **Cimniak**, chemist, at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,
2. graduate chemist Dr. Alexander **Wallon**, chemist at Ludwigshafen/Rhine, personally known to me,

are true and valid.

Graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Wallon are acting on behalf of BASF SE at Ludwigshafen/Rhine.

After having checked today the competent register of commerce, I herewith confirm that **graduate chemist Dr. Cimniak and graduate chemist Dr. Wallon** are directors who are authorized to jointly represent

BASF SE (Societas Europaea = European Company), Ludwigshafen/Rhine. I certify that this firm is a legal person duly organized under the laws of the Federal Republic of Germany and under the laws of the EUROPEAN UNION and that it is registered at the District Court of Ludwigshafen/Germany (**HR B 6000**).

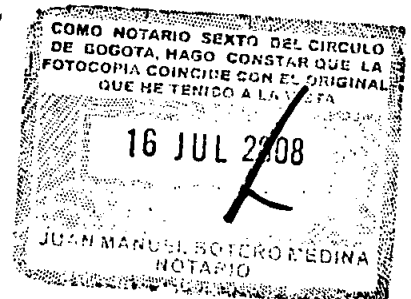
Ludwigshafen/Rhine, this 3rd day of April, 2008



notary public



Wert: 5.112,92 Euro



8

1337

APOSTILLE

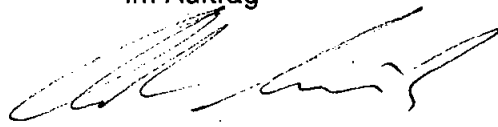
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

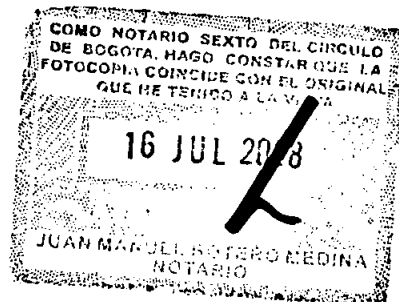
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 7. April 2008
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 511/08

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



.....
(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €



Beglaubigte Abschrift

Bescheinigung gemäß § 21 BNotO
über die Rechtsnachfolge der
BASF Aktiengesellschaft

1. **BASF Aktiengesellschaft**

Die BASF Aktiengesellschaft mit dem Sitz in Ludwigshafen am Rhein, Bundesrepublik Deutschland, war in der Rechtsform der Aktiengesellschaft deutschen Rechts bis zum 14.01.2008 im Handelsregister des Amtsgerichts -Registergericht- Ludwigshafen am Rhein, Bundesrepublik Deutschland unter HRB 3000 eingetragen.

2. **BASF SE**

Die BASF Aktiengesellschaft wurde mit Beschluss der Hauptversammlung vom 26.04.2007 im Wege des Formwechsels nach Maßgabe des Umwandlungsplanes vom 27.02.2007 in die BASF SE mit dem Sitz in Ludwigshafen am Rhein, Bundesrepublik Deutschland umgewandelt.

Die BASF SE mit dem Sitz in Ludwigshafen am Rhein, Bundesrepublik Deutschland ist seit dem 14.01.2008 in der Rechtsform der Societas Europaea im Handelsregister des Amtsgerichts -Registergericht- Ludwigshafen am Rhein, Bundesrepublik Deutschland unter HRB 6000 eingetragen.

Die BASF SE ist deshalb Rechtsnachfolgerin der BASF Aktiengesellschaft.

Ausweislich des Artikel 37 Abs. 2 der VERORDNUNG (EG) Nr. 2157/2001 DES RATES vom 08. Oktober 2001 über das Statut der Europäischen Gesellschaft (SE) hatte diese Umwandlung weder die Auflösung der Gesellschaft noch die Gründung einer neuen juristischen Person zur Folge.

3. **Nachweis**

Die vorbeschriebene Rechtsnachfolge stelle ich, Notar, hiermit fest aufgrund meiner heutigen Einsicht in die zwei genannten Handelsregister.

Ludwigshafen am Rhein (Bundesrepublik Deutschland), den 14. Januar 2008



certified copy

Certificate
in conformity with Sec. 21 of the Federal German
Ordinance for Notaries (BNotO)
concerning the legal succession of
BASF Aktiengesellschaft

1. **BASF Aktiengesellschaft**

BASF Aktiengesellschaft with registered office in Ludwigshafen am Rhein, Federal Republic of Germany, was registered in the form of a stock corporation [Aktiengesellschaft] in the commercial register of the district court -court of registry- in Ludwigshafen am Rhein, Federal Republic of Germany, under the entry number HRB 3000 until January 14, 2008.

2. **BASF SE**

As resolved by the Annual Meeting of Shareholders on April 26, 2007, BASF Aktiengesellschaft has been converted by way of change of legal form pursuant to the Conversion Plan of February 27, 2007 into BASF SE with registered office in Ludwigshafen am Rhein, Federal Republic of Germany.

BASF SE with registered office in Ludwigshafen am Rhein, Federal Republic of Germany, is registered as from January 14, 2008 in the legal form of a Societas Europaea in the commercial register of the district court - court of registry - of Ludwigshafen am Rhein, Federal Republic of Germany, under the entry number HRB 6000.

Therefore, BASF SE is the legal successor of BASF Aktiengesellschaft.

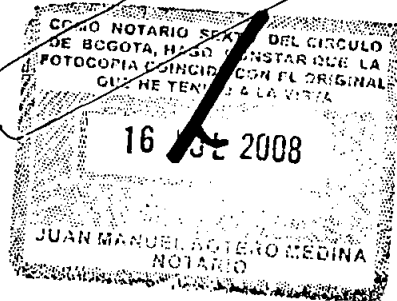
As set forth in Art. 37 para. 2 of Council Regulation (EC) No. 2157/2001 of October 8, 2001 on the Statute for a European Company (SE) this conversion neither resulted in the dissolution of the company nor in the establishment of a new legal person.

3. **Confirmation**

Based on today's inspection of the commercial register, I, Notary public, certify the aforedescribed legal succession.

Ludwigshafen/Rhine (Federal Republic of Germany),
January 14, 2008

Notar/Notary Public



Die Übereinstimmung vor-
stehender Abschrift mit
der Urschrift wird hiermit
beglaubigt.

Ludwigshafen am Rhein
(Bundesrepublik Deutschland)
den, 22. Januar 2008

I hereby certify the copy
reproduced above to be a
true and correct copy of
the original record.

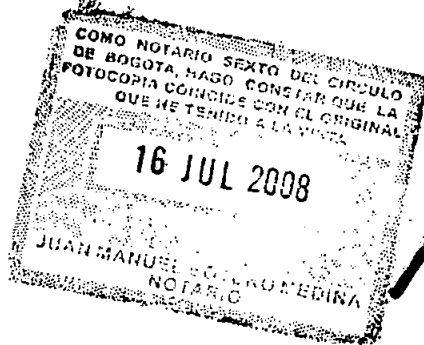
Ludwigshafen/Rhine
(Federal Republic of Germany),
January 22, 2008



Notar/Notary Public

Gebührenwert: 2.000,--EUR

Value of fee: 2.000,--EUR



10

APOSTILLE

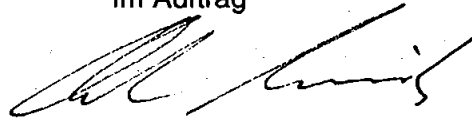
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

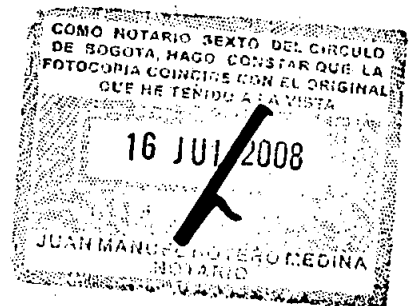
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 7. April 2008
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 512/08

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



.....
(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 10,-- €



TRADUCCIÓN OFICIAL 111/2008 DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL DE ACUERDO CON EL CUAL **BASF SE.**, EMPRESA DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, OTORGA PODER A EMILIO FERRERO, TPA 31929, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, TPA 23555 Y A DANIEL PEÑA, TPA 65620.

EXPEDIDO Y FIRMADO HOY 3 DE ABRIL DE 2008 EN LUDWIGSHAFEN AM RHEIN, POR DR. THOMAS CIMNIAK Y ALEXANDER WALLON, DIRECTORES U.R.NR. 819/2008

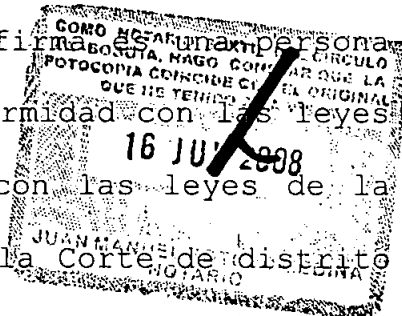
Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente certifico y confirmo que las dos firmas arriba mencionadas de 1- El químico graduado Dr. Thomas Cimniak, químico de Ludwigshafen/Rhine, personalmente conocido mío 2- El químico graduado Dr. Alexander Wallon, químico de Ludwigshafen/Rhine, personalmente conocido mío son verídicas y válidas.

Los químicos graduados, doctores Cimniak y Wallon actúan a nombre de BASF SE en Ludwigshafen/Rhine.

Después de haber verificado hoy el registro de comercio pertinente, confirmo que los químicos graduados Dr. Cimniak y Dr. Wallon son directores autorizados para representar conjuntamente a BASF SE (Empresa Europea), Ludwigshafen/Rhine. Certifico que dicha firma es una persona jurídica debidamente constituida de conformidad con las leyes de la República Federal de Alemania y con las leyes de la UNION EUROPEA y que está registrada en la Corte de distrito de Ludwigshafen/Alemania (HR B 6000)

Ludwigshafen/Rhine, 3 de abril de 2008.

Firma ilegible, notario público



Valor pagado: 5112,92 Euros

Apostilla número 91 Eb-511/08

Bogotá, 9 de mayo de 2008.

COLO-16452-841-001-6

ECN\ECN\ID-125389\WPCL002G

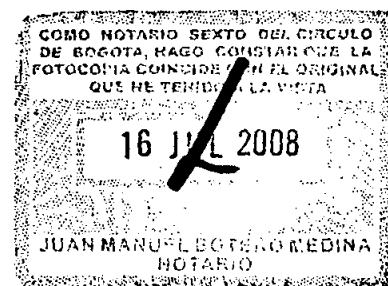
Edmundo Calado R.

Edmundo Calado R.
•TRADUCCIONES
INGLES - ESPAÑOL - COLOMBIANO
Kos. 541 febrero de 1977

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
2008 MAY 12 11:06
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.T.

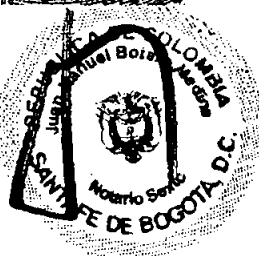
769675
Edmundo Calado R.
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.T.

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL FEITO



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE Gerardo Celis
Wagner
 COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA SANTAFE DE BOGOTA. 12 MAY 2008

 COD. DE JURIS CIVILIS



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

16 JUL 2008

JUAN MANUEL BOTERO
 NOTARIO

✓

TRADUCCION OFICIAL No. 14939

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

Traducción de los sellos y autenticaciones en alemán que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual BASF SE, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, nombra como sus representantes a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y DANIEL PEÑA tpa. 65.620, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 3 de abril de 2008 en Ludwigshafen am Rhein. Hay dos firmas ilegibles de los señores Dr. Thomas Cimniak y Dr. Alexander Wallon.

Sigue certificación en inglés de las firmas antecedentes por el notario de Ludwigshafen am Rhein, Ludwig Draxel-Fischer, el 3 de abril de 2008 bajo UR No. 819 / 2008.

Fdo.: firma ilegible. (hilo y oblea notarial). Valor: 5.112,92 Euros.

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

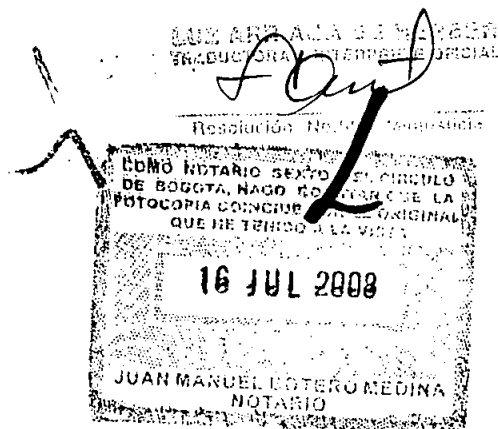
1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por el notario Draxel-Fischer
3. Actuando en calidad de notario público
4. Lleva el sello oficial del notario Draxel-Fischer,
notario de Ludwigshafen am Rhein

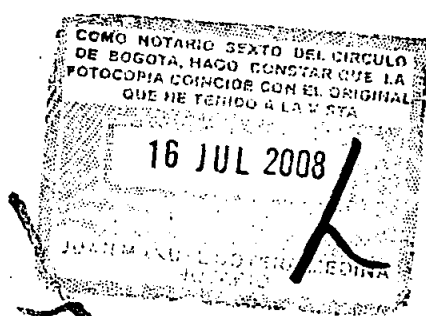
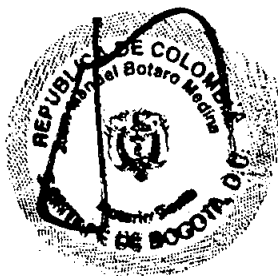
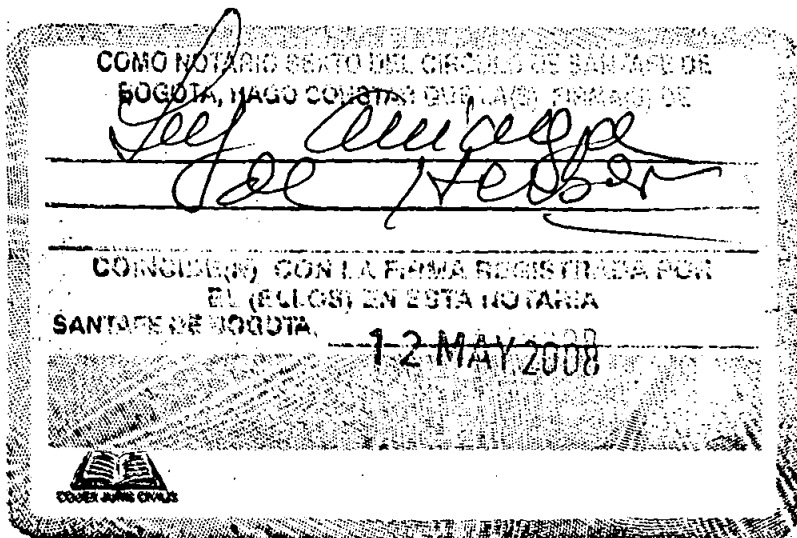
Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 7 de abril de 2008
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb – 511/08
9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

10. Firma
p.e. Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

Costas:
Derechos 12,00 €





Copia certificadaCertificación según § 21 Reglamento federal notarial (BnotO) sobre la sucesión legal de BASF Aktiengesellschaft.**1. BASF Aktiengesellschaft**

La BASF Aktiengesellschaft domiciliada en Ludwigshafen am Rhein, República Federal de Alemania, estuvo registrada hasta el 14.01.2008 en el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Ludwigshafen am Rhein, República Federal de Alemania –Registro de Comercio- en la forma jurídica del derecho alemán como Sociedad Anónima bajo HRB 3000.

2. BASF SE

Por resolución de la Asamblea General del 26.04.2007 la BASF Aktiengesellschaft por vía del cambio de forma según el plan de transformación del 27.02.2007 se transformó en la BASF SE domiciliada en Ludwigshafen am Rhein, República Federal de Alemania.

La BASF SE domiciliada en Ludwigshafen am Rhein, República Federal de Alemania, está inscrita desde el 14.01.2008 en el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Ludwigshafen am Rhein, República Federal de Alemania –Registro de Comercio- en la forma jurídica de Societas Europaea bajo HRB 6000.

Por consiguiente, la BASF SE es la sucesora legal de la BASF Aktiengesellschaft.

Según lo estipulado en el Art. 37 Inc. 2 del Reglamento (CE) Nr. 2157/2001 del Consejo del 08 de octubre de 2001 sobre los estatutos de la Sociedad Europea (SE) esta transformación no tuvo como consecuencia ni la disolución de la sociedad ni la constitución de una nueva persona jurídica.

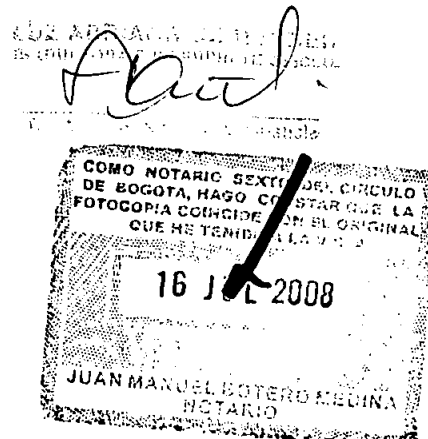
3. Certificación

Yo, el notario, certifico la sucesión antes descrita por haber tenido hoy a la vista los dos Registros Mercantiles antes mencionados.

Ludwigshafen am Rhein, (República Federal de Alemania), 14. de enero de 2008

Fdo.: firma ilegible
Notario

(sello redondo en tinta)
Ludwig Draxel-Fischer



(dorso)

Se certifica que la copia antecedente coincide con su original.

Ludwigshafen am Rhein

(República Federal de Alemania)

22 de enero de 2008.

Fdo.: firma ilegible
Notario

(sello redondo en tinta)
Ludwig Draxel-Fischer

Derechos: 2.000,-- Euros

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 7 de abril de 2008
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb – 512/08
9. Sello
(Hilo y oblea del Tribunal Regional)

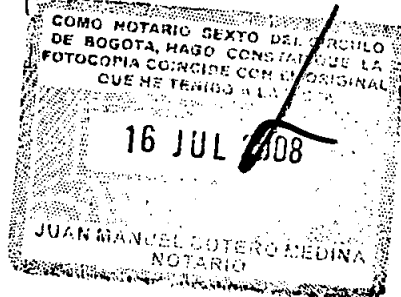
10. Firma

p. e. Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

Costas:
Derechos 10,00 €

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

Bogotá, 9 de mayo de 2008
C. 3545



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE

[Handwritten signatures]

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA
ANTAF DE BOGOTA, 12 MAY 2008



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

16 JUL 2008

JUAN MANUEL ROMERO MEDINA

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
28 June 2007 (28.06.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/071609 A1

(51) International Patent Classification:

A01N 37/34 (2006.01) C07C 321/20 (2006.01)
 A01N 43/40 (2006.01) C07D 213/67 (2006.01)
 A01N 43/52 (2006.01) C07D 271/06 (2006.01)
 A01N 47/02 (2006.01) C07D 277/32 (2006.01)
 C07C 255/37 (2006.01) C07D 317/32 (2006.01)
 C07C 317/10 (2006.01) C07D 333/28 (2006.01)

(US). HOKAMA, Takeo [US/US]; 707 Continental Circle, Apt. 625, Mountain View, CA 94040 (US). PALMER, Christopher [GB/US]; 2094 Walnut Grove Avenue, San Jose, CA 95128 (US). LANGEWALD, Jürgen [DE/DE]; Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim (DE).

(74) Common Representative: BASF Aktiengesellschaft; 67056 Ludwigshafen (DE).

(21) International Application Number:

PCT/EP2006/069686

(22) International Filing Date:

13 December 2006 (13.12.2006)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

60/753,346 22 December 2005 (22.12.2005) US

(71) Applicant (for all designated States except US): BASF Aktiengesellschaft [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): POHLMAN, Matthias [DE/DE]; Bluntschli-Str. 16, 69115 Heidelberg (DE). HOFMANN, Michael [DE/DE]; Lutherstr. 2, 67059 Ludwigshafen (DE). BASTIAANS, Henricus Maria Martinus [NL/DE]; Bartholomaeus-Arnoldi-Str. 35, 61250 Usingen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim (DE). CULBERTSON, Deborah L. [US/US]; 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526 (US). OLOUMI-SADEGHI, Hassan [US/US]; 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614

(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, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

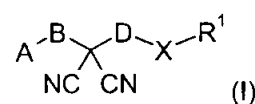
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, 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 "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: MALONONITRILE COMPOUNDS



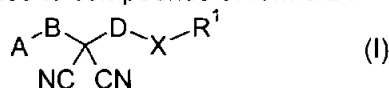
(57) Abstract: Compounds of formula I wherein X is O or S(=O)_n; n is 0, 1 or 2; R¹ is optionally substituted alkyl, haloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, cycloalkenyl, halocycloalkenyl, phenyl, hetaryl, phenylalkyl, hetaryl alkyl, optionally fused to phenyl, hetaryl or heterocyclyl; A is -NR^b₂, -C(=G)GR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=NOR^b)R^b, C(=G)[N=SR^b₂], -C(=G)NR^b-NR^b₂, C₂-C₆-alkandiyl, C₂-C₆-alkenediyl, C₁-C₃-alkyl-G-C₁-C₃-alkyl,

wherein R^b is as defined in the description, or optionally substituted phenyl, hetaryl, heterocyclyl, optionally fused to phenyl or heterocyclyl; B is an optionally substituted saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with 1 to 3 carbon chain atoms; D is an optionally substituted saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with 1 to 5 carbon chain atoms or C₃-C₆-cycloalkyl; G is oxygen or sulfur; or the enantiomers or diastereomers or salts or N-oxides thereof, processes for preparing the compounds I, pesticidal compositions and synergistic mixtures comprising compounds I, methods for the control of insects, acarids or nematodes by contacting the pests or their food supply, habitat or breeding grounds with a pesticidally effective amount of compounds formula I, and a method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasiticidally effective amount of compounds of formula I.

WO 2007/071609 A1

Malononitrile compounds

The present invention relates to compounds of formula I



5 wherein

X is oxygen or S(=O)_n;

n is 0, 1 or 2;

10

R¹ is C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl,

15

phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring is bonded to the X atom via a carbon atom of the ring, and which phenyl or which heteraromatic ring may be bonded via a C₁-C₁₀-alkyl group thus forming an aryl-C₁-C₁₀-alkyl or hetaryl-C₁-C₁₀-alkyl moiety,

20

wherein phenyl or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

25

wherein the hydrogen atoms in the above groups R¹ may be partially or in total be replaced by any combination of groups R⁵.

30

A is -NR^b₂, -C(=G)GR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=NOR^b)R^b, C(=G)[N=SR^b₂], -C(=G)NR^b-NR^b₂, wherein two groups R^b together may form a C₂-C₆-alkandiyl, C₂-C₆-alkenediyl or C₁-C₃-alkyl-G-C₁-C₃-alkyl bridge which may be substituted by 1 to 5 groups R²,

35

phenyl or a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

40

wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms

selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

wherein phenyl or the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or substituted by any combination of 1 to 6 groups R².

B is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 3 carbon chain atoms, wherein the hydrogen atoms of this chain may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R³;

D is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 5 carbon chain atoms or C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the hydrogen atoms of this chain or of this cycloalkyl may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R⁴;

R² is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, C₃-C₆-halocycloalkyloxy, C₃-C₆-halocycloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₃-C₆-cycloalkylthio, C₃-C₆-halocycloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₃-C₆-alkynylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfinyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₃-C₆-alkynylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfonyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkynylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₂-C₆-alkenyl)amino, di(C₂-C₆-alkynyl)amino, tri(C₁-C₁₀)alkylsilyl, or

phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl and which heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom or a C₁-C₄-alkyl-group,

wherein the above groups R² are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a, or

19

- 5 R^2 is $-C(=G)R^b$, $-C(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^{b_2}$, $-C(=G)[N=SR^{b_2}]$, $-C(=NOR^b)R^b$, $-C(=NOR^b)NR^{b_2}$, $-C(=NNR^{b_2})R^b$, $-OC(=G)-OC(=G)OR^b$, $N=SR^{b_2}$, $-NR^bC(=G)R^b$, $-N[C(=G)R^b]_2$, $-NR^bC(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^b-NR^{b_2}$, $-C(=G)NR^b-NR^b[C(=G)R^b]$, $-NR^b-C(=G)NR^{b_2}$, $-NR^b-NR^bC(=G)R^b$, $-NR^b-N[C(=G)R^b]_2$, $-N[C(=G)R^b]-NR^{b_2}$, $-NR^b-NR^b[(C=G)GR^b]$, $-NR^b[(C=G)NR^{b_2}]$, $-NR^b[C(=NR^b)R^b]$, $-NR^b(C=NR^b)NR^{b_2}$, $-O-NR^{b_2}$, $-O-NR^b(C=G)R^b$, $-SO_2NR^{b_2}$, $-NR^bSO_2R^b$, $-S(=O)R^b$, $-S(=O)_2R^b$, $-SO_2OR^b$, or $-OSO_2R^b$;
- 10 R^3 is halogen, cyano, amino, C_1 - C_{10} -alkyl, C_1 - C_{10} -haloalkyl, C_2 - C_{10} -alkenyl, C_2 - C_{10} -haloalkenyl, C_2 - C_{10} -alkynyl, C_3 - C_{10} -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, or
- 15 phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl or which heterocyclic or heteroaromatic ring may be bonded via an
- 20 oxygen or a sulfur atom, or
- 25 2 groups R^3 together with the carbon atom of the hydrocarbon chain may form a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen,
- 30 wherein the above groups R^3 are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a , or
- 35 R^4 is halogen, cyano, amino, C_1 - C_{10} -alkyl, C_1 - C_{10} -haloalkyl, C_2 - C_{10} -alkenyl, C_2 - C_{10} -haloalkenyl, C_2 - C_{10} -alkynyl, C_3 - C_{10} -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkenyloxy carbonyl, C_1 - C_6 -alkylamino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, tri(C_1 - C_{10})alkylsilyl, or
- 40 phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which

phenyl and which heterocyclic or heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom,

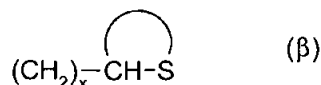
5 wherein the above groups R^4 are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a , or

the moiety R^4 -D-X- R^1 together may form a saturated or unsaturated ring of formula α



which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a , or

15 the moiety R^4 -D-X- R^1 together may form a group of formula β wherein x is 1 to 5



20 containing a saturated or unsaturated ring which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a ;

R^5 is a group R^3 ;

25 G is oxygen or sulfur;

30 R^a is each independently halogen, cyano, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, phenoxy, OR^i , SR^i , $S(=O)R^i$, $S(=O)_2R^i$, NR^iR^j , $-S(=O)_2NR^iR^j$, $C(=O)R^i$, $C(=O)OR^i$, $C(=O)NR^iR^j$, $C(=NOR^i)R^j$, $-NR^iC(=G)R^j$, $-N[C(=G)R^i]_2$, $-NR^iC(=G)OR^j$, $-C(=G)NR^iNR^j$, $-NR^iSO_2R^j$, $SiR^iR^jR^{3-y}$ (y is 0 to 3), or

35 phenyl or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein the carbon atoms in phenyl or in the heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 5 halogens;

Rⁱ, R^j are each independently hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, or C₃-C₆-halocycloalkenyl;

5

R^b is each independently C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₈-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₈-halocycloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, or C₃-C₈-halocycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, or phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring may be bound via a C₁-C₄-alkyl-moiety, and wherein the carbon atoms in phenyl or in the heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 3 groups R^a;

15

or the enantiomers or diastereomers or salts or N-oxides or polymorphs thereof.

In addition, the present invention relates to processes and intermediates for preparing the compounds I, pesticidal compositions comprising compounds I, methods for the control of insects, acarids or nematodes by contacting the insect, acarid or nematode or their food supply, habitat or breeding grounds with a pesticidally effective amount of compounds or compositions of formula I.

Moreover, the present invention also relates to a method of protecting growing plants from attack or infestation by insects or acarids by applying to the plants, or to the soil or water in which they are growing, with a pesticidally effective amount of compositions or compounds of formula I.

This invention also provides a method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasitically effective amount of compositions or compounds of formula I.

In spite of the commercial insecticides, acaricides and nematocides available today, damage to crops, both growing and harvested, caused by insects and nematodes still occurs. Therefore, there is continuing need to develop new and more effective insecticidal, acaricidal and nematocidal agents.

It was therefore an object of the present invention to provide new pesticidal compositions, new compounds and new methods for the control of insects, acarids or nematodes and of protecting growing plants from attack or infestation by insects,

40

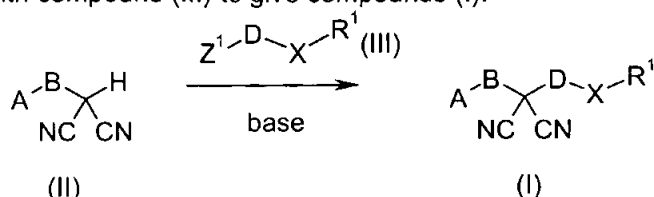
arachnids or nematodes.

We have found that these objects are achieved by the compositions and the compounds of formula I. Furthermore, we have found processes and intermediates for preparing the compounds of formula I.

Compounds exhibiting a dicyanoalkane moiety have been described in a number of patent applications: JP 2002 284608, WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 04/020399, JP 2004 99593, JP 2004 99597, WO 05/068432, WO 05/064823, EP 1555259, and WO 05/063694.

Compounds of formula I bearing a chalcogenalkane side chain have not been described in the prior art.

Compounds of formula I are obtainable, for example, by a process wherein compound (II) is reacted with compound (III) to give compounds (I):



wherein A, B, D, X and R¹ are as defined above for compounds of formula I and Z¹ represents a suitable leaving group such as a halogen atom, methanesulfonate, trifluoromethanesulfonate or toluenesulfonate.

The reaction is generally carried out in the presence of a base in a solvent.

The solvent to be used in the reaction includes, for example, acid amides such as N,N-dimethylformamide, NMP and the like, ethers such as diethyl ether, tetrahydrofuran and the like, sulfoxides and sulfones such as dimethylsulfoxide, sulfolane and the like, halogenated hydrocarbons such as 1,2-dichloroethane, chlorobenzene and the like, aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene and the like, and mixtures thereof.

The base to be used in the reaction includes, for example, inorganic bases such as sodium hydride, sodium carbonate, potassium carbonate and the like, alkali metal alkoxides such as potassium t-butoxide and the like, alkali metal amides such as lithium diisopropylamide and the like, and organic bases such as dimethylaminopyridine, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octane, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undecene and the like.

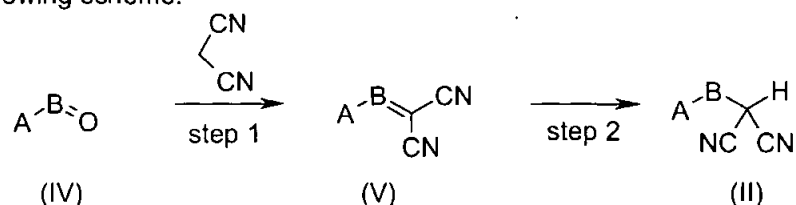
The amount of the base that can be used in the reaction is usually 1 to 10 moles

relative to 1 mole of compound (II). In addition, additives such as crown ethers may be added to accelerate the reaction.

- 5 The amount of compound (III) to be used in the reaction is usually 1 to 10 moles, preferably 1 to 2 moles relative to 1 mole of compound (II).

The reaction temperature is usually in the range of -78°C to 150°C , preferably in the range of -20°C to 80°C and the reaction time is usually in the range of 1 to 24 hours.

- 10 The compound (II) can be produced, for example, according to the route represented by the following scheme:



wherein the variables are as defined above for formula I.

- 15 Step 1: The compound (V) can be produced by reacting compound (IV) with malononitrile ($\text{CN}(\text{CH}_2)\text{CN}$; see e.g. Organic Process Research & Development 2005, 9, 133-136). The reaction is generally carried out in the presence of base in a solvent. The solvent to be used in the reaction includes, for example, acid amides such as N,N-dimethylformamide and the like, ethers such as diethyl ether, tetrahydrofuran and the like, halogenated hydrocarbons such as chloroform, 1,2-dichloroethane, chlorobenzene and the like, aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene and the like, alcohols such as methanol, ethanol, isopropyl alcohol and the like, and mixtures thereof.
- 20

- 25 The base to be used in the reaction includes, for example, tetrabutylammonium hydroxide. The amount of the base that can be used in the reaction is usually 0.01 to 0.5 moles relative to 1 mole of compound (IV).

- 30 The amount of malononitrile to be used in the reaction is usually 1 to 10 moles relative to 1 mole of compound (IV). The reaction temperature is usually in the range of -20°C to 200°C , and the reaction time is usually in the range of 1 to 24 hours.

The reaction may be carried out with removing the water formed by the reaction from the reaction system, if necessary.

- 35 After completion of the reaction, the compound of formula (V) can be isolated by employing conventional methods such as adding the reaction mixture to water, extracting with an organic solvent, concentrating the extract and the like. The isolated compound (V) can be purified by a technique such as chromatography, recrystallization

24

and the like, if necessary.

Step 2: (a) When B is substituted by one or more groups R^3 , then compound (II) can be produced by reacting compound (V) with an organometallic compound R^3-Q .

5

The reaction is generally carried out in a solvent, and if necessary, in the presence of a copper salt.

10 The solvent to be used in the reaction includes, for example, ethers such as diethyl ether, tetrahydrofuran and the like, aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene and the like, and mixtures thereof.

15 The organometallic compound R^3-Q to be used in the reaction includes, for example, organomagnesium compounds such as methylmagnesium iodide, ethylmagnesium bromide, isopropylmagnesium bromide, vinylmagnesium bromide, ethynylmagnesium bromide, dimethylmagnesium and the like, organolithium compounds such as methyllithium and the like, organozinc compounds such as diethylzinc and the like, and organocopper compounds such as trifluoromethylcopper and the like. The amount of the organometallic compound that can be used in the reaction is usually 1 to 10 moles
20 relative to 1 mole of compound (V).

The copper salt to be used in the reaction includes, for example, cuprous (I) iodide, cuprous (I) bromide and the like. The amount of the copper salt to be used in the reaction is usually not more than 1 mole relative to 1 mole of compound (V).
25 The reaction temperature is usually in the range of -20°C to 100°C , and the reaction time is usually in the range of 1 to 24 hours.

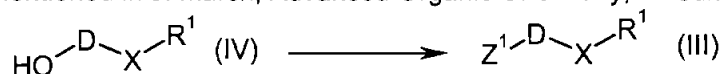
After completion of the reaction, the compound of formula (II) can be isolated by employing conventional methods such as adding the reaction mixture to water,
30 extracting with an organic solvent, concentrating the extract and the like. The isolated compound (II) can be purified by a technique such as chromatography, recrystallization and the like, if necessary.

Step 2: (b) When B is unsubstituted, the compound (II) can be produced by reacting
35 compound (V) with a reducing agent such as formic acid in the presence of a base as described e.g. in J. Org. Chem. 2005, 70, p. 3591, or with Mg in the presence of ZnCl_2 as described in Synlett. 2005, p. 523-525 or any other suitable reducing agent.

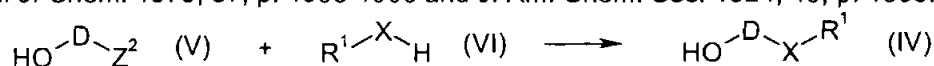
After completion of the reaction, the compound of formula (II) can be isolated by
40 employing conventional methods such as adding the reaction mixture to water, extracting with an organic solvent, concentrating the extract and the like. The isolated compound (II) can be purified by a technique such as chromatography, recrystallization

and the like, if necessary.

- In general, compounds (III), if not commercially available, can be synthesized from alcohols (IV) via conversion to the respective tosylates, mesylates or halides in analogy to methods mentioned in J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 4th edition, Wiley.



- Compounds (IV) can be obtained via alkylation of compounds (V) where Z² is a suitable leaving group such as a halogen atom, methanesulfonate, trifluoromethanesulfonate or toluenesulfonate, with compounds (VI) which are suitably substituted thiols or alcohols or salts thereof in analogy to procedures described in Can. J. Chem. 1979, 57, p. 1958-1966 and J. Am. Chem. Soc. 1924, 46, p. 1503.

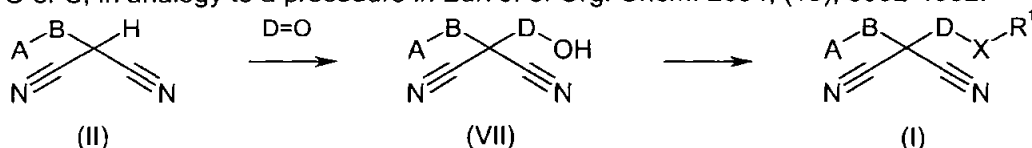


- Specifically, compounds (III) wherein R¹ is CF₃, X is sulfur and Z¹ is halogen can also be obtained by reaction of CF₃-SH with acryl halides CH₂CH-Z¹ as described in J. Am. Chem. Soc. 1962, 84, p. 3148-3153.

- Compounds (IV) wherein R¹ is CF₃ and X is sulfur can be prepared for example by alkylation of mercapto alcohols HO-D-SH under irradiation conditions as described in WO 01/36410.

Compounds (III) wherein R¹ is CF₃ and X is oxygen can be obtained as described in J. Fluorine Chemistry 1982, 21, p. 133-143 or J. Org. Chem. 2001, 66, p. 1061-1063.

- Compounds of formula I wherein D is a substituted or unsubstituted C₁-unit, the synthesis can be carried out by an addition reaction of a dinitrile (II) to a suitable carbonyl compound of formula D=O in analogy to procedures described in US 4581178, J. Fluorine Chemistry 1982, 20, p. 397-418 and European Journal of Organic Chemistry 2004, (19), p. 3992-4002 and subsequent conversion of the obtained alcohols to compounds (I) via conversion of the OH-group of (VII) into a leaving group such as a mesylate-group and subsequent reaction with an alcohol or thiol R¹-XH, X = O or S, in analogy to a procedure in Eur. J. of Org. Chem. 2004, (19), 3992-4002.



- Compounds (I) of the invention wherein X is S and n is 1 can be obtained from the corresponding compounds (I) wherein X is S and n is 0 via oxidation with oxidizing agents such as 30 % H₂O₂, NaIO₄ or tBuOCl according to procedures described in J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 4th edition, Wiley, chapter 19, pp. 1201 and literature cited therein. Further oxidation with, for example, KMnO₄, KHSO₅ or another

equivalent of 30 % H₂O₂ as described in the literature cited above, yields compounds (I) wherein X is S and n is 2.

If individual compounds I are not obtainable by the routes described above, they can be prepared by derivatization of other compounds I or by customary modifications of the synthesis routes described.

After completion of the reaction, the compounds can be isolated by employing conventional methods such as adding the reaction mixture to water, extracting with an organic solvent, concentrating the extract and the like. The isolated compounds can be purified by a technique such as chromatography, recrystallization and the like, if necessary.

The preparation of the compounds of formula I may lead to them being obtained as isomer mixtures. If desired, these can be resolved by the methods customary for this purpose, such as crystallization or chromatography, also on optically active adsorbate, to give the pure isomers. The compounds of formula I may be present in different crystalline modifications (polymorphs) which may have different biological activity. These are also subject of this invention.

Agronomically acceptable salts of the compounds I can be formed in a customary manner, e.g. by reaction with an acid of the anion in question.

In this specification and in the claims, reference will be made to a number of terms that shall be defined to have the following meanings:

"Salt" as used herein includes adducts of compounds I with maleic acid, dimaleic acid, fumaric acid, difumaric acid, methane sulfenic acid, methane sulfonic acid, and succinic acid. Moreover, included as "salts" are those that can form with, for example, amines, metals, alkaline earth metal bases or quaternary ammonium bases, including zwitterions. Suitable metal and alkaline earth metal hydroxides as salt formers include the salts of barium, aluminum, nickel, copper, manganese, cobalt zinc, iron, silver, lithium, sodium, potassium, magnesium or calcium. Additional salt formers include chloride, sulfate, acetate, carbonate, hydride, and hydroxide. Desirable salts include adducts of compounds I with maleic acid, dimaleic acid, fumaric acid, difumaric acid, and methane sulfonic acid.

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

The term "alkyl" as used herein refers to a branched or unbranched saturated hydrocarbon group having 1 to 6 carbon atoms, such as C₁-C₆-alkyl, for example methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-

dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl.

The term "haloalkyl" as used herein refers to a straight-chain or branched alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above), where some or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen atoms as mentioned above, for example C₁-C₂-haloalkyl, such as chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl and pentafluoroethyl;

Similarly, "alkoxy" and "alkylthio" refer to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through oxygen or sulfur linkages, respectively, at any bond in the alkyl group. Examples include methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, methylthio, ethylthio, propylthio, isopropylthio, and n-butylthio.

Similarly, "alkylsulfinyl" and "alkylsulfonyl" refer to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through -S(=O)- or -S(=O)₂-linkages, respectively, at any bond in the alkyl group. Examples include methylsulfinyl and methylsulfonyl.

Similarly, "alkylamino" refers to a nitrogen atom which carries 1 or 2 straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which may be the same or different. Examples include methylamino, dimethylamino, ethylamino, diethylamino, methylethylamino, isopropylamino, or methylisopropylamino.

The term "alkylcarbonyl" refers to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through a -C(=O)- linkage, respectively, at any bond in the alkyl group. Examples include acetyl and propionyl.

The term "alkenyl" as used herein intends a branched or unbranched unsaturated hydrocarbon group having 2 to 6 carbon atoms and a double bond in any position, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methyl-ethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl; 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-

- dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- 15 The term "alkynyl" as used herein refers to a branched or unbranched unsaturated hydrocarbon group containing at least one triple bond, such as ethynyl, propynyl, 1-butyne, 2-butyne, and the like.
- 20 Cycloalkyl as used herein refers to monocyclic 3- to 6-membered saturated carbon atom rings, e.g. C₃-C₆-cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, or cyclohexyl.
- 25 A 5-or 6-membered heteroaromatic ring which contains 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur may be a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, preferably from oxygen and nitrogen, such as pyrrol, pyrazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, thiazol, isothiazol, thiodiazol; or a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 heteroatom selected from oxygen and sulfur, such as furane or thiophen; or a 6-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, preferably from oxygen and nitrogen, such as pyridine, pyrazine, pyrimidine, pyridazine or triazine.
- 30 A 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur is e.g. pyridine, pyrimidine, (1,2,4)-oxadiazole, (1,3,4)-oxadiazole, pyrrole, furan, thiophene, oxazole, thiazole, imidazole, pyrazole, isoxazole, 1,2,4-triazole, tetrazole, pyrazine, pyridazine, oxazoline, thiazoline, tetrahydrofuran, tetrahydropyran, morpholine, piperidine, piperazine, pyrroline, pyrrolidine, oxazolidine, thiazolidine. Most preferably,
- 40 this ring system is dioxolan, furan, oxazol, thiazol, or tetrahydrofuran.

29

- A 5- or 6-membered heteroaromatic ring which contains 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur may be a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, such as pyrrol, pyrazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, thiazol, isothiazol, thiodiazol; or a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 heteroatom selected from oxygen and sulfur, such as furane or thiophen; or a 6-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, preferably from nitrogen, such as pyridine, pyrazine, pyrimidine, pyridazine or triazine.
- When fused to a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, this fused ring system is e.g. pyrimidotriazolyl.

- A 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen is e.g. a 5- to 7-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 or 1 further heteroatoms independently selected from oxygen and nitrogen, such as morpholine, piperazin, piperidine, or pyrrolidine.
- When fused to a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, this fused ring system is e.g. indoline.

- Phenyl which is fused to phenyl or a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur is e.g. naphthalin, benzoxazolyl, benzthiazolyl, benzimidazolyl, benzoxadiazolyl, or benzthiadiazolyl.

The saturated or unsaturated ring of formula α



- which may have 5 to 7 ring members and besides X 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen, e.g. is furanyl, thiophenyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiophenyl oxide or tetrahydrothiophenyl dioxide.

The group of formula β



- which contains a saturated or unsaturated ring which may have 5 to 7 ring members and besides X 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen e.g. is $\text{---CH}_2\text{---}$ furanyl, $\text{---CH}_2\text{---}$ thiophenyl, $\text{---CH}_2\text{---}$ tetrahydrofuranyl, $\text{---CH}_2\text{---}$ tetrahydrothiophenyl, $\text{---CH}_2\text{---}$ tetrahydrothiophenyl oxide, $\text{---CH}_2\text{---}$ tetrahydrothiophenyl dioxide, $\text{---(CH}_2)_2\text{---}$ furanyl, $\text{---(CH}_2)_2\text{---}$ thiophenyl, $\text{---(CH}_2)_2\text{---}$ tetrahydrofuranyl, $\text{---(CH}_2)_2\text{---}$

tetrahydrothiophenyl, $-(CH_2)_2$ -tetrahydrothiophenyl oxide or $-(CH_2)_2$ -tetrahydrothiophenyl dioxide. The variable x in group β preferably is 1 or 2.

- 5 With respect to the intended use of the compounds of formula I, particular preference is given to the following meanings of the substituents, in each case on their own or in combination. For the precursors of the inventive compounds, these preferred substituents or the preferred combination of substituents apply accordingly.

10 A compound of formula I wherein X is oxygen or sulfur.

A compound of formula I wherein X is $S(=O)_n$.

A compound of formula I wherein X is sulfur.

A compound of formula I wherein X is $S(=O)$.

15

A compound of formula I wherein R^1 is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl or phenyl, preferably C_1 - C_6 -haloalkyl.

- 20 A compound of formula I wherein R^1 is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl or phenyl, wherein these groups may be partially or fully halogenated and/or substituted with 1 to 3 groups selected from cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, or C_3 - C_6 -haloalkynyloxy.

25

A compound of formula I wherein R^1 is C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl or phenyl, wherein these groups may be partially or fully halogenated and/or substituted with 1 to 3 groups selected from cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy or C_1 - C_6 -haloalkoxy.

- 30 A compound of formula I wherein A is $-C(=G)GR^b$, or phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring
35 may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein phenyl or the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or substituted by any combination of 1 to 6 groups R^2 .

40

A compound of formula I wherein A is phenyl or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

- wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein phenyl or the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the
 5 respective fused ring systems may be unsubstituted or substituted by any combination of 1 to 6 groups R².

A compound of formula I wherein B is a hydrocarbon chain with one carbon chain atom, preferably -CH₂- or -CH(CH₃)-.

10

A compound of formula I wherein D is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with 2 to 4 carbon chain atoms or cyclopropyl, preferably a saturated hydrocarbon chain with 2 to 4 carbon chain atoms.

- 15 A compound of formula I wherein R² is halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, C₃-C₆-halocycloalkyloxy,
 20 C₃-C₆-halocycloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₃-C₆-cycloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl or C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, preferably halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio or C₁-C₆-haloalkylthio.

- A compound of formula I wherein R³ is halogen, cyano, C₁-C₁₀-alkyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₂-C₁₀-alkenyl, C₂-C₁₀-haloalkenyl, C₂-C₁₀-alkynyl, C₃-C₁₀-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy or C₃-C₆-haloalkynyloxy, preferably halogen, cyano, C₁-C₁₀-alkyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₆-haloalkoxy.

30

- A compound of formula I wherein R⁴ is halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy or C₃-C₆-haloalkynyloxy.
 35

A compound of formula I wherein R⁴ is halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₆-haloalkoxy.

- 40 A compound of formula I wherein R^a is each independently halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, ORⁱ, SRⁱ, S(=O)Rⁱ, S(=O)₂Rⁱ, NRⁱRⁱ, -S(=O)₂NRⁱRⁱ,

$C(=O)OR^i$, $C(=O)NR^iR^i$, or phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur.

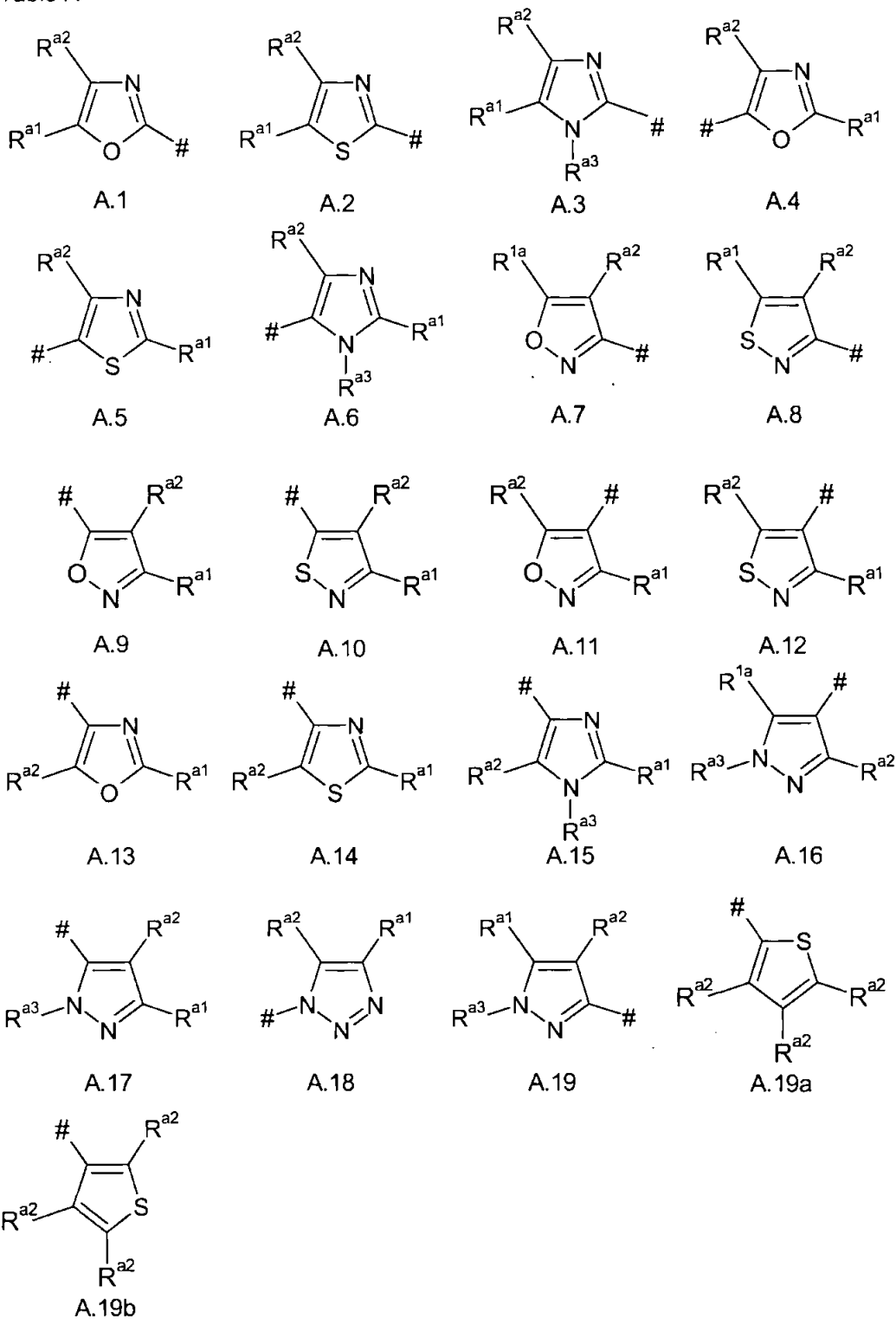
- 5 A compound of formula I wherein R^a is each independently halogen, cyano, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl or C_1 - C_6 -alkoxy.

- 10 A compound of formula I wherein R^b is each independently C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl or C_3 - C_6 -halocycloalkyl.

- A compound of formula I wherein
D is selected from $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $-CH(CF_3)-$, $-(CH_2)_2-$, cyclopropyl, $-CH_2C(CH_3)_2-$, $-CH(CH_3)CH_2-$, $-CH_2CH(CH_3)-$, or $-(CH_2)_4-$;
15 X is oxygen, sulfur, $S(=O)$ or $S(=O)_2$; and
 R^1 is CH_3 , CH_2CH_3 , $(CH_2)_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, $(CH_2)_2CH_3$, $CH_2CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, phenyl, pentachlorophenyl, pentafluorophenyl, CH_2CCH_2 , cyclopropyl, CH_2CCH , benzyl, CF_3 , CCl_3 , CH_2CF_3 , CH_2CHCl_2 , CF_2CF_3 , cyclopentyl, cyclohexyl, $CH_2CH(CF_3)_2$, or
20 the moiety $-D-X-R^1$ together forms furanyl, tetrahydrofuranyl, thiophenyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiophenyl oxide, tetrahydrothiophenyl dioxide, 3- CF_3 -thiophen-1-yl, 3- CF_3 -tetrahydrothiophen-1-yl, 3- CF_3 -furan-1-yl, or 3- CF_3 -tetrahydrofuran-1-yl.

A compound of formula I wherein A is selected from table A.

Table A



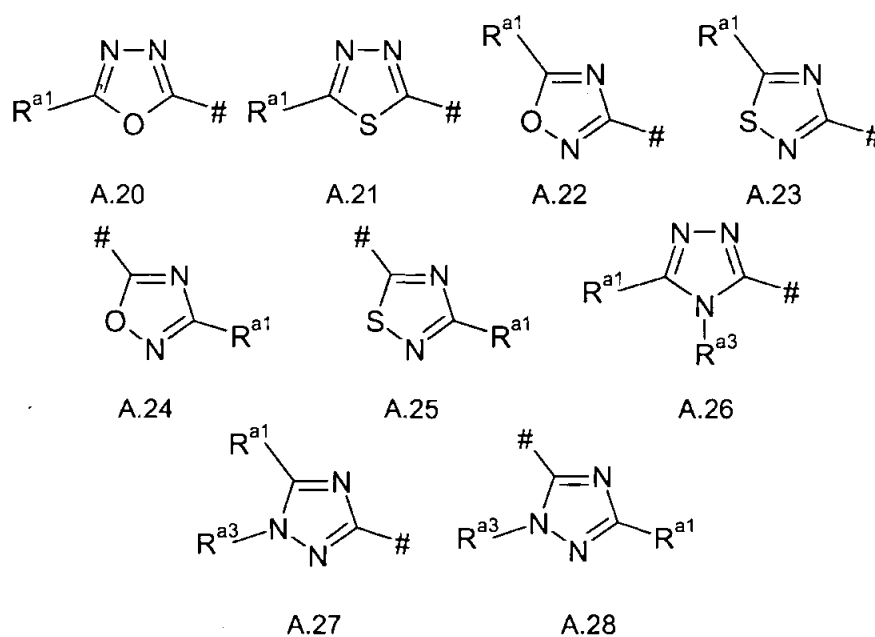
denotes the binding site.

34

- In the heterocycles A.1 to A.19 of table A, R^{a1} and R^{a2} preferably are each independently hydrogen, CH_3 , CH_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, cyclopropyl, 1-methylcyclopropyl, $C(CH_3)_3$, $CH_2C(CH_3)_3$, $C(CH_3)_2CH_2CH_3$, 1-methylcyclohexyl, cyclohexyl, 1-methylcyclopentyl, cyclopentyl, phenyl, F, Cl, Br, CN, NO_2 , $OCHF_2$, OCH_3 , OCH_2CH_3 , CF_3 , OCF_3 , SCH_3 , or SCF_3 , most preferably hydrogen, CH_3 , $CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, phenyl, F, Cl, CN, CF_3 or SCF_3 .
- In the groups A.1 to A.19 of table A, R^{a3} preferably is CH_3 , CH_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, cyclopropyl, or phenyl.

- 10 A compound of formula I wherein A is selected from table B.

Table B



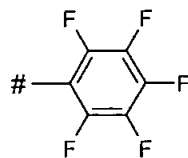
15

denotes the binding site.

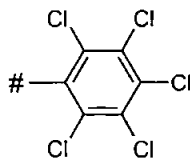
- In the groups A.20 to A.28 of table B, R^{a1} preferably is hydrogen, CH_3 , CH_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, cyclopropyl, $C(CH_3)_3$, $CH_2C(CH_3)_3$, $C(CH_3)_2CH_2CH_3$, 1-methylcyclohexyl, cyclohexyl, 1-methylcyclopentyl, cyclopentyl, CF_3 , phenyl, benzyl, NH_2 , $N(CH_3)_2$ or $NHC(=O)CH_3$, most preferably CH_3 , CH_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, cyclopropyl, $C(CH_3)_3$, $CH_2C(CH_3)_3$, $C(CH_3)_2CH_2CH_3$, CF_3 , phenyl, benzyl, or $NHC(=O)CH_3$.
- 20 In the groups A.20 to A.28 of table B, R^{a3} preferably is CH_3 , CH_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)_2$, cyclopropyl, or phenyl.
- 25

A compound of formula I wherein A is selected from table C.

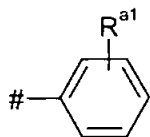
Table C



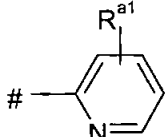
A.29



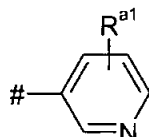
A.30



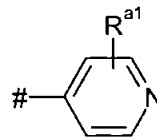
A.31



A.32

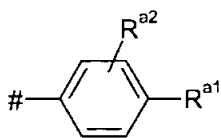


A.33

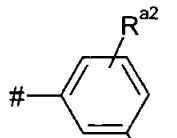


A.34

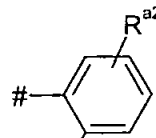
5



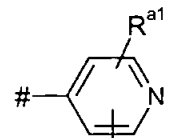
A.35



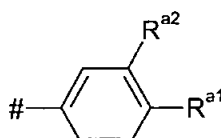
A.36



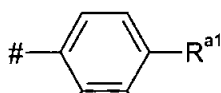
A.37



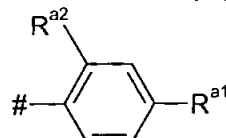
A.37a



A.38



A.39



A.40

denotes the binding site.

10

In the groups A.31 to A.40 of table C the group R^{a1} is selected from hydrogen, CH₃, CH₂CH₃, CHCH₂, CCH, CH₂CHCH₂, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, CH₂CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, C(CH₃)₃, OCH(CH₃)CH₂CH₃, benzyl, phenoxy, thiophenyl, -S-(4-CH₃)C₆H₅, O-(4-Cl)C₆H₅, O-(3-Cl)-C₆H₅, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, OCH₃, OCF₃,

15 OCF₂H, OCH₂CH₃, OCH₂CF₃, OCF₂CF₂H, OCF₂Cl, OCBF₂, OCH₂CH₂CH₃, OCH₂CH=CH₂, OCH(CH₃)₂, C(=O)CH₃, C(=O)OCH₃, CF₃, CF(CF₃)₂, SCH₃, SCF₃, or SO₂CH₃, preferably from CH₃, C(CH₃)₃, F, Cl, Br, I, CN, OCH₃, SCF₃, CF₃, or CF(CF₃)₂

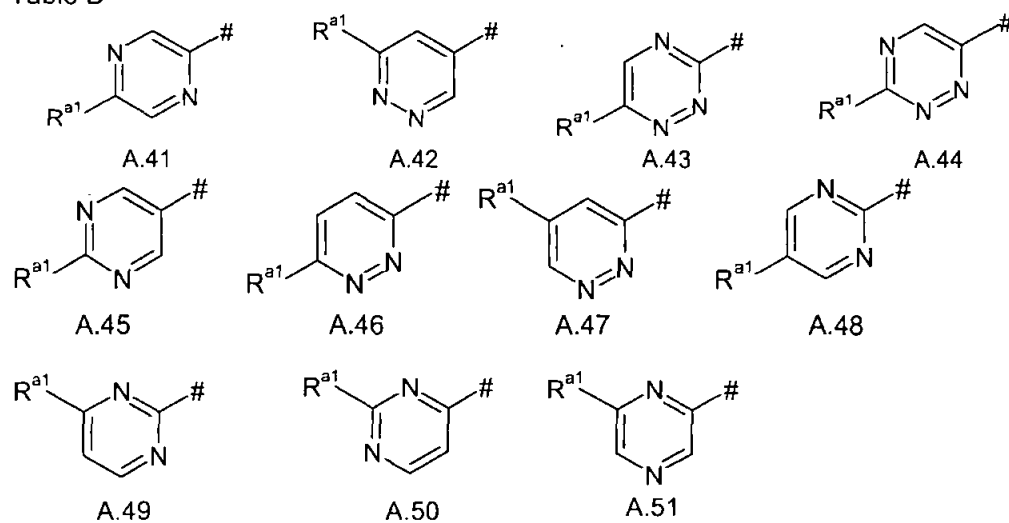
R^{a2} is selected from F, Cl, CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃, NO₂, or phenoxy, preferably from F,

20 Cl, or CF₃.

A compound of formula I wherein A is selected from table D.

36

Table D



5

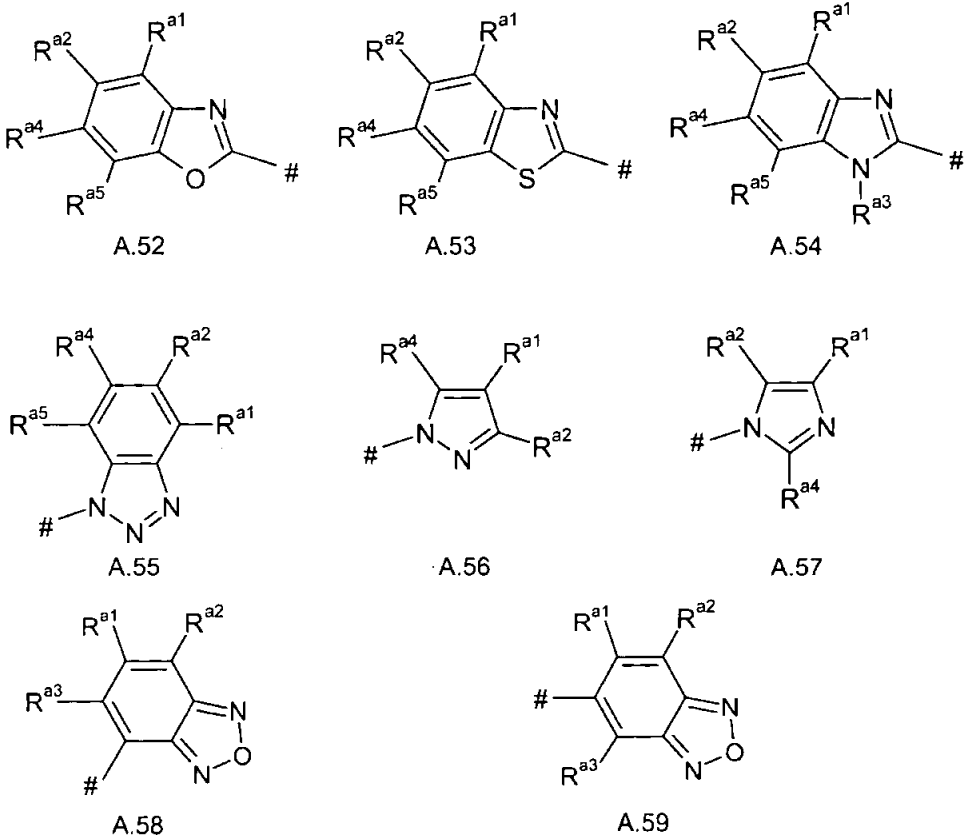
denotes the binding site.

In the groups A.41 to A.51 of table D the group R^{a1} is selected from hydrogen, F, Cl, Br, CN, NO₂, CH₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₂H, CH₂F, Et, CCH, CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, SCH₃, SCF₃, SO₂CH₃, SO₂CF₃, OCH₂CCH, or OCH₂CCCH₃.

10

A compound of formula I wherein A is selected from table E.

Table E

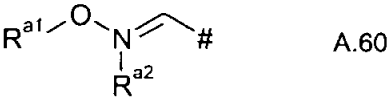


5 # denotes the binding site.

In the groups A.52 to A.57 of table E the groups R^{a1}, R^{a2}, R^{a4}, and R^{a5} preferably are each independently selected from hydrogen, CH₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, cyclopropyl, 1-methylcyclopropyl, C(CH₃)₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, -CH₂-C(CH₃)₃,
10 C(CH₃)₂CH₂CH₃, 1-methylcyclohexyl, cyclohexyl, 1-methylcyclopentyl, cyclopentyl, phenyl, F, Cl, Br, CN, NO₂, OCHF₂, OCH₃, OCH₂CH₃, CF₃, SCH₃, or SCF₃, most preferably hydrogen, CN, CH₃, F, Cl, or CF₃.

A compound of formula I wherein A is selected from table F.

15 Table F



denotes the binding site.

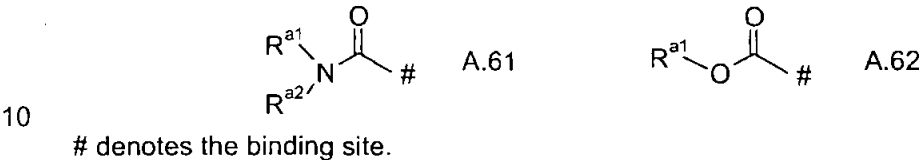
In the group A.60 of table F, R^{a1} is selected from hydrogen, CH₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, (CH₂)₃CH₃, C(CH₃)₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, (CH₂)₄CH₃, CH₂C(CH₃)₃, CH(CH₃)CH(CH₃)₂, (CH₂)₂CH(CH₃)₂, CH₂CF₃, (CH₂)₂CF₃, (CH₂)₃CF₃,
20

CH₂CHCH₂, CH₂CHC(CH₃)₂, CH₂CHCHCl, CH₂CHCBr₂, CH₂CCH, CH₂cyclopropyl, CH₂cyclobutyl, CH₂cyclopentyl, CH₂-cyclohexyl, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, (CH₂)₂F, (CH₂)₃F, (CH₂)C₆H₅, (CH₂)(2-Cl-Phenyl), (CH₂)(3-Cl-Phenyl) or (CH₂)(4-Cl-Phenyl).

5 R^{a2} is selected from CH₃, CF₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, (CH₂)₃CH₃, C(CH₃)₃, or phenyl.

A compound of formula I wherein A is selected from table G.

Table G



In the groups A.61 and A.62 of table G, R^{a1} and R^{a2} each independently are selected from hydrogen, CH₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, cyclopropyl, (CH₂)₃CH₃, C(CH₃)₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, CH₂CCH, CH₂CHCH₂, C(CH₃)₃CCH, C₆H₅, CH₂C₆H₅, CF₃, CH₂F, CH₂CN, CF(CF₃)₂, CH₂OCH₃, CH₂OCH₂F, C(=O)CH₃, C(=O)C₆H₅, S(=O)₂C₆H₅, or S(=O)₂[(p-CH₃)C₆H₄].

15 R^{a1} preferably is selected from (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, cyclopropyl C(CH₃)₃, CH₂CN, or CH₂OCH₃, R^{a2} preferably is selected from hydrogen or CH₃.

20 A compound of formula I wherein
D is selected from -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH(CF₃)-, -(CH₂)₂-, cyclopropyl, -CH₂C(CH₃)₂-, -CH(CH₃)CH₂-, -CH₂CH(CH₃)-, or -(CH₂)₄-;
X is oxygen, sulfur, S(=O) or S(=O)₂; and
25 R¹ is CH₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, (CH₂)₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, phenyl, pentachlorophenyl, pentafluorophenyl, CH₂CCH₂, cyclopropyl, CH₂CCH, benzyl, CF₃, CCl₃, CH₂CF₃, CH₂CHCl₂, CF₂CF₃, cyclopentyl, cyclohexyl, CH₂CH(CF₃)₂, or the moiety -D-X-R¹ together forms furanyl, tetrahydrofuranyl, thiophenyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiophenyl oxide, tetrahydrothiophenyl dioxide, 3-CF₃-
30 thiophen-1-yl, 3-CF₃-tetrahydrothiophen-1-yl, 3-CF₃-furan-1-yl, or 3-CF₃-tetrahydrofuran-1-yl.

A compound of formula I wherein the moiety D-X-R¹ is selected from table H.

Table H

No.	D	X	R ¹
W-1	-CH ₂ -	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-2	-CH(CH ₃)-	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-3	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-4	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-5	-CH ₂ -	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-6	-CH(CH ₃)-	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-7	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-8	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-9	-CH ₂ -	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-10	-CH(CH ₃)-	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-11	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-12	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-13	-CH ₂ -	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-14	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-15	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-16	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-17	-CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂
W-18	-CH(CH ₃)-	O	CH(CH ₃) ₂
W-19	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂
W-20	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH(CH ₃) ₂
W-21	-CH ₂ -	S	CH(CH ₃) ₂
W-22	-CH(CH ₃)-	S	CH(CH ₃) ₂
W-23	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH(CH ₃) ₂
W-24	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH(CH ₃) ₂
W-25	-CH ₂ -	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-26	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-27	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-28	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-29	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-30	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-31	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-32	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-33	-CH ₂ -	O	C(CH ₃) ₃
W-34	-CH(CH ₃)-	O	C(CH ₃) ₃
W-35	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	C(CH ₃) ₃
W-36	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	C(CH ₃) ₃
W-37	-CH ₂ -	S	C(CH ₃) ₃

40

No.	D	X	R ¹
W-38	-CH(CH ₃)-	S	C(CH ₃) ₃
W-39	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	C(CH ₃) ₃
W-40	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	C(CH ₃) ₃
W-41	-CH ₂ -	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-42	-CH(CH ₃)-	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-43	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-44	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-45	-CH ₂ -	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-46	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-47	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-48	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-49	-CH ₂ -	O	CF ₃
W-50	-CH(CH ₃)-	O	CF ₃
W-51	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₃
W-52	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₃
W-53	-CH ₂ -	S	CF ₃
W-54	-CH(CH ₃)-	S	CF ₃
W-55	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₃
W-56	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₃
W-57	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₃
W-58	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₃
W-59	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₃
W-60	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₃
W-61	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃
W-62	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₃
W-63	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃
W-64	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₃
W-65	-CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃
W-66	-CH(CH ₃)-	O	CH ₂ CF ₃
W-67	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃
W-68	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH ₂ CF ₃
W-69	-CH ₂ -	S	CH ₂ CF ₃
W-70	-CH(CH ₃)-	S	CH ₂ CF ₃
W-71	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH ₂ CF ₃
W-72	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH ₂ CF ₃
W-73	-CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-74	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-75	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-76	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-77	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃

41

No.	D	X	R ¹
W-78	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-79	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-80	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-81	-CH ₂ -	O	cyclo-C ₅ H ₉
W-82	-CH(CH ₃)-	O	cyclo-C ₅ H ₉
W-83	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	cyclo-C ₅ H ₉
W-84	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	cyclo-C ₅ H ₉
W-85	-CH ₂ -	S	cyclo-C ₅ H ₉
W-86	-CH(CH ₃)-	S	cyclo-C ₅ H ₉
W-87	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	cyclo-C ₅ H ₉
W-88	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	cyclo-C ₅ H ₉
W-89	-CH ₂ -	S(=O)	cyclo-C ₅ H ₉
W-90	-CH(CH ₃)-	S(=O)	cyclo-C ₅ H ₉
W-91	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	cyclo-C ₅ H ₉
W-92	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	cyclo-C ₅ H ₉
W-93	-CH ₂ -	S(=O) ₂	cyclo-C ₅ H ₉
W-94	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	cyclo-C ₅ H ₉
W-95	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	cyclo-C ₅ H ₉
W-96	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	cyclo-C ₅ H ₉
W-97	-CH ₂ -	O	C ₆ H ₅
W-98	-CH(CH ₃)-	O	C ₆ H ₅
W-99	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	C ₆ H ₅
W-100	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	C ₆ H ₅
W-101	-CH ₂ -	S	C ₆ H ₅
W-102	-CH(CH ₃)-	S	C ₆ H ₅
W-103	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	C ₆ H ₅
W-104	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	C ₆ H ₅
W-105	-CH ₂ -	S(=O)	C ₆ H ₅
W-106	-CH(CH ₃)-	S(=O)	C ₆ H ₅
W-107	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	C ₆ H ₅
W-108	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	C ₆ H ₅
W-109	-CH ₂ -	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-110	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-111	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-112	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-113	-CH ₂ -	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-114	-CH(CH ₃)-	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-115	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-116	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-117	-CH ₂ -	S	CH ₂ C ₆ H ₅

No.	D	X	R ¹
W-118	-CH(CH ₃)-	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-119	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-120	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-121	-CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-122	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-123	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-124	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-125	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-126	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-127	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-128	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-129	-CH ₂ -	O	CF=CF ₂
W-130	-CH(CH ₃)-	O	CF=CF ₂
W-131	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF=CF ₂
W-132	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF=CF ₂
W-133	-CH ₂ -	S	CF=CF ₂
W-134	-CH(CH ₃)-	S	CF=CF ₂
W-135	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF=CF ₂
W-136	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF=CF ₂
W-137	-CH ₂ -	S(=O)	CF=CF ₂
W-138	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF=CF ₂
W-139	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF=CF ₂
W-140	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF=CF ₂
W-141	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-142	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-143	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-144	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-145	-CH ₂ -	O	CF ₂ CF ₃
W-146	-CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CF ₃
W-147	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₂ CF ₃
W-148	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CF ₃
W-149	-CH ₂ -	S	CF ₂ CF ₃
W-150	-CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CF ₃
W-151	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₂ CF ₃
W-152	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CF ₃
W-153	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-154	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-155	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-156	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-157	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃

No.	D	X	R ¹
W-158	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-159	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-160	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-161	-CH ₂ -	O	CF ₂ CFCI
W-162	-CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CFCI
W-163	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₂ CFCI
W-164	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CFCI
W-165	-CH ₂ -	S	CF ₂ CFCI
W-166	-CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CFCI
W-167	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₂ CFCI
W-168	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CFCI
W-169	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-170	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-171	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-172	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-173	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-174	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-175	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-176	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-177	2-tetrahydrothiophenyl		
W-178	2-thiophenyl		
W-179	5-CF ₃ -2-tetrahydrothiophenyl		
W-180	5-CF ₃ -2-thiophenyl		

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

Table 1
Compounds of the formula IA wherein B denotes -CH₂-, W denotes W-1, and A corresponds in each case to a row of Table K.



Table 2
Compounds of the formula IA wherein B denotes -CH₂-, W denotes W-5, and A corresponds in each case to a row of Table K.

49

Table 3

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-17, and A corresponds in each case to a row of Table K.

5 Table 4

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-21, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 5

10 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-33, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 6

15 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-37, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 7

20 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-49, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 8

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-53, and A corresponds in each case to a row of Table K.

25 Table 9

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-65, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 10

30 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-69, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 11

35 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-81, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 12

40 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-85, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 13

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-97, and A corresponds in each case to a row of Table K.

5 Table 14

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-101, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 15

10 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-113, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 16

15 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-117, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 17

20 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}_2-$, W denotes W-129, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 18

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-131, and A corresponds in each case to a row of Table K.

25 Table 19

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-1, and A corresponds in each case to a row of Table K.

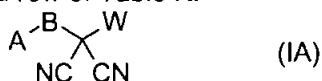


Table 20

30 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-5, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 21

35 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-17, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 22

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-21, and A corresponds in each case to a row of Table K.

40

Table 23

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-33, and A corresponds in each case to a row of Table K.

5 Table 24

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-37, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 25

10 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-49, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 26

15 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-53, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 27

20 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-65, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 28

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-69, and A corresponds in each case to a row of Table K.

25 Table 29

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-81, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 30

30 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-85, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 31

35 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-97, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 32

40 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-101, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 33

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-113, and A corresponds in each case to a row of Table K.

5 Table 34

Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-117, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 35

10 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-129, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table 36

15 Compounds of the formula IA wherein B denotes $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denotes W-131, and A corresponds in each case to a row of Table K.

Table K

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-1	A.1	H	H
IA-2	A.1	H	CH ₃
IA-3	A.1	H	C(CH ₃) ₃
IA-4	A.1	H	C ₆ H ₅
IA-5	A.1	H	cyclo-C ₃ H ₅
IA-6	A.1	H	Cl
IA-7	A.1	CH ₃	H
IA-8	A.1	C(CH ₃) ₃	H
IA-9	A.1	C ₆ H ₅	H
IA-10	A.1	cyclo-C ₃ H ₅	H
IA-11	A.1	Cl	H
IA-12	A.5	H	H
IA-13	A.5	H	CH ₃
IA-14	A.5	H	C(CH ₃) ₃
IA-15	A.5	H	C ₆ H ₅
IA-16	A.5	H	cyclo-C ₃ H ₅
IA-17	A.5	H	Cl
IA-18	A.5	CH ₃	H

48

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-19	A.5	C(CH ₃) ₃	H
IA-20	A.5	C ₆ H ₅	H
IA-21	A.5	cyclo-C ₃ H ₅	H
IA-22	A.5	Cl	H
IA-23	A.9	H	H
IA-24	A.9	H	CH ₃
IA-25	A.9	H	C(CH ₃) ₃
IA-26	A.9	H	C ₆ H ₅
IA-27	A.9	H	cyclo-C ₃ H ₅
IA-28	A.9	H	Cl
IA-29	A.9	CH ₃	H
IA-30	A.9	C(CH ₃) ₃	H
IA-31	A.9	C ₆ H ₅	H
IA-32	A.9	cyclo-C ₃ H ₅	H
IA-33	A.9	Cl	H
IA-34	A.14	H	H
IA-35	A.14	H	CH ₃
IA-36	A.14	H	C(CH ₃) ₃
IA-37	A.14	H	C ₆ H ₅
IA-38	A.14	H	cyclo-C ₃ H ₅
IA-39	A.14	H	Cl
IA-40	A.14	CH ₃	H
IA-41	A.14	C(CH ₃) ₃	H
IA-42	A.14	C ₆ H ₅	H
IA-43	A.14	cyclo-C ₃ H ₅	H
IA-44	A.14	Cl	H
IA-45	A.20	4-Cl-C ₆ H ₅	-
IA-46	A.20	CH ₃	-
IA-47	A.20	C(CH ₃) ₃	-
IA-48	A.20	CF ₃	-
IA-49	A.20	cyclo-C ₃ H ₅	-
IA-50	A.21	CH ₃	-

99

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-51	A.21	C(CH ₃) ₃	-
IA-52	A.21	CF ₃	-
IA-53	A.21	cyclo-C ₃ H ₅	-
IA-54	A.22	CH ₃	-
IA-55	A.22	C(CH ₃) ₃	-
IA-56	A.22	CF ₃	-
IA-57	A.22	cyclo-C ₃ H ₅	-
IA-58	A.29	-	-
IA-59	A.30	-	-
IA-60	A.31	3-CH ₃	-
IA-61	A.31	3-C(CH ₃) ₃	-
IA-62	A.31	3-OCF ₃	-
IA-63	A.31	3-CF ₃	-
IA-64	A.31	3-Cl	-
IA-65	A.31	3-F	-
IA-66	A.31	4-CH ₃	-
IA-67	A.31	4-C(CH ₃) ₃	-
IA-68	A.31	4-OCF ₃	-
IA-69	A.31	4-CF ₃	-
IA-70	A.31	4-Cl	-
IA-71	A.31	4-F	-
IA-72	A.33	4-Cl	-
IA-73	A.35	CH ₃	2-CH ₃
IA-74	A.35	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃
IA-75	A.35	OCF ₃	2-CH ₃
IA-76	A.35	CF ₃	2-CH ₃
IA-77	A.35	Cl	2-CH ₃
IA-78	A.35	F	2-CH ₃
IA-79	A.35	CH ₃	2-Cl
IA-80	A.35	C(CH ₃) ₃	2-Cl
IA-81	A.35	OCF ₃	2-Cl
IA-82	A.35	CF ₃	2-Cl

50

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-83	A.35	Cl	2-Cl
IA-84	A.35	F	2-Cl
IA-85	A.35	CH ₃	2-F
IA-86	A.35	C(CH ₃) ₃	2-F
IA-87	A.35	OCF ₃	2-F
IA-88	A.35	CF ₃	2-F
IA-89	A.35	Cl	2-F
IA-90	A.35	F	2-F
IA-91	A.35	CH ₃	3-CH ₃
IA-92	A.35	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃
IA-93	A.35	OCF ₃	3-CH ₃
IA-94	A.35	CF ₃	3-CH ₃
IA-95	A.35	Cl	3-CH ₃
IA-96	A.35	F	3-CH ₃
IA-97	A.35	CH ₃	3-Cl
IA-98	A.35	C(CH ₃) ₃	3-Cl
IA-99	A.35	OCF ₃	3-Cl
IA-100	A.35	CF ₃	3-Cl
IA-101	A.35	Cl	3-Cl
IA-102	A.35	F	3-Cl
IA-103	A.35	CH ₃	3-F
IA-104	A.35	C(CH ₃) ₃	3-F
IA-105	A.35	OCF ₃	3-F
IA-106	A.35	CF ₃	3-F
IA-107	A.35	Cl	3-F
IA-108	A.35	F	3-F
IA-109	A.36	CH ₃	2-CH ₃
IA-110	A.36	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃
IA-111	A.36	OCF ₃	2-CH ₃
IA-112	A.36	CF ₃	2-CH ₃
IA-113	A.36	Cl	2-CH ₃
IA-114	A.36	F	2-CH ₃

52

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-115	A.36	CH ₃	2-Cl
IA-116	A.36	C(CH ₃) ₃	2-Cl
IA-117	A.36	OCF ₃	2-Cl
IA-118	A.36	CF ₃	2-Cl
IA-119	A.36	Cl	2-Cl
IA-120	A.36	F	2-Cl
IA-121	A.36	CH ₃	2-F
IA-122	A.36	C(CH ₃) ₃	2-F
IA-123	A.36	OCF ₃	2-F
IA-124	A.36	CF ₃	2-F
IA-125	A.36	Cl	2-F
IA-126	A.36	F	2-F
IA-127	A.36	CH ₃	4-CH ₃
IA-128	A.36	C(CH ₃) ₃	4-CH ₃
IA-129	A.36	OCF ₃	4-CH ₃
IA-130	A.36	CF ₃	4-CH ₃
IA-131	A.36	Cl	4-CH ₃
IA-132	A.36	F	4-CH ₃
IA-133	A.36	CH ₃	4-Cl
IA-134	A.36	C(CH ₃) ₃	4-Cl
IA-135	A.36	OCF ₃	4-Cl
IA-136	A.36	CF ₃	4-Cl
IA-137	A.36	Cl	4-Cl
IA-138	A.36	F	4-Cl
IA-139	A.36	CH ₃	4-F
IA-140	A.36	C(CH ₃) ₃	4-F
IA-141	A.36	OCF ₃	4-F
IA-142	A.36	CF ₃	4-F
IA-143	A.36	Cl	4-F
IA-144	A.36	F	4-F
IA-145	A.37	Cl	6-Cl
IA-146	A.40	CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂

52

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-147	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-148	A.40	OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-149	A.40	CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-150	A.40	Cl	2,6-(CH ₃) ₂
IA-151	A.40	F	2,6-(CH ₃) ₂
IA-152	A.40	CH ₃	2,6-Cl ₂
IA-153	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-Cl ₂
IA-154	A.40	OCF ₃	2,6-Cl ₂
IA-155	A.40	CF ₃	2,6-Cl ₂
IA-156	A.40	Cl	2,6-Cl ₂
IA-157	A.40	F	2,6-Cl ₂
IA-158	A.40	CH ₃	2,6-F ₂
IA-159	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-F ₂
IA-160	A.40	OCF ₃	2,6-F ₂
IA-161	A.40	CF ₃	2,6-F ₂
IA-162	A.40	Cl	2,6-F ₂
IA-163	A.40	F	2,6-F ₂
IA-164	A.40	CH ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-165	A.40	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-166	A.40	OCF ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-167	A.40	CF ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-168	A.40	Cl	2-CH ₃ -6-F
IA-169	A.40	F	2-CH ₃ -6-F
IA-170	A.40	CH ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-171	A.40	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-172	A.40	OCF ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-173	A.40	CF ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-174	A.40	Cl	2-CH ₃ -6-Cl
IA-175	A.40	F	2-CH ₃ -6-Cl
IA-176	A.40	CH ₃	2-F-6-Cl
IA-177	A.40	C(CH ₃) ₃	2-F-6-Cl
IA-178	A.40	OCF ₃	2-F-6-Cl

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-179	A.40	CF ₃	2-F-6-Cl
IA-180	A.40	Cl	2-F-6-Cl
IA-181	A.40	F	2-F-6-Cl
IA-182	A.48	H	-
IA-183	A.48	F	-
IA-184	A.48	Cl	-
IA-185	A.48	Br	-
IA-186	A.48	CF ₃	-
IA-187	A.48	C(CH ₃) ₃	-
IA-188	A.48	F	-
IA-189	A.48	Cl	-
IA-190	A.48	Br	-
IA-191	A.48	CF ₃	-
IA-192	A.48	C(CH ₃) ₃	-
IA-193	A.60	CH ₃	CH ₃
IA-194	A.60	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
IA-195	A.60	C(CH ₃) ₃	CH ₃
IA-196	A.60	CH ₂ CF ₃	CH ₃
IA-197	A.60	cyclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-198	A.60	CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-199	A.60	CH ₃	CF ₃
IA-200	A.60	CH(CH ₃) ₂	CF ₃
IA-201	A.60	C(CH ₃) ₃	CF ₃
IA-202	A.60	CH ₂ CF ₃	CF ₃
IA-203	A.60	cyclo-C ₃ H ₅	CF ₃
IA-204	A.60	CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	CF ₃
IA-205	A.61	(CH ₂) ₂ CH ₃	H
IA-206	A.61	CH(CH ₃) ₂	H
IA-207	A.61	C(CH ₃) ₃	H
IA-208	A.61	CH ₂ CN	H
IA-209	A.61	cyclo-C ₃ H ₅	H
IA-210	A.61	CH ₂ OCH ₃	H

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-211	A.61	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
IA-212	A.61	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
IA-213	A.61	C(CH ₃) ₃	CH ₃
IA-214	A.61	CH ₂ CN	CH ₃
IA-215	A.61	cyclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-216	A.61	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
IA-217	A.62	(CH ₂) ₂ CH ₃	-
IA-218	A.62	CH(CH ₃) ₂	-
IA-219	A.62	C(CH ₃) ₃	-
IA-220	A.62	CH ₂ CN	-
IA-221	A.62	cyclo-C ₃ H ₅	-
IA-222	A.62	CH ₂ OCH ₃	-
IA-223	A.62	C(CH ₃) ₃	-
IA-224	A.62	C(CH ₃) ₂ CCH	-

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

- 5 insects from the order of the lepidopterans (Lepidoptera), for example *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*,
- 10 *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*,
- 15 *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea ptyocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* and *Zeiraphera canadensis*,
- 20

55

- beetles (Coleoptera), for example *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Aphthona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera* ssp., *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limoniuss californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* and *Sitophilus granaria*,
- flies, mosquitoes (Diptera), e.g. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillans*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, and *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, and *Tipula paludosa*

- thrips (Thysanoptera), e.g. *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*,
- 5 termites (Isoptera), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*, and *Coptotermes formosanus*,
- cockroaches (Blattaria - Blattodea), e.g. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*,
 10 *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, and *Blatta orientalis*,
- true bugs (Hemiptera), e.g. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*,
 15 *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*,
 20 *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*,
 25 *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyramis*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii*and, *Viteus vitifolii*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., and *Arilus critatus*.
- ants, bees, wasps, sawflies (Hymenoptera), e.g. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp. *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*,
 40 *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, and *Linepithema humile*,

- crickets, grasshoppers, locusts (Orthoptera), e.g. *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, and *Locustana pardalina*,
- Arachnoidea, such as arachnids (Acarina), e.g. of the families Argasidae, Ixodidae and Sarcoptidae, such as *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, and Eriophyidae spp. such as *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* and *Eriophyes sheldoni*; Tarsonemidae spp. such as *Phytonemus pallidus* and *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae spp. such as *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae spp. such as *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* and *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, and *Oligonychus pratensis*; Araneida, e.g. *Latrodectus mactans*, and *Loxosceles reclusa*,
- fleas (Siphonaptera), e.g. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, and *Nosopsyllus fasciatus*,
- silverfish, firebrat (Thysanura), e.g. *Lepisma saccharina* and *Thermobia domestica*,
- centipedes (Chilopoda), e.g. *Scutigera coleoptrata*,
- millipedes (Diplopoda), e.g. *Narceus* spp.,
- Earwigs (Dermaptera), e.g. *forficula auricularia*,
- lice (Phthiraptera), e.g. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* and *Solenopotes capillatus*,
- Plant parasitic nematodes such as root-knot nematodes, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne*

- incognita, *Meloidogyne javanica* and other *Meloidogyne* species; cyst nematodes, *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Globodera tabacum* and other *Globodera* species, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, and other *Heterodera* species; seed gall nematodes, *Anguina funesta*, *Anguina tritici* and other *Anguina* species; stem and foliar nematodes, *Aphelenchoides besseyi*, *Aphelenchoides fragariae*, *Aphelenchoides ritzemabosi* and other *Aphelenchoides* species; sting nematodes, *Belonolaimus longicaudatus* and other *Belonolaimus* species; pine nematodes, *Bursaphelenchus xylophilus* and other *Bursaphelenchus* species; ring nematodes, *Criconema* species, *Criconemella* species, *Criconemoides* species, and *Mesocriconema* species; stem and bulb nematodes, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci*, *Ditylenchus myceliophagus* and other *Ditylenchus* species; awl nematodes, *Dolichodorus* species; spiral nematodes, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus multicinctus* and other *Helicotylenchus* species, *Rotylenchus robustus* and other *Rotylenchus* species; sheath nematodes, *Hemicycliophora* species and *Hemicriconemoides* species; *Hirshmanniella* species; lance nematodes, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* and other *Hoplolaimus* species; false root-knot nematodes, *Nacobbus aberrans* and other *Nacobbus* species; needle nematodes, *Longidorus elongatus* and other *Longidorus* species; pin nematodes, *Pratylenchus* species; lesion nematodes, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zeae* and other *Pratylenchus* species; *Radinaphelenchus cocophilus* and other *Radinaphelenchus* species; burrowing nematodes, *Radopholus similis* and other *Radopholus* species; reniform nematodes, *Rotylenchulus reniformis* and other *Rotylenchulus* species; *Scutellonema* species; stubby root nematodes, *Trichodorus primitivus* and other *Trichodorus* species; *Paratrichodorus minor* and other *Paratrichodorus* species; stunt nematodes, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* and other *Tylenchorhynchus* species and *Merlinius* species; citrus nematodes, *Tylenchulus semipenetrans* and other *Tylenchulus* species; dagger nematodes, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema index*, *Xiphinema diversicaudatum* and other *Xiphinema* species; and other plant parasitic nematode species.

- The formulations are prepared in a known manner (see e.g. for review US 3,060,084, EP-A 707 445 (for liquid concentrates), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic

Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), for example by extending the active compound with auxiliaries suitable for the formulation of agrochemicals, such as solvents and/or carriers, if desired emulsifiers, surfactants and dispersants, preservatives, antifoaming agents, anti-freezing agents, for seed treatment formulation
5 also optionally colorants and binders.

Examples of suitable solvents are water, aromatic solvents (for example Solvesso products, xylene), paraffins (for example mineral oil fractions), alcohols (for example methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (for example cyclohexanone,
10 gamma-butyrolactone), pyrrolidones (NMP, NOP), acetates (glycol diacetate), glycols, fatty acid dimethylamides, fatty acids and fatty acid esters. In principle, solvent mixtures may also be used.

Examples of suitable carriers are ground natural minerals (for example kaolins, clays,
15 talc, chalk) and ground synthetic minerals (for example highly disperse silica, silicates).

Suitable emulsifiers are nonionic and anionic emulsifiers (for example polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates).

20 Examples of dispersants are lignin-sulfite waste liquors and methylcellulose.

Suitable surfactants used are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl-naphthalenesulfonic acid, alkylaryl-sulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty
25 alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether,
30 tristearylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty alcohol ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropylene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

35 Substances which are suitable for the preparation of directly sprayable solutions, emulsions, pastes or oil dispersions are mineral oil fractions of medium to high boiling point, such as kerosene or diesel oil, furthermore coal tar oils and oils of vegetable or animal origin, aliphatic, cyclic and aromatic hydrocarbons, for example toluene, xylene, paraffin, tetrahydronaphthalene, alkylated naphthalenes or their derivatives, methanol,
40 ethanol, propanol, butanol, cyclohexanol, cyclohexanone, isophorone, highly polar solvents, for example dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone or water.

Also anti-freezing agents such as glycerin, ethylene glycol, propylene glycol and bactericides such as can be added to the formulation.

- 5 Suitable antifoaming agents are for example antifoaming agents based on silicon or magnesium stearate.

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

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

- 20 In general, the formulations comprise from 0.01 to 95% by weight, preferably from 0.1 to 90% by weight, of the active compound(s). In this case, the active compound(s) are employed in a purity of from 90% to 100% by weight, preferably 95% to 100% by weight (according to NMR spectrum).

- 25 The compounds of formula I can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, for example in the form of directly sprayable solutions, powders, suspensions or dispersions, emulsions, oil dispersions, pastes, dustable products, materials for spreading, or granules, by means of spraying, atomizing, dusting, spreading or pouring. The use forms depend entirely on the intended purposes; they are intended to ensure in each case the finest possible
30 distribution of the active compound(s) according to the invention.

- Aqueous use forms can be prepared from emulsion concentrates, pastes or wettable powders (sprayable powders, oil dispersions) by adding water. To prepare emulsions, pastes or oil dispersions, the substances, as such or dissolved in an oil or solvent, can
35 be homogenized in water by means of a wetter, tackifier, dispersant or emulsifier. However, it is also possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

- 40 The active compound concentrations in the ready-to-use preparations can be varied within relatively wide ranges. In general, they are from 0.0001 to 10%, preferably from 0.01 to 1% per weight.

61

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

5

The following are examples of formulations: 1. Products for dilution with water for foliar applications. For seed treatment purposes, such products may be applied to the seed diluted or undiluted.

10 A) Water-soluble concentrates (SL, LS)

10 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 90 parts by weight of water or a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active compound(s) dissolves upon dilution with water, whereby a formulation with 10 % (w/w) of active compound(s) is obtained.

15

B) Dispersible concentrates (DC)

20 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 75 parts by weight of cyclohexanone with addition of 10 parts by weight of a dispersant, for example polyvinylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion, whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound(s) is obtained.

20

C) Emulsifiable concentrates (EC)

15 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 75 parts by weight of xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5 parts by weight). Dilution with water gives an emulsion, whereby a formulation with 15% (w/w) of active compound(s) is obtained.

25

D) Emulsions (EW, EO, ES)

40 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 35 parts by weight of xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in each case 5 parts by weight). This mixture is introduced into 30 parts by weight of water by means of an emulsifier machine (e.g. Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion, whereby a formulation with 25% (w/w) of active compound(s) is obtained.

35

E) Suspensions (SC, OD, FS)

In an agitated ball mill, 20 parts by weight of the active compound(s) are comminuted with addition of 10 parts by weight of dispersants, wetters and 70 parts by weight of water or of an organic solvent to give a fine active compound(s) suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound(s), whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound(s) is obtained.

40

62

- F) Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG, SG)
50 parts by weight of the active compound(s) are ground finely with addition of 50 parts by weight of dispersants and wetters and made as water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound(s), whereby a formulation with 50% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- G) Water-dispersible powders and water-soluble powders (WP, SP, SS, WS)
75 parts by weight of the active compound(s) are ground in a rotor-stator mill with addition of 25 parts by weight of dispersants, wetters and silica gel. Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active compound(s), whereby a formulation with 75% (w/w) of active compound(s) is obtained.
2. Products to be applied undiluted for foliar applications. For seed treatment purposes, such products may be applied to the seed diluted or undiluted.
- H) Dustable powders (DP, DS)
5 parts by weight of the active compound(s) are ground finely and mixed intimately with 95 parts by weight of finely divided kaolin. This gives a dustable product having 5% (w/w) of active compound(s)
- I) Granules (GR, FG, GG, MG)
0.5 part by weight of the active compound(s) is ground finely and associated with 95.5 parts by weight of carriers, whereby a formulation with 0.5% (w/w) of active compound(s) is obtained. Current methods are extrusion, spray-drying or the fluidized bed. This gives granules to be applied undiluted for foliar use.
- J) ULV solutions (UL, LS)
10 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 90 parts by weight of an organic solvent, for example xylene. This gives a product having 10% (w/w) of active compound(s), which is applied undiluted for foliar use.
- Various types of oils, wetters, adjuvants, herbicides, fungicides, other pesticides, or bactericides may be added to the active ingredients, if appropriate just immediately prior to use (tank mix). These agents usually are admixed with the agents according to the invention in a weight ratio of 1:10 to 10:1.
- The compounds of formula I are effective through both contact (via soil, glass, wall, bed net, carpet, plant parts or animal parts), and ingestion (bait, or plant part) and through trophallaxis and transfer.

63

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

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

- 10 The bait can be a liquid, a solid or a semisolid preparation (e.g. a gel). Solid baits can be formed into various shapes and forms suitable to the respective application e.g. granules, blocks, sticks, disks. Liquid baits can be filled into various devices to ensure proper application, e.g. open containers, spray devices, droplet sources, or evaporation sources. Gels can be based on aqueous or oily matrices and can be formulated to particular necessities in terms of stickiness, moisture retention or aging characteristics.

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

- 30 The compounds of formula I are also suitable for the protection of the seed, plant propagules and the seedlings' roots and shoots, preferably the seeds, against soil pests and also for the treatment plant seeds which tolerate the action of herbicides or fungicides or insecticides owing to breeding, including genetic engineering methods.

- 35 Conventional seed treatment formulations include for example flowable concentrates FS, solutions LS, powders for dry treatment DS, water dispersible powders WS or granules for slurry treatment, water soluble powders SS and emulsion ES. Application to the seeds is carried out before sowing, either directly on the seeds.

- 40 The seed treatment application of the compounds of formula I or formulations containing them is carried out by spraying or dusting the seeds before sowing of the plants and before emergence of the plants.

b4

The invention also relates to the propagation product of plants, and especially the treated seed comprising, that is, coated with and/or containing, a compound of formula I or a composition comprising it. The term "coated with and/or containing" generally signifies that the active ingredient is for the most part on the surface of the propagation product at the time of application, although a greater or lesser part of the ingredient may penetrate into the propagation product, depending on the method of application. When the said propagation product is (re)planted, it may absorb the active ingredient.

The seed comprises the inventive compounds or compositions comprising them in an amount of from 0,1 g to 10 kg per 100 kg of seed.

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

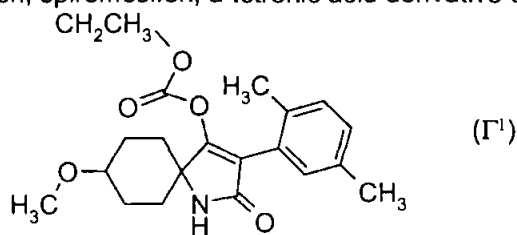
The following list of pesticides together with which the compounds according to the invention can be used, is intended to illustrate the possible combinations, but not to impose any limitation:

A.1. Organo(thio)phosphates: acephate, azamethiphos, azinphos-methyl, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorfenvinphos, diazinon, dichlorvos, dicrotophos, dimethoate, disulfoton, ethion, fenitrothion, fenthion, isoxathion, malathion, methamidophos, methidathion, methyl-parathion, mevinphos, monocrotophos, oxydemeton-methyl, paraoxon, parathion, phenthoate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phorate, phoxim, pirimiphos-methyl, profenofos, prothiofos, sulprophos, tetrachlorvinphos, terbufos, triazophos, trichlorfon;

A.2. Carbamates: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, fenoxycarb, furathiocarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamate;

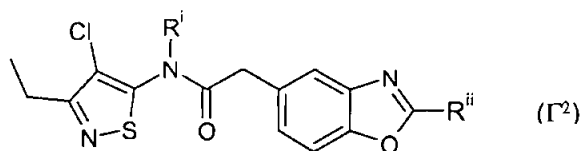
A.3. Pyrethroids: allethrin, bifenthrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cyphenothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, deltamethrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, imiprothrin, lambda-cyhalothrin, permethrin, prallethrin, pyrethrin I and II, resmethrin, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin;

- A.4. Growth regulators: a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas: chlorfluazuron, cyramazin, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazole, clofentazine; b) ecdysone antagonists: halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide, azadirachtin; c) juvenoids: pyriproxyfen, methoprene, fenoxycarb; d) lipid biosynthesis inhibitors: spiroticlofen, spiromesifen, a tetroneic acid derivative of formula Γ^1 ,

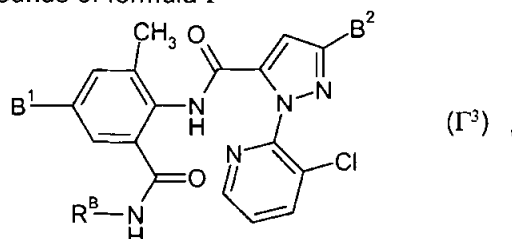


- A.5. Nicotinic receptor agonists/antagonists compounds: clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, thiamethoxam, nitenpyram, acetamiprid, thiachloprid;
- A.6. GABA antagonist compounds: acetoprole, endosulfan, ethiprole, fipronil, vaniliprole;
- A.7. Macrocyclic lactone insecticides: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad;
- A.8. METI I acaricides: fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad;
- A.9. METI II and III compounds: acequinocyl, fluacyprim, hydramethylnon;
- A.10. Uncoupler compounds: chlorfenapyr;
- A.11. Oxidative phosphorylation inhibitor compounds: cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxide, propargite;
- A.12. Moulting disruptor compounds: cryomazine;
- A.13. Mixed Function Oxidase inhibitor compounds: piperonyl butoxide;
- A.14. Sodium channel blocker compounds: indoxacarb, metaflumizone;
- A.15. Various: benclothiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''cyclo-propanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone, wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl, and the aminoisothiazole compounds of formula Γ^2 ,

50



wherein Rⁱ is -CH₂OCH₂CH₃ or H and Rⁱⁱ is CF₂CF₂CF₃ or CH₂CH(CH₃)₃,
anthranilamide compounds of formula I³



- 5 wherein B¹ is hydrogen, chlorine or cyano, B² is a bromine atom or CF₃, and R^B is H, CH₃ or CH(CH₃)₂.

Some of the mixtures of compounds I with the above pesticides exhibit a synergistic
pesticidal effect.

10

The insects may be controlled by contacting the target parasite/pest, its food supply, habitat, breeding ground or its locus with a pesticidally effective amount of compounds of or compositions of formula I.

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

- In general, "pesticidally effective amount" means the amount of active ingredient needed to achieve an observable effect on growth, including the effects of necrosis,
20 death, retardation, prevention, and removal, destruction, or otherwise diminishing the occurrence and activity of the target organism. The pesticidally effective amount can vary for the various compounds/compositions used in the invention. A pesticidally effective amount of the compositions will also vary according to the prevailing conditions such as desired pesticidal effect and duration, weather, target species,
25 locus, mode of application, and the like.

The compounds or compositions of the invention can also be applied preventively to places at which occurrence of the pests is expected.

- 30 The compounds of formula I may also be used to protect growing plants from attack or infestation by pests by contacting the plant with a pesticidally effective amount of compounds of formula I. As such, "contacting" includes both direct contact (applying the compounds/compositions directly on the pest and/or plant - typically to the foliage,

67

stem or roots of the plant) and indirect contact (applying the compounds/compositions to the locus of the pest and/or plant).

- 5 In the case of soil treatment or of application to the pests dwelling place or nest, the quantity of active ingredient ranges from 0.0001 to 500 g per 100 m², preferably from 0.001 to 20 g per 100 m².

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

- 15 For use in treating crop plants, the rate of application of the active ingredients of this invention may be in the range of 0.1 g to 4000 g per hectare, desirably from 25 g to 600 g per hectare, more desirably from 50 g to 500 g per hectare.

- 20 Compounds of formula I and compositions comprising them can also be used for controlling and preventing infestations and infections in animals including warm-blooded animals (including humans) and fish. They are for example suitable for controlling and preventing infestations and infections in mammals such as cattle, sheep, swine, camels, deer, horses, pigs, poultry, rabbits, goats, dogs and cats, water buffalo, donkeys, fallow deer and reindeer, and also in fur-bearing animals such as mink, chinchilla and raccoon, birds such as hens, geese, turkeys and ducks and fish
25 such as fresh- and salt-water fish such as trout, carp and eels.

- 30 Infestations in warm-blooded animals and fish include, but are not limited to, lice, biting lice, ticks, nasal bots, keds, biting flies, muscoid flies, flies, myiasitic fly larvae, chiggers, gnats, mosquitoes and fleas.

- 35 The compounds of formula I and compositions comprising them are suitable for systemic and/or non-systemic control of ecto- and/or endoparasites. They are active against all or some stages of development.

- Administration can be carried out both prophylactically and therapeutically. Administration of the active compounds is carried out directly or in the form of suitable preparations, orally, topically/dermally or parenterally.

- 40 For oral administration to warm-blooded animals, the formula I compounds may be formulated as animal feeds, animal feed premixes, animal feed concentrates, pills, solutions, pastes, suspensions, drenches, gels, tablets, boluses and capsules. In addition, the formula I compounds may be administered to the animals in their drinking

water. For oral administration, the dosage form chosen should provide the animal with 0.01 mg/kg to 100 mg/kg of animal body weight per day of the formula I compound, preferably with 0.5 mg/kg to 100 mg/kg of animal body weight per day.

- 5 Alternatively, the formula I compounds may be administered to animals parenterally, for example, by intraruminal, intramuscular, intravenous or subcutaneous injection. The formula I compounds may be dispersed or dissolved in a physiologically acceptable carrier for subcutaneous injection. Alternatively, the formula I compounds may be formulated into an implant for subcutaneous administration. In addition the formula I
- 10 compound may be transdermally administered to animals. For parenteral administration, the dosage form chosen should provide the animal with 0.01 mg/kg to 100 mg/kg of animal body weight per day of the formula I compound.

- 15 The formula I compounds may also be applied topically to the animals in the form of dips, dusts, powders, collars, medallions, sprays, shampoos, spot-on and pour-on formulations and in ointments or oil-in-water or water-in-oil emulsions. For topical application, dips and sprays usually contain 0.5 ppm to 5,000 ppm and preferably 1 ppm to 3,000 ppm of the formula I compound. In addition, the formula I compounds may be formulated as ear tags for animals, particularly quadrupeds such as cattle and
- 20 sheep.

Suitable preparations are:

- 25 - Solutions such as oral solutions, concentrates for oral administration after dilution, solutions for use on the skin or in body cavities, pouring-on formulations, gels;
- Emulsions and suspensions for oral or dermal administration; semi-solid preparations;
- Formulations in which the active compound is processed in an ointment base or in an oil-in-water or water-in-oil emulsion base;
- 30 - Solid preparations such as powders, premixes or concentrates, granules, pellets, tablets, boluses, capsules; aerosols and inhalants, and active compound-containing shaped articles.

- 35 Generally it is favorable to apply solid formulations which release compounds of formula I in total amounts of 10 mg/kg to 300 mg/kg, preferably 20 mg/kg to 200 mg/kg. The active compounds can also be used as a mixture with synergists or with other active compounds which act against pathogenic endo- and ectoparasites.

- 40 In general, the compounds of formula I are applied in parasitically effective amount meaning the amount of active ingredient needed to achieve an observable effect on growth, including the effects of necrosis, death, retardation, prevention, and removal, destruction, or otherwise diminishing the occurrence and activity of the target

organism. The parasitically effective amount can vary for the various compounds/compositions used in the invention. A parasitically effective amount of the compositions will also vary according to the prevailing conditions such as desired parasitidal effect and duration, target species, mode of application, and the like.

5

Synthesis Examples

With due modification of the starting compounds, the protocols shown in the synthesis examples below were used for obtaining further compounds I. The resulting
10 compounds, together with physical data, are listed in the Table I which follows.

The products were characterized by coupled High Performance Liquid Chromatography / mass spectrometry (HPLC/MS), by NMR or by their melting points.

15 HPLC method 1: Analytical HPLC column: RP-18 column Chromolith Speed ROD from Merck KGaA, Germany). Elution: acetonitrile + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA) / water + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA) in a ratio of from 5:95 to 95:5 in 5 minutes at 40 °C.
MS: Quadrupole electrospray ionisation, 80 V (positive mode)

20 HPLC method 2: Analytical HPLC column: Zorbax Rapid Resolution Cartridge S-C18 (2.1 x 30mm, 3.5 micron). Elution: acetonitrile / water + 0.02% trifluoroacetic acid in a ratio of from 15:85 to 97:3 in 7 min at 40° C.
MS: Quadrupole electrospray ionisation, 80 V (positive mode)

25 The conditions for preparative HPLC were as follows: Purospher Star RP18e Hibar RT 75-25 column (3 µm), elution: acetonitrile + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA) / water + 0.1% trifluoroacetic acid (TFA) in a ratio of from 20:80 to 100:0 in 13 minutes, detection by UV at 205 nm, 214 nm, 254 nm, 280 nm and 400 nm or by MS.

30 Example 1, compound I-1: Preparation of 2-(3,4-dichloro-benzyl)-2-trifluoromethylsulfanylmethyl-malononitrile

To 113 mg (0.5 mmol) of 3,4-dichlorobenzylmalonodinitrile and 138 mg (1.0 mmol) of potassium carbonate in 1 mL of dimethylformamide in an 8 mL vial was added 53 µl
35 (75 mg, 0.5 mmol) of trifluoromethylthiomethyl chloride. The mixture was shaken at about 20 to 25°C for 12 hours and then poured into a mixture of diethylether and water. The aqueous layer was separated and extracted twice more with diethylether (2 x 20 ml). The combined ether fractions were dried using phase separating paper and then concentrated by rotoevaporation. The residue was purified by preparative HPLC to give
40 79 mg (0.23 mmol, 46% yield) of I-1.

70

Example 2, compound I-7: Preparation of 2-(3,4-Dichloro-benzyl)-2-(2-trifluoromethylsulfanyl-ethyl)-malononitrile

To 107 μ l (146 mg, 1 mmol) of trifluoromethylthioethanol in an 8 mL vial fitted with a septum and needle outlet was added 76 μ l (208 mg, 1 mmol) of thionyl bromide. The mixture was heated at about 60°C for 20 min, and was then transferred to a second vial containing 113 mg (0.5 mmol) of 3,4-dichlorobenzylmalonodinitrile and 276 mg (2 mmol) of potassium carbonate in 0.5 mL of dimethylformamide at about 20 to 25°C. After 10 hours shaking, the contents of the vial were poured into diethylether and water. The aqueous layer was separated and extracted twice more with diethylether. The combined ether fractions were dried using phase separating paper and then concentrated by rotoevaporation. The residue was purified by preparative HPLC to give 70 mg (0.2 mmol, 40% yield) of compound I-7.

Example 3, compounds I-15 and compounds I-19. Preparation of 2-(3,4-Dichloro-benzyl)-2-(2-trifluoromethanesulfinyl-ethyl)-malononitrile (I-15) and 2-(3,4-Dichloro-benzyl)-2-(2-trifluoromethanesulfonyl-ethyl)-malononitrile (I-19)

Synthesis of trifluoromethylsulfinylethyl p-toluenesulfonate

To 1.46 gm (10 mmol) of trifluoromethylthioethanol and 1.4 mL (1.0 mg, 10 mmol) of triethylamine in 30 mL of dichloromethane at 0°C was added 1.9 mg (10 mmol) of p-toluenesulfonyl chloride. The reaction was then stirred at 20 to 25°C for 22 hours. The reaction mixture was washed twice with brine solution, and the organic layer was dried using phase separating paper. Removal of solvent by rotoevaporation and purification of the crude product by flash column chromatography on silica gel gave 1.91 mg (6.36 mmol, 64% yield) of trifluoromethylthioethyl p-toluenesulfonate.

To 600 mg (2.0 mmol) of trifluoromethylthioethyl p-toluenesulfonate in 10 mL of dichloromethane at 20 to 25°C was added 493 mg (2.2 mmol of peracid) of 77% m-chloroperbenzoic acid. After stirring for about 12 hours, the mixture was washed with aqueous sodium sulfite, aqueous sodium bicarbonate, and the organic layer was dried using phase separating paper. Removal of solvent by rotoevaporation gave 630 mg (2.0 mmol, 100% yield) of trifluoromethylsulfinylethyl p-toluenesulfonate.

Example 3.1, compound I-15

To 117mg (0.52 mmol) of 3,4-dichlorobenzylmalonodinitrile and 79 mg (0.57 mmol) of potassium carbonate in 1 mL of DMF was added 165 mg (0.52 mmol) of trifluoromethylsulfinylethyl p-toluenesulfonate. The mixture was shaken for 12 hours at 35°C. After 21 hours, the reaction mixture was added to diethylether and water

containing 50 μ L of formic acid. The aqueous phase was separated and washed twice with diethylether. The combined ether fractions were washed with brine and dried using phase separating paper. The solvent was removed by rotoevaporation, and the residue was dissolved in 1 mL of dichloromethane and filtered using dichloromethane (3 x 3 mL) through a short column of silica gel. After concentration of the eluate, 87 mg (0.24 mmol, 46% yield) of I-15 was recovered as a tan solid, mp 122.5-129.5°C. The compound could be recrystallized from acetonitrile/hexane.

Example 3.2, compound I-19

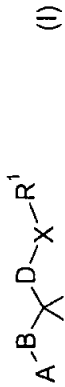
10

To approximately 92 mg (0.25 mmol) of compound I-15 in 2 mL of dichloromethane was added 200 mg (0.9 mmol of peracid) of 77% m-chloroperbenzoic acid. After stirring for 12 hours, the reaction mixture was diluted with dichloromethane and washed with aqueous sodium sulfite, aqueous sodium bicarbonate. The organic layer was dried using phase separating paper. Removal of solvent by rotoevaporation and purification of the residue by preparative HPLC gave 75 mg (0.19 mmol, 76% yield) of I-19, mp. 164-169°C.

15

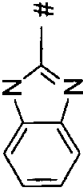
22

Table I

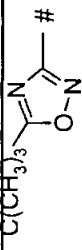
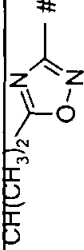
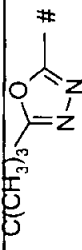
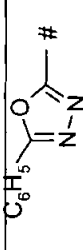
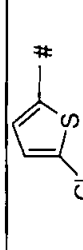
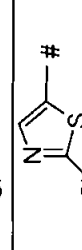
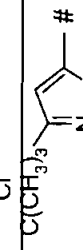


No.	A	B	D	X	R ¹	Physical data mp. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺ ¹⁾
I-1	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.61 min, m/z = 339 [M+H] ⁺
I-2	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.50 min, m/z = 339 [M+H] ⁺
I-3	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.61 min, m/z = 355 [M+H] ⁺
I-4	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.29 min, m/z = 305 [M+H] ⁺
I-5	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.65 min, ²⁾
I-6	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.66 min, m/z = 319 [M+H] ⁺ ²⁾
I-7	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.82 min, m/z = 353 [M+H] ⁺ ²⁾
I-8	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.29 min, m/z = 285 [M+H] ⁺
I-9	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	81-82°C
I-10	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.80 min, m/z = 369 [M+H] ⁺
I-11	4-SCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	40-44°C
I-12	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.77 min, m/z = 411 [M+H] ⁺
I-13	2,4,6-F ₃ -C ₆ H ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	88-96°C

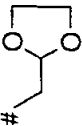
73

No.	A	B	D	X	R ¹	Physical data mp. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-14	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	122-129°C
I-15	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 5.06 min, m/z = 369 [M+H] ⁺
I-16	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.07 min, m/z = 335 [M+H] ⁺
I-17	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.18 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-18	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 5.07 min, m/z = 385 [M+H] ⁺
I-19	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.44 min, m/z = 385 [M+H] ⁺
I-20	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.47 min, m/z = 401 [M+H] ⁺
I-21	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.17 min, m/z = 300 [M+H] ⁺
I-22	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 4.76 min, m/z = 371 [M+H] ⁺
I-23	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.95 min, m/z = 427 [M+H] ⁺
I-24	4-Br-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.66 min, m/z = 363 [M+H] ⁺
I-25	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 6.30 min, m/z = 341 [M+H] ⁺
I-26	4-CF(CF ₃) ₂ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 6.31 min, m/z = 453 [M+H] ⁺
I-27	2,6-Cl ₂ -pyrid-4-yl	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.32 min, m/z = 354 [M+H] ⁺
I-28		-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.89 min, m/z = 325 [M+H] ⁺

72

No.	A	B	D	X	R ¹	Physical data mp. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-29		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.35 min, m/z = 333 [M+H] ⁺
I-30		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.03 min, m/z = 319 [M+H] ⁺
I-31		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 4.73 min, m/z = 333 [M+H] ⁺
I-32		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 4.89 min, m/z = 353 [M+H] ⁺
I-33		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 3.64 min ²⁾
I-34		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 3.28 min, m/z = 326[M+H] ⁺ ²⁾
I-35		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.34 min, m/z = 332 [M+H] ⁺
I-36	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	62-63°C
I-37	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	RT = 4.92 min, m/z = 299 [M+H] ⁺
I-38	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	RT = 4.77 min, m/z = 283 [M+H] ⁺
I-39	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.57 min, m/z = 311 [M+H] ⁺

78

No.	A	B	D	X	R ¹	Physical data mp. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-40	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.51 min, m/z = 328 [M+H] ⁺
I-41	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.35 min, m/z = 311 [M+H] ⁺
I-42	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.17 min, m/z = 317 [M+H] ⁺
I-43	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.46 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-44	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.34 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-45	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	#	O		RT = 4.43 min, m/z = 277 [M+H] ⁺
I-46	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -			RT = 4.57 min, m/z = 235 [M+H] ⁺

¹⁾ unless otherwise specified, HPLC method 2 was used.
²⁾ HPLC method 1 was used.
denotes the binding site.

HE

Examples for the action against harmful pests:

1. Activity against Boll weevil (*Anthonomus grandis*)

- 5 The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. 10 to 15 eggs were placed into microtiterplates filled with 2% agar-agar in water and 300 ppm formaline. The eggs were sprayed with 20 µl of the test solution, the plates were sealed with pierced foils and kept at 24-26°C and 75-85% humidity with a day/night cycle for 3 to 5 days. Mortality was assessed on the basis of the remaining unhatched eggs or larvae
- 10 on the agar surface and/or quantity and depth of the digging channels caused by the hatched larvae. Tests were replicated 2 times.

In this test, compounds I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-29, I-31, I-32, I-33, I-34, and I-43 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of

15 untreated controls.

2. Activity against Mediterranean fruitfly (*Ceratitis capitata*)

- 20 The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. 50 to 80 eggs were placed into microtiterplates filled with 0.5% agar-agar and 14 % diet in water. The eggs were sprayed with 5 µl of the test solution, the plates were sealed with pierced foils and kept at 27-29°C and 75-85% humidity under fluorescent light for 6 days. Mortality was assessed on the basis of the agility of the hatched larvae. Tests were replicated 2
- 25 times.

In this test, compounds I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-29, I-30, I-31, I-33, and I-34 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

30

3. Activity against Tobacco budworm (*Heliothis virescens*)

- The active compounds are formulated in 1:3 DMSO : water. 15 to 25 eggs are placed into microtiterplates filled with diet. The eggs are sprayed with 10 µl of the test solution,
- 35 the plates are sealed with pierced foils and kept at 27-29°C and 75-85% humidity under fluorescent light for 6 days. Mortality is assessed on the basis of the agility and of comparative feeding of the hatched larvae. Tests are replicated 2 times.

4. Activity against Vetch aphid (*Megoura viciae*)

- 40 The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. Bean leaf disks were placed into microtiterplates filled with 0.8% agar-agar and 2.5 ppm OPUS™. The leaf

disks were sprayed with 2.5 µl of the test solution and 5 to 8 adult aphids were placed into the microtiterplates which were then closed and kept at 22-24°C and 35-45% under fluorescent light for 6 days. Mortality was assessed on the basis of vital, reproduced aphids. Tests were replicated 2 times.

5

In this test, compounds I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-16, I-21, I-24, I-27, I-29, I-31, I-37, and I-42 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

10 5. Activity against Wheat aphid (*Rhopalosiphum padi*)

The active compounds are formulated in 1:3 DMSO : water. Barley leaf disk are placed into microtiterplates filled with 0.8% agar-agar and 2.5 ppm OPUS™. The leaf disks are sprayed with 2.5 µl of the test solution and 3 to 8 adult aphids are placed into the microtiterplates which are then closed and kept at 22-24°C and 35-45% humidity under fluorescent light for 5 days. Mortality is assessed on the basis of vital aphids. Tests are replicated 2 times.

20 6. Activity against Cotton aphid (*Aphis gossypii*)

The active compounds are formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic™ surfactant.

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

30 7. Activity against Southern armyworm (*Spodoptera eridania*), 2nd instar larvae

The active compounds are formulated for testing the activity against insects and arachnids as a 10.000 ppm solution in a mixture of 35% acetone and water, which is diluted with water, if needed.

35

A Sieva lima bean leaf is dipped in the test solution and allowed to dry. The leaf is then placed in a petri dish containing a filter paper on the bottom and ten 2nd instar caterpillars. At 5 days, observations are made of mortality and reduced feeding.

40 8. Activity against Argentine ant (*Linepithema humile*), harvester ant (*Pogonomyrmex californicus*), acrobat ant (*Crematogaster* spp.), carpenter ant (*Camponotus floridanus*), fire ant (*Solenopsis invicta*), house fly (*Musca domestica*), stable fly (*Stomoxys*

calcitrans), flesh fly (*Sarcophaga* sp.), yellowfever mosquito (*Aedes aegyptii*), house mosquito (*Culex quinquefasciatus*), malaria mosquito (*Anopheles albimanus*), German cockroach (*Blattella Germanica*), cat flea (*Ctenocephalides felis*), and brown dog tick (*Rhipicephalus sanguineus*) via glass contact

5

Glass vials are treated with 0.5 ml of a solution of active ingredient in acetone and allowed to dry. Insects or ticks are placed into each vial together with some food and moisture supply. The vials are kept at 22 °C and are observed for treatment effects at various time intervals.

10

9. Activity against yellowfever mosquito (*Aedes aegyptii*), house mosquito (*Culex quinquefasciatus*) and malaria mosquito (*Anopheles albimanus*) larvae via water treatment

15

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

20

10. Activity against brown planthopper (*nilaparvata lugens*)

25

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water. Potted rice seedlings were sprayed with 10 ml test solution, air dried, placed in cages and inoculated with 10 adults. Percent mortality was recorded after 24, 72 and 120 hours.

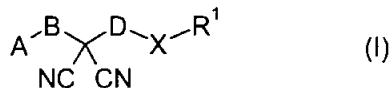
In this test, compound I-35 at 300 ppm showed over 90% mortality.

30

709

Claims:

1. Compounds of formula I



5 wherein

X is oxygen or S(=O)_n;

n is 0, 1 or 2;

10

R¹ is C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl,

15

phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring is bonded to the X atom via a carbon atom of the ring, and which phenyl or which heteraromatic ring may be bonded via a C₁-C₁₀-alkyl group thus forming an aryl-C₁-C₁₀-alkyl or hetaryl-C₁-C₁₀-alkyl moiety,

20

wherein phenyl or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

25

wherein the hydrogen atoms in the above groups R¹ may be partially or in total be replaced by any combination of groups R⁵.

30

A is -NR^b₂, -C(=G)GR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=NOR^b)R^b, C(=G)[N=SR^b₂], -C(=G)NR^b-NR^b₂, wherein two groups R^b together may form a C₂-C₆-alkandiyl, C₂-C₆-alkenediyl or C₁-C₃-alkyl-G-C₁-C₃-alkyl bridge which may be substituted by 1 to 5 groups R²,

35

phenyl or a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

40

wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3

80

heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

wherein phenyl or the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or substituted by any combination of 1 to 6 groups R².

B is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 3 carbon chain atoms, wherein the hydrogen atoms of this chain may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R³;

D is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 5 carbon chain atoms or C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the hydrogen atoms of this chain or of this cycloalkyl may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R⁴;

R² is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, C₃-C₆-halocycloalkyloxy, C₃-C₆-halocycloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₃-C₆-cycloalkylthio, C₃-C₆-halocycloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₃-C₆-alkynylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfinyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₃-C₆-alkynylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfonyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkynylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₂-C₆-alkenyl)amino, di(C₂-C₆-alkynyl)amino, tri(C₁-C₁₀)alkylsilyl, or

phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl and which heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom or a C₁-C₄-alkyl-group,

wherein the above groups R² are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a, or

81

- 5 R^2 is $-C(=G)R^b$, $-C(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^{b_2}$, $-C(=G)[N=SR^{b_2}]$, $-C(=NOR^b)R^b$, $-C(=NOR^b)NR^{b_2}$, $-C(=NNR^{b_2})R^b$, $-OC(=G)-OC(=G)OR^b$, $N=SR^{b_2}$, $-NR^bC(=G)R^b$, $-N[C(=G)R^b]_2$, $-NR^bC(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^b-NR^{b_2}$, $-C(=G)NR^b-NR^b[C(=G)R^b]$, $-NR^b-C(=G)NR^{b_2}$, $-NR^b-NR^bC(=G)R^b$, $-NR^b-N[C(=G)R^b]_2$, $-N[(C=G)R^b]-NR^{b_2}$, $-NR^b-NR^b[(C=G)GR^b]$, $-NR^b[(C=G)NR^{b_2}]$, $-NR^b[C(=NR^b)R^b]$, $-NR^b(C=NR^b)NR^{b_2}$, $-O-NR^{b_2}$, $-O-NR^b(C=G)R^b$, $-SO_2NR^{b_2}$, $-NR^bSO_2R^b$, $-S(=O)R^b$, $-S(=O)_2R^b$, $-SO_2OR^b$, or $-OSO_2R^b$;
- 10 R^3 is halogen, cyano, amino, C_1 - C_{10} -alkyl, C_1 - C_{10} -haloalkyl, C_2 - C_{10} -alkenyl, C_2 - C_{10} -haloalkenyl, C_2 - C_{10} -alkynyl, C_3 - C_{10} -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, or
- 15 phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl or which heterocyclic or
- 20 heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom, or
- 25 2 groups R^3 together with the carbon atom of the hydrocarbon chain may form a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen,
- 30 wherein the above groups R^3 are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a , or
- 35 R^4 is halogen, cyano, amino, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_3 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_3 - C_6 -haloalkynyloxy, C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkenyloxycarbonyl, C_1 - C_6 -alkylamino, $di(C_1$ - C_6 -alkyl)amino, $tri(C_1$ - $C_{10})$ alkylsilyl, or
- 40 phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from

oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl and which heterocyclic or heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom,

5

wherein the above groups R^4 are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a , or

10

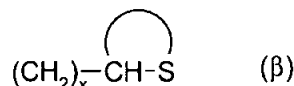
the moiety R^4 -D-X- R^1 together may form a saturated or unsaturated ring of formula α



15

which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a , or

the moiety R^4 -D-X- R^1 together may form a group of formula β wherein x is 1 to 5,



20

containing a saturated or unsaturated ring which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a ;

25

R^5 is a group R^3 ;

G is oxygen or sulfur;

30

R^a is each independently halogen, cyano, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, phenoxy, OR^i , SR^i , $S(=O)R^i$, $S(=O)_2R^i$, NR^iR^i , $-S(=O)_2NR^iR^i$, $C(=O)R^i$, $C(=O)OR^i$, $C(=O)NR^iR^i$, $C(=NOR^i)R^i$, $-NR^iC(=G)R^i$, $-N[C(=G)R^i]_2$, $-NR^iC(=G)OR^i$, $-C(=G)NR^i-NR^i_2$, $-NR^iSO_2R^i$, $SiR^i_yR^{i_{3-y}}$ (y is 0 to 3), or

35

phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

40

wherein the carbon atoms in phenyl or in the heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 5 halogens;

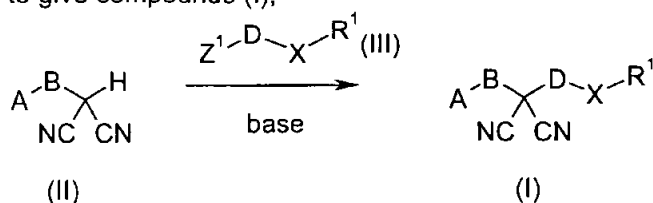
5 R^i , R^i are each independently hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, or C_3 - C_6 -halocycloalkenyl;

10 R^b is each independently C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_8 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_8 -halocycloalkenyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, or C_3 - C_6 -halocycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, or

15 phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring may be bound via a C_1 - C_4 -alkyl-moiety, and wherein the carbon atoms in phenyl or in the
20 heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 3 groups R^a ;

or the enantiomers or diastereomers or salts or N-oxides or polymorphs thereof.

- 25 2. Compounds of formula I according to claim 1 wherein X is oxygen or sulfur.
3. Compounds of formula I according to claims 1 or 2 wherein D is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with 2 to 4 carbon chain atoms.
- 30 4. A process for the preparation of compounds of formula I as defined in claims 1 to 3 which comprises reacting compounds (II) with compound (III) in the presence of a base to give compounds (I),

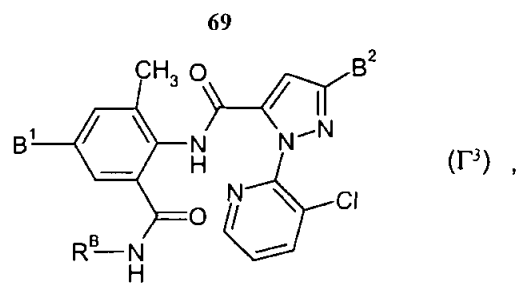


35 wherein A, B, D, X and R^1 are as defined in claims 1 to 3 for compounds of formula I and Z^1 represents a suitable leaving group.

5. Use of compounds of formula I as defined in claims 1 to 3 for combating insects, acarids, or nematodes.

6. A method for the control of insects, acarids or nematodes by contacting the insect, acarid or nematode or their food supply, habitat, breeding ground or their locus with a pesticidally effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 3.
7. A method of protecting growing plants from attack or infestation by insects, acarids or nematodes by applying to the plants, or to the soil or water in which they are growing, a pesticidally effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 3.
8. A method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasitically effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 3 or their enantiomers or veterinarily acceptable salts.
9. A process for the preparation of a composition for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises a parasitically effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 3 or their enantiomers or veterinarily acceptable salts.
10. Compositions comprising a pesticidally or parasitically active amount of compounds of formula I as defined in claims 1 to 3 and an agronomically or veterinarily acceptable carrier.
11. Synergistic mixtures comprising a compound of formula I and a pesticide selected from the organo(thio)phosphates, carbamates, pyrethroids, growth regulators, neonicotinoids, nicotinic receptor agonists/antagonists compounds, GABA antagonist compounds, macrocyclic lactone insecticides, METI I acaricides, METI II and III compounds, oxidative phosphorylation inhibitor compounds, moulting disruptor compounds, mixed function oxidase inhibitor compound, sodium channel blocker compounds, benclothiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''cyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone, wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl, and anthranilamide compounds of formula I³

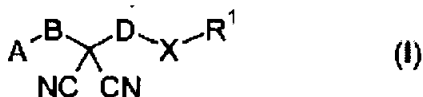
85



wherein B¹ is hydrogen, chlorine or cyano, B² is a bromine atom or CF₃, and R^B is H, CH₃ or CH(CH₃)₂.

COMPUESTOS DE MALONITRILO

La presente invención se relaciona con los compuestos de la fórmula I



en donde

X es oxígeno o S(=O)_n;

10 n es 0,1 o 2;

R¹ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆,

15

fenilo o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático está unido al átomo X por vía de un átomo de carbono del anillo, y cuyo anillo fenilo o heteroaromático puede estar unido por vía de un grupo

20

alquilo C₁-C₁₀ así formando una porción aril-alquilo C₁-C₁₀ o hetaril-alquilo C₁-C₁₀,

en donde fenilo o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos

25

seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

en donde los átomos de hidrógeno en los anteriores grupos R^1 pueden ser parcialmente o totalmente reemplazados por cualquier combinación de los grupos R^5 .

- 5 A es $-NR^b_2$, $-C(=G)GR^b$, $-C(=G)NR^b_2$, $-C(=NOR^b)R^b$, $C(=G)[N=SR^b_2]$, $-C(=G)NR^b-NR^b_2$, en donde dos grupos R^b juntos pueden formar un alcandiilo C_2-C_3 , alquenediilo C_2-C_3 o alquilo C_1-C_3 -G-alquilo C_1-C_3 de puente que se puede sustituir por 1 a 5 grupos R^2 ,
- 10 fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7- miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,
- 15 en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionado de oxígeno, nitrógeno y azufre,
- 20 en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden sustituir o no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

- B es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 3
- 25 átomos en la cadena carbono, en donde los átomos de hidrógeno de esta cadena pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^3 ;

D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 5 átomos en la cadena carbono o cicloalquilo C₃-C₆, en donde los átomos de hidrógeno de esta cadena o de este cicloalquilo pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R⁴;

R² es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, alquiniloxilo C₃-C₆, haloalcoxilo C₁-C₆, haloalqueniloxilo C₂-C₆, haloalquiniloxilo C₃-C₆, cicloalquiloxilo C₃-C₆, cicloalqueniloxilo C₃-C₆, halocicloalquiloxilo C₃-C₆, halocicloalqueniloxilo C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, halocicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquenilsulfinilo C₂-C₆, alquinilsulfinilo C₃-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquenilsulfinilo C₂-C₆, haloalquinilsulfinilo C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquenilsulfonilo C₂-C₆, alquinilsulfonilo C₃-C₆, haloalquinilsulfonilo C₁-C₆, haloalquenilsulfonilo C₂-C₆, haloalquinilsulfonilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, alquenilamino C₂-C₆, alquinilamino C₂-C₆, di(alquil C₁-C₆)amino, di(alquenil C₂-C₆)amino, di(alquinil C₂-C₆)amino, tri(C₁-C₁₀)alquilsililo, o

20

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre o un grupo alquilo C₁-C₄,

25

en donde los grupos anteriores R^2 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

- 5 R^2 es $-C(=G)R^b$, $-C(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^b_2$, $-C(=G)[N=SR^b_2]$, $-C(=NOR^b)R^b$, $-C(=NOR^b)NR^b_2$, $-C(=NNR^b_2)R^b$, $-OC(=G)-OC(=G)OR^b$, $N=SR^b_2$, $-NR^bC(=G)R^b$, $-N[C(=G)R^b]_2$, $-NR^bC(=G)OR^b$, $-C(=G)NR^b-NR^b_2$, $-C(=G)NR^b-NR^b[C(=G)R^b]$, $-NR^bC(=G)NR^b_2$, $-NR^b-NR^bC(=G)R^b$, $-NR^b-N[C(=G)R^b]_2$, $-N[(C=G)R^b]-NR^b_2$, $-NR^b-NR^b[(C=G)R^b]$, $-NR^b[(C=G)NR^b_2]$, $-NR^b[C=NR^b]R^b$, $-NR^b(C=NR^b)NR^b_2$, $-O-NR^b_2$, $-O-NR^b(C=G)R^b$, $-SO_2NR^b_2$, $-NR^bSO_2R^b$, $-S(=O)R^b$, $-S(=O)_2R^b$, $-SO_2OR^b$, o $-OSO_2R^b$;
- 10

- R^3 es halógeno, ciano, amino, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_3-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_3 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , o
- 15

- fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo fenilo o heteroaromático o heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre, o
- 20

25

2 grupos R^3 junto con el átomo de carbono de la cadena de hidrocarburo pueden formar un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7-

miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno,

en donde los grupos anteriores R^3 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

R^4 es halógeno, ciano, amino, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_3-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , alqueniloxicarbonilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , di(alquil C_1-C_6)amino, tri(C_1-C_{10})alquilsililo, o

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático o heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre,

en donde los grupos anteriores R^4 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

la porción $R^4-D-X-R^1$ juntos pueden formar un anillo saturado o insaturado de la Fórmula α

41



que puede tener un anillo de 5 a 7 miembros y además de azufre 1 a 2
5 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno y cuyo
anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos seleccionados de R^a , o

la porción R^4 -D-X- R^1 juntos pueden formar un grupo de la Fórmula β en donde x
es 1 a 5



que contiene un anillo saturado o insaturado que puede tener 5 a 7 miembros en
el anillo y además de azufre 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de
oxígeno, azufre y nitrógeno y cuyo anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos
15 seleccionados de R^a ;

R^5 es un grupo R^3 ;

G es oxígeno o azufre;

20

R^a es cada uno independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_6 , haloquilo
 C_1 - C_6 , alquenilo C_2 - C_6 , haloalquenilo C_2 - C_6 , alquinilo C_2 - C_6 , haloalquinilo C_2 - C_6 -,
cicloalquilo C_3 - C_6 , halocicloalquilo C_3 - C_8 , cicloalquenilo C_3 - C_6 -, halocicloalquenilo
 C_3 - C_8 , fenoxi, OR^i , SR^i , $S(=O)R^i$, $S(=O)_2R^i$, NR^iR^j , $-S(=O)_2NR^iR^j$, $C(=O)R^i$,
25 $C(=O)OR^i$, $C(=O)NR^iR^j$, $C(=NOR^i)R^j$, $-NR^iC(=G)R^j$, $-N[C(=G)R^i]_2$, $-NR^iC(=G)OR^j$, -

42

$C(=G)NR^i-NR^j_2$, $-NR^iSO_2R^j$, $SiR^i_yR^j_{3-y}$ (y es 0 a 3), o

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se pueden sustituir con 1 a 5 halógenos;

R^i , R^j son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_6 , o halocicloalquenilo C_3-C_6

R^b es cada uno independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , o halocicloalquilo C_3-C_8 -alquilo C_1-C_4 , o

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático se puede unir por vía una porción alquilo C_1-C_4 , y en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se puede sustituir con 1 a 3 grupos R^a ;

o los enantiómeros o diastereómeros o sales o N-óxidos o polimorfos de estos.

25

En adición, la presente invención se relaciona con procesos e intermedios para preparar Los compuestos I, composiciones pesticidas que comprenden

compuestos I, métodos para el control de insectos, ácaros o nemátodos al poner en contacto el insecto, ácaro o nemátodo o su suministro de alimento, hábitat o caldos de cultivo con una cantidad pesticidamente efectiva de los compuestos o composiciones de la Fórmula I.

5

Más aún, la presente invención también se relaciona con un método para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por insectos o ácaros al aplicar a las plantas, o al suelo o agua en el que ellas crecen, con una cantidad pesticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I.

10

Esta invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende administrar oralmente, tópicamente o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad parasiticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula

15 I.

A pesar de insecticidas comerciales, acaricidas y nematicidas disponibles actualmente, el daño a cultivos, cultivos y cosechas, originado por insectos y nemátodos aún ocurre. Por lo tanto, se necesita un desarrollo nuevo continuo y más efectivo de los agentes insecticidas, acaricidas y nematicidas.

20

Es por lo tanto un objeto de la presente invención proporcionar composiciones pesticidas nuevas, compuestos nuevos y métodos nuevos para el control de insectos, ácaros o nemátodos y de proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por insectos, arácnidos o nemátodos.

25

Se ha encontrado que estos objetivos se logran mediante las composiciones y Los

PA

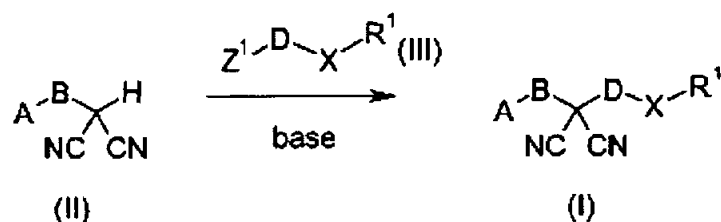
compuestos de la fórmula I. Adicionalmente, hemos encontrado procesos e intermedios para preparar Los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos exhiben una porción dicianoalquano que se ha descrito en un
5 número de solicitudes de patente: JP 2002 284608, WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 04/020399, JP 2004 99593, JP 2004 99597, WO 05/068432, WO 05/064823, EP 1555259, y WO 05/063694.

Los compuestos de la fórmula I soportan una cadena chalkogenalcano lateral que
10 no se ha descrito en la técnica anterior.

Los compuestos de la fórmula I son obtenibles, por ejemplo, mediante un proceso en donde el compuesto (II) se hace reaccionar con compuesto (III) para dar Los compuestos (I):

15



en donde A, B, D, X y R¹ son como se definió anteriormente para los compuestos de la fórmula I y Z¹ representa un grupo saliente adecuado tal como un átomo de
20 halógeno, metanosulfonato, trifluorometanosulfonato o toluenosulfonato.

La reacción se lleva a cabo generalmente en la presencia de una base en un disolvente.

25 El disolvente al ser utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, amidas ácidas

95

tales como N,N-dimetilformamida, NMP y similares, éteres tales como éter de dietilo, tetrahidrofurano y similares, sulfóxidos y sulfonas tales como dimetilsulfóxido, sulfolano y similares, hidrocarburos halogenados tales como 1,2 - dicloroetano, clorobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, y mezclas de estos.

La base por ser utilizada en la reacción incluye, por ejemplo, bases inorgánicas tales como hidruro de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y similares, alcóxidos de metal alcali tales como t-butóxido de potasio y similares, amidas de metal alcali tales como diisopropilamida de litio y similares, y bases orgánicas tales como dimetilaminopiridina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano, 1,8-diazabicyclo [5.4.0]-7-undeceno y similares.

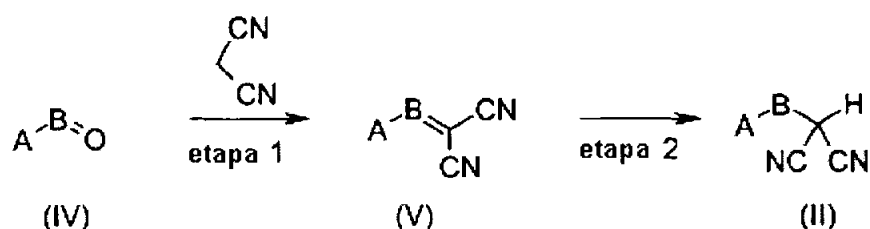
La cantidad de la base que se puede utilizar en la reacción es usualmente 1 a 10 moles relativos a 1 mol del compuesto (II). En adición, los aditivos tales como éteres corona se pueden agregar a la reacción acelerada.

La cantidad del compuesto (III) a ser utilizado en la reacción es usualmente 1 a 10 moles, preferiblemente 1 a 2 moles con relación a 1 mol del compuesto (II).

La temperatura de reacción está usualmente en el rango de -78° C a 150° C, preferiblemente en el rango de -20° C a 80° C y el tiempo de reacción está usualmente en el rango de 1 a 24 horas.

El compuesto (II) se puede producir, por ejemplo, de acuerdo con la ruta representada por el siguiente esquema:

TS



en donde las variables son como se definió anteriormente para formula I.

- 5 Etapa 1: El compuesto (V) se puede producir al hacer reaccionar el compuesto (IV) con malononitrilo ($CN(CH_2)CN$; ver por ejemplo Organic Process Research & Development 2005, 9, 133-136). La reacción se lleva a cabo generalmente en la presencia de base en un disolvente. El disolvente a ser utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, amidas ácidas tales como N,N-dimetilformamida y similares,
- 10 éteres tales como éter de dietilo, tetrahidrofurano y similares, hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, 1,2-dicloroetano, clorobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, alcoholes tales como metanol, etanol, isopropilo alcohol y similares, y mezclas de estos.
- 15 La base a ser utilizada en la reacción incluye, por ejemplo, hidróxido de tetrabutilamonio. La cantidad del la base que se puede utilizar en la reacción es usualmente 0.01 a 0.5 moles con relación a 1 mol del compuesto (IV).

La cantidad del malononitrilo a ser utilizada en la reacción es usualmente 1 a 10

20 moles con relación a 1 mol del compuesto (IV). La temperatura de reacción está usualmente en el rango de $-20^{\circ}C$ a $200^{\circ}C$, y el tiempo de reacción está usualmente en el rango de 1 a 24 horas.

La reacción se puede llevar a cabo con remoción del agua formada por la reacción

25 a partir del sistema de reacción, si es necesario.

Después de la terminación de la reacción, el compuesto de la Fórmula (V) se puede aislar al emplear métodos convencionales tal como agregar la mezcla de reacción al agua, extraer con un disolvente orgánico, concentrar el extracto y similares. El compuesto aislado (V) se puede purificar mediante una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, si es necesario.

Etapa 2: (a) cuando B se sustituye por uno o más grupos R^3 , entonces el compuesto (II) se puede producir al hacer reaccionar el compuesto (V) con un compuesto organometálico R^3-Q .

La reacción se lleva a cabo generalmente en un disolvente, y si es necesario, en la presencia de una sal de cobre.

El disolvente a ser utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, éteres tales como éter de dietilo, tetrahidrofurano y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, y mezclas de estos.

El compuesto organometálico R^3-Q a ser utilizado en la reacción incluye, por ejemplo, compuestos de organomagnesio tales como yoduro de metilmagnesio, bromuro de etilmagnesio, bromuro de isopropilmagnesio, bromuro de vinilmagnesio, bromuro de etinilmagnesio, dimetilmagnesio y similares, compuestos de organolitio tales como metillitio y similares, compuestos de organozinc tales como dietilzinc y similares, y compuestos de organocobre tales como trifluorometilcobre y similares. La cantidad del compuesto organometálico que se puede utilizar en la reacción es usualmente 1 a 10 moles con relación a 1 mol del compuesto (V).

La sal de cobre a ser utilizada en la reacción incluye, por ejemplo, yoduro de cobre (I), bromuro de cobre (I) y similares. La cantidad de la sal de cobre a ser utilizada en la reacción no es usualmente más de 1 mol con relación a 1 mol del compuesto (V). La temperatura de reacción está usualmente en el rango de -20° C a 100° C, y el tiempo de reacción está usualmente en el rango de 1 a 24 horas.

Después de la terminación de la reacción, el compuesto de la Fórmula (II) se puede aislar al emplear métodos convencionales tales como agregar la mezcla de reacción a agua, extraer con un disolvente orgánico, concentrar el extracto y similares. El compuesto aislado (II) se puede purificar mediante una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, si es necesario.

Etapa 2: (b) cuando B es no sustituido, el compuesto (II) se puede producir al hacer reaccionar el compuesto (V) con un agente de reducción tal como ácido fórmico en la presencia de una base como se describe por ejemplo en J. Org. Chem. 2005, 70, p. 3591, o con Mg en la presencia de ZnCl₂ como se describe en Synlett. 2005, p. 523-525 o cualquier otro agente de reducción adecuado.

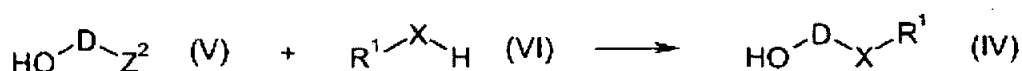
Después de la terminación de la reacción, el compuesto de la Fórmula (II) se puede aislar al emplear métodos convencionales tales como agregar la mezcla de reacción a agua, extraer con un disolvente orgánico, concentrar el extracto y similares. El compuesto aislado (II) se puede purificar mediante una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, si es necesario.

En general, los compuestos (III), si no están comercialmente disponibles, se pueden sintetizar a partir de alcoholes (IV) por vía de la conversión a los tosilatos respectivos, mesilatos o haluros en analogía con los métodos mencionados en J.

March, Advanced Organic Chemistry, 4th edición, Wiley.



- 5 Los compuestos (IV) se pueden obtener por vía de alquilación de los compuestos (V) en donde Z^2 es un grupo saliente adecuado tal como un átomo de halógeno, metanosulfonato, trifluorometanosulfonato o toluenosulfonato, con compuestos (VI) que son tioles sustituidos adecuados o alcoholes o sales de estos en analogía con los procedimientos descritos en Can. J. Chem. 1979, 57, p 1958-1966 y J. Am. Chem. Soc. 1924, 46, p, 1503.



- 15 Específicamente, los compuestos (III) en donde R^1 es CF_3 , X es azufre y Z^1 es halógeno también se puede obtener mediante reacción de $\text{CF}_3\text{-SH}$ con haluros de acrílo $\text{CH}_2\text{CH}-\text{Z}^1$ como se describe en J. Am. Chem. Soc. 1962, 84, p. 3148-3153.

- Los compuestos (IV) en donde R^1 es CF_3 y X es azufre se puede preparar por ejemplo mediante alquilación de mercapto alcoholes HO-D-SH bajo condiciones de irradiación como se describe en la WO 01/36410.

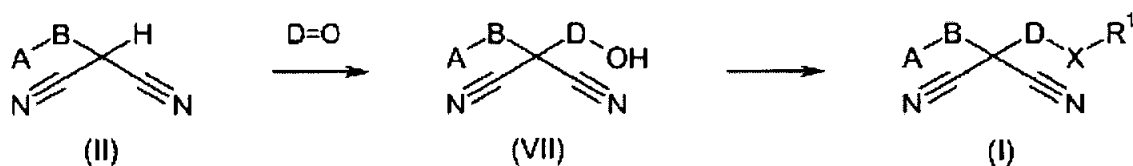
- Los compuestos (III) en donde R^1 es CF_3 y X es oxígeno se pueden obtener como se describe en J. Fluorine Chemistry 1982, 21, p. 133-143 o J. Org. Chem. 2001, 66, p. 1061-1063.

25

Los compuestos de la fórmula I en donde D es una unidad C_1 sustituida o no



sustituída, la síntesis se puede llevar a cabo mediante una reacción de adición de un dinitrilo (II) a un compuesto carbonitrilo adecuado de la Fórmula D=O en analogía con los procedimientos descritos en la US 4581178, J. Fluorine Chemistry 1982, 20, p. 397-418 y European Journal of Organic Chemistry 2004, (19), p. 3992-4002 y conversión posterior de los alcoholes obtenidos a los compuestos (I) por vía de la conversión del grupo OH de (VII) en un grupo saliente tal como un grupo mesilato y posterior reacción con un alcohol o tiol R^1-XH , X = O o S, en analogía con un procedimiento en J. Eur. Jof Org. Chem. 2004, (19), 3992-4002.



Los compuestos (I) de la invención en donde X es S y n es 1 se pueden obtener de los compuestos correspondientes (I) en donde X es S y n es 0 por vía de oxidación con agentes de oxidación tales como 30% de H_2O_2 , $NaIO_4$ o $tBuOCl$ de acuerdo con los procedimientos descritos en J. March, Advanced Organic Chemistry, 4th edición, Wiley, chapter 19, pp. 1201 y la literatura citada aquí. Adicionalmente la oxidación con, por ejemplo, $KMnO_4$, $KHSO_5$ u otro equivalente de 30% de H_2O_2 como se describe en la literatura citada anteriormente, produce los compuestos (I) en donde X es S y n es 2.

Si los compuestos I individuales no se obtienen por las rutas descritas anteriormente, ellos se pueden preparar mediante derivación de otros compuestos I o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

Después de la terminación de la reacción, los compuestos se puede aislar al

101

emplear métodos convencionales tales como agregar la mezcla de reacción al agua, extraer con un disolvente orgánico, concentrar el extracto y similares. Los compuestos aislados se puede purificar mediante una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, si es necesario.

5

La preparación de los compuestos de la fórmula I puede llevar a que ellos sean obtenidos como mezclas de isómeros. Si se desea, estos se pueden resolver mediante los métodos habituales para este propósito, tal como cristalización o cromatografía, también un adsorbato ópticamente activo, para dar los isómeros puros. Los compuestos de la fórmula I se pueden presentar en diferentes modificaciones cristalinas (polimorfas) que puede tener actividad biológica. Estos son también objeto de esta invención.

10 Sales aceptables agronómicamente de los compuestos I se pueden formar en una forma habitual, por ejemplo mediante reacción con un ácido del anión en cuestión.

En esta especificación y en las reivindicaciones, la referencia se hace con un número de términos que será definido para tener los siguientes significados:

20 "Sal" como se utiliza aquí incluye aductos de los compuestos I con ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanesulfónico, ácido metanosulfónico, y ácido succínico. Más aún, se incluyen como "sales" aquellas que pueden formar con, por ejemplo, aminas, metales, base de metales de alcalinotérreos o bases de amonio cuaternario, que incluyen iones bañolares. Los hidróxidos de metal o metal alcalinotérreo como formadores de sal incluyen las sales de bario, aluminio, níquel, cobre, manganeso, cobalto, zinc, hierro, plata, litio, sodio, potasio, magnesio o calcio. Los formadores de sal adicionales incluyen

25

cloruro, sulfato, acetato, carbonato, hidruro, e hidróxido. Las sales deseables incluyen aductos de los compuestos I con ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, y ácido metanosulfónico.

- 5 "Halógeno" se tomará que significa flúor, cloro, bromo y yodo.

El término "alquilo" como se utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo saturado ramificado o no ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono, tal como alquilo C₁-C₆, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-
10 metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-
15 metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

El término "haloalquilo" como se utiliza aquí se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos
20 grupos se pueden reemplazar por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo haloalquilo C₁-C₂, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo y
25 pentafluoroetilo;

De forma similar, "alcoxi" y "alquiltio" se refiere a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) se une a enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, o cualquier unión en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.

De forma similar, "alquilsulfinilo" y "alquilsulfonilo" se refiere a grupos alquilo de cadena recta o ramificado que tienen 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de enlaces $-S(=O)-$ o $-S(=O)_2$, respectivamente, en cualquier unión en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen metilsulfinilo y metilsulfonilo.

De forma similar, "alquilamino" se refiere a un átomo de nitrógeno que lleva 1 o 2 grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos incluyen metilamino, dimetilamino, etilamino, dietilamino, metiletilamino, isopropilamino, o metilisopropilamino.

El término "alquilcarbonilo" se refiere a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unido a través de un enlace $-C(=O)-$, respectivamente, en cualquier unión en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen acetilo y propionilo.

El término "alquenilo" como se utiliza aquí se destina a un grupo de hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tienen de 2 a 6 átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-

104

propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo; 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

El término "alquinilo" como se utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que contiene por lo menos un enlace triple, tal como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, y similares.

Cicloalquilo como se utiliza aquí se refiere a anillos de átomos de carbono saturados de 3- a 6-miembros monocíclico, por ejemplo cicloalquilo C₃-C₆ tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, o ciclohexilo.

25

Un anillo heteroaromático de 5- o 6-miembros que contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre puede ser un anillo heteroaromático

de 5-miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 2 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, preferiblemente de oxígeno y nitrógeno, tal como pirrol, pirazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiodiazol; o un anillo heteoaromático de 5-miembros que contiene 1 heteroátomo seleccionado de oxígeno y azufre, tal como furano o tiofeno; o un anillo heteoaromático de 6-miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 2 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, preferiblemente de oxígeno y nitrógeno, tal como piridina, pirazina, pirimidina, piridazina o triazina.

10

Un anillo heterocíclico aromático saturado, parcialmente insaturado de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre es por ejemplo piridina, pirimidina, (1,2,4)-oxadiazol, (1,3,4)-oxadiazol, pirrol, furano, tiofeno, oxazol, tiazol, imidazol, pirazol, isoxazol, 1,2,4-triazol, tetrazol, pirazina, piridazina, oxazolina, tiazolina, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, morfolina, piperidina, piperazina, pirrolina, pirrolidina, oxazolidina, tiazolidina. Más preferiblemente, este sistema de anillo es dioxolan, furano, oxazol, tiazol, o tetrahidrofurano.

15

20 Un anillo heteoaromático de 5- o 6-miembros que contiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre puede ser un anillo heteoaromático de 5-miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 2 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, tal como pirrol, pirazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiodiazol; o un anillo heteoaromático de 5-miembros que contiene 1 heteroátomo seleccionado de oxígeno y azufre, tal como furano o tiofeno; o un anillo heteoaromático de 6-miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 2

25

108

heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, preferiblemente de nitrógeno, tal como piridina, pirazina, pirimidina, piridazina o triazina. Cuando se fusiona a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede
5 contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, este sistema de anillo fusionado es por ejemplo pirimidotriazolilo.

Un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7-miembros que pueden contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno
10 es por ejemplo un anillo heteroaromático de 5- a 7-miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 o 1 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno y nitrógeno, tal como morfolina, piperazina, piperidina, o pirrolidina.

15 Cuando se fusiona a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, este sistema de anillo fusionado es por ejemplo indolina.

20 Fenilo que se fusiona a fenilo o un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre es por ejemplo naftalín, benzoxazolilo, benzotiazolilo, bencimidazolilo, benzoxadiazolilo, o benztiadiazolilo.

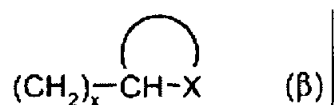
25 El anillo saturado o insaturado de la Fórmula α .

207



que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además de X 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno, por ejemplo es furanilo, tiofenilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidrotiofenilo, tetrahidrotiofenilo óxido o dióxido de tetrahidrotiofenilo.

El grupo de la Fórmula β



10

que contiene un anillo saturado o insaturado que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además de X 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno por ejemplo es -CH₂-furanilo, -CH₂-tiofenilo, -CH₂-tetrahidrofuranilo, -CH₂-tetrahidrotiofenilo, óxido de -CH₂-tetrahidrotiofenilo, dióxido de -CH₂-tetrahidrotiofenilo, -(CH₂)₂-furanilo, -(CH₂)₂-tiofenilo,, -(CH₂)₂-tetrahidrofuranilo, -(CH₂)₂-tetrahidrotiofenilo, óxido de -(CH₂)₂-tetrahidrotiofenilo, dióxido de -(CH₂)₂-tetrahidrotiofenilo. La variable x en el grupo β preferiblemente es 1 o 2.

Con respecto al uso destinado de los compuestos de la fórmula I, se da preferencia particular a los siguientes significados de los sustituyentes, en cada caso en sí mismo o en combinación. Para los precursores de los compuestos, de la invención estos sustituyentes preferidos o la combinación preferida de sustituyentes se aplica de acuerdo con lo anterior.

25

Un compuesto de la Fórmula I en donde X es oxígeno o azufre.

Un compuesto de la Fórmula I en donde X es $S(=O)_n$.

Un compuesto de la Fórmula I en donde X es azufre.

5

Un compuesto de la Fórmula I en donde X es $S(=O)$.

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^1 es alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o fenilo, preferiblemente haloalquilo C_1-C_6 .

10

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^1 es alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o fenilo, en donde estos grupos pueden ser parcialmente o completamente halogenado y/o sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados de ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 ,
15 haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_3 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , o haloalquiniloxi C_3-C_6 .

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^1 es alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o
20 fenilo, en donde estos grupos pueden ser parcialmente o completamente halogenados y/o sustituido con 1 a 3 grupos seleccionados de ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 .

Un compuesto de la Fórmula I en donde A es $-C(=G)GR^b$, o fenilo o un anillo
25 heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos

seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos
5 seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden sustituir o no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

10 Un compuesto de la Fórmula I en donde A es fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros
15 que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden sustituir o no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

20 Un compuesto de la Fórmula I en donde B es una cadena de hidrocarburo con un átomo de carbono en la cadena, preferiblemente $-CH_2-$ o $-CH(CH_3)-$.

Un compuesto de la Fórmula I en donde D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con 2 a 4 átomos en la cadena carbono o
25 ciclopropilo, preferiblemente una cadena de hidrocarburo saturada con 2 a 4 átomos en la cadena carbono.

40

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^2 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , cicloalquiloxi C_3-C_6 , cicloalqueniloxi C_3-C_6 , halocicloalquiloxi C_3-C_6 , halocicloalqueniloxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , cicloalquiltio C_3-C_6 , alquisulfonilo C_1-C_6 o haloalquisulfonilo C_1-C_6 , preferiblemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 .

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^3 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alquenilo C_2-C_{10} , haloalquenilo C_2-C_{10} , alquinilo C_2-C_{10} , haloalquinilo C_3-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_3 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_3 o haloalquiniloxi C_3-C_6 , preferiblemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_{10} , haloalquilo C_1-C_{10} , alcoxi C_1-C_6 o Haloalcoxi C_1-C_6 .

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^4 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 o haloalquiniloxi C_3-C_6 .

25

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^4 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o

()

haloalcoxi C₁-C₆.

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^a es cada uno independientemente
halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo
5 C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, ORⁱ, SR, S(=O)Rⁱ,
S(=O)₂R, NRⁱR^j, -S(=O)₂NRⁱR, C(=O)ORⁱ, C(=O)NRⁱR^j, o fenilo o un anillo
heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos
seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre.

10 Un compuesto de la Fórmula I en donde R^a es cada uno independientemente
halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo
C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆ o alcoxi C₁-C₆.

Un compuesto de la Fórmula I en donde R^b es cada uno independientemente
15 alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-
C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆.

Un compuesto de la Fórmula I en donde

D se selecciona de -CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH(CF₃)-, -(CH₂)₂-, ciclopropilo, -
20 CH₂C(CH₃)₂-, -CH(CH₃)CH₂-, -CH₂CH(CH₃)-, o -(CH₂)₄-;

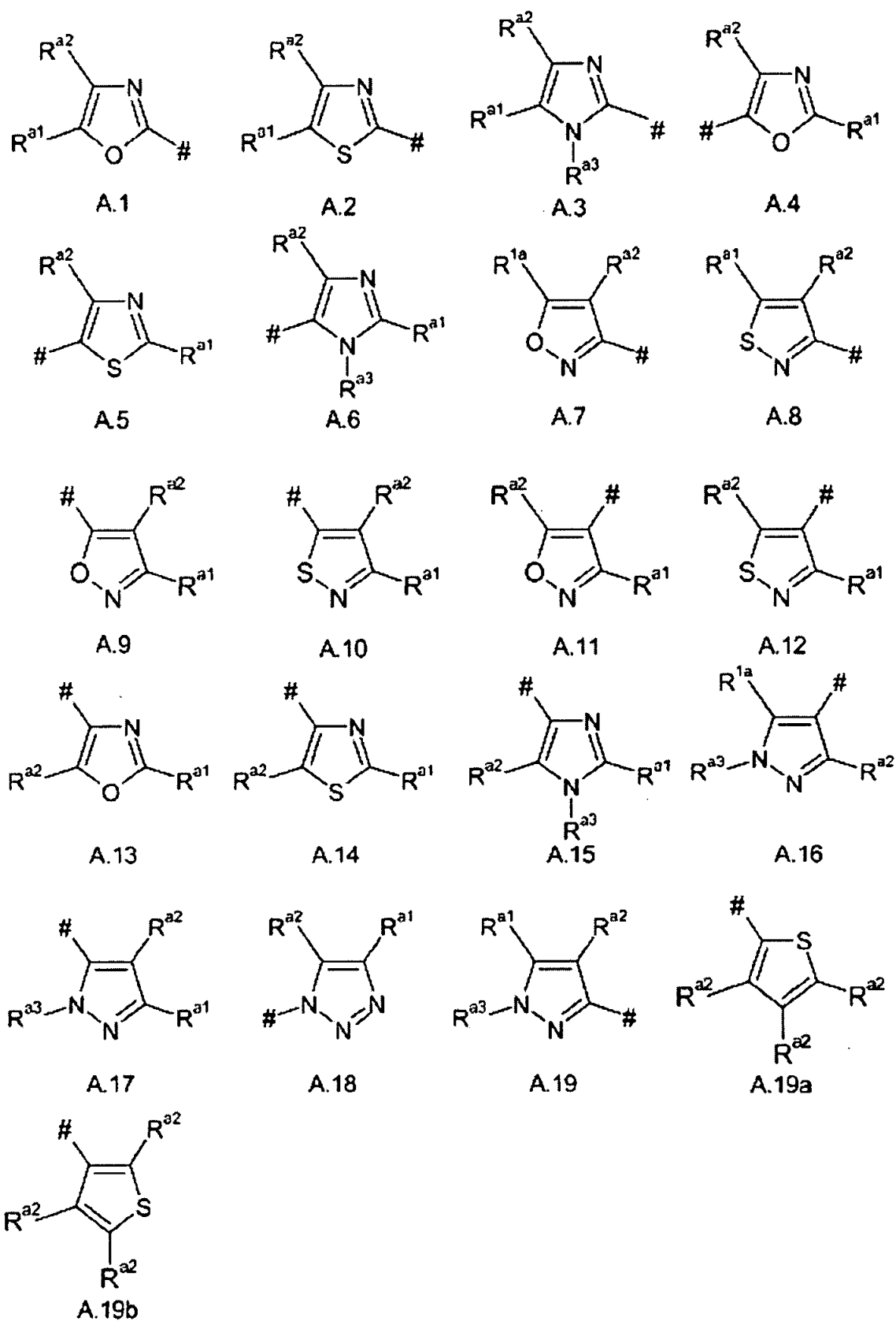
X es oxígeno, azufre, S(=O) o S(=O)₂; y

R¹ es CH₃, CH₂CH₃, (CH₂)₂CH₃, CH(CH₃)₂, (CH₂)₂CH₃, CH₂CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃,
25 fenilo, pentaclorofenilo, pentafluorofenilo, CH₂CCH₂, ciclopropilo, CH₂CCH,
bencilo, CF₃, CCl₃, CH₂CF₃, CH₂CHCCl₂, CF₂CF₃, ciclopentilo, ciclohexilo,
CH₂CH(CF₃)₂, o la porción -D-X-R¹ junto forma furanilo, tetrahydrofuranilo, tiofenilo,

tetrahidrotiofenilo, óxido de tetrahidrotiofenilo, dióxido de tetrahidrotiofenilo, 3-CF₃-tiofen-1-ilo, 3-CF₃-tetrahidrotiofen-1-ilo, 3-CF₃-furano-1-ilo, o 3-CF₃-tetrahydrofurano-1-ilo.

- 5 Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla A.

Tabla A



denota el sitio de unión.

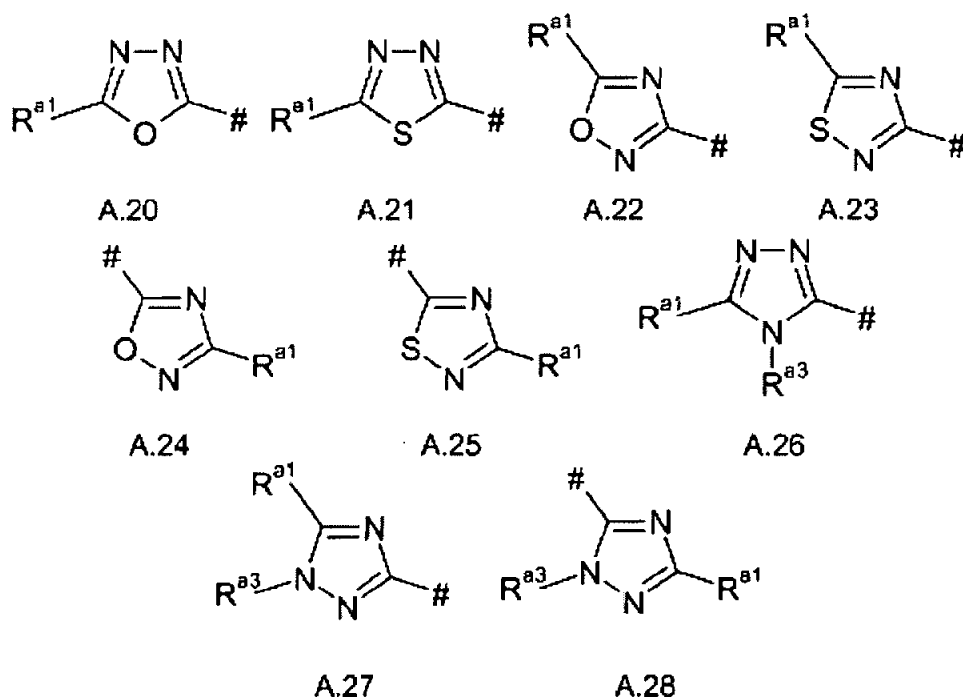
5 En los heterociclos A.1 a A.19 de la tabla A, R^{a1} y R^{a2} preferiblemente son cada

- uno independientemente hidrógeno, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, 1-metil-ciclopropilo, C(CH₃)₃, CH₂C(CH₃)₃, C(CH₃)₂CH₂CH₃, 1-metilciclohexilo, ciclohexilo, 1-metilciclopentilo, ciclopentilo, fenilo, F, Cl, Br, CN, NO₂, OCHF₂, OCH₃, OCH₂CH₃, CF₃, OCF₃, SCH₃, o SCF₃, más preferiblemente
- 5 hidrógeno, CH₃, CH(CH₃)₂, C(CH₃)₃, fenilo, F, Cl, CN, CF₃ o SCF₃.

en los grupos A.1 a A.19 de la tabla A, R^{a3} preferiblemente es CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, o fenilo.

- 10 Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla B.

Tabla B



denota el sitio de unión.

15

En los grupos A.20 a A.28 de la tabla B, R^{a1} preferiblemente es hidrógeno, CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, C(CH₃)₃, CH₂C(CH₃)₃, C(CH₃)₂CH₂CH₃, 1-metilciclohexilo, ciclohexilo, 1-metilciclopentilo, ciclopentilo,

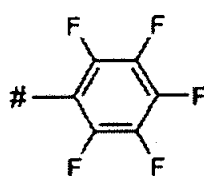
t 15

CF₃, fenilo, bencilo, NH₂, N(CH₃)₂ o NHC(=O)CH₃, más preferiblemente CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, C(CH₃)₃, CH₂C(CH₃)₃, C(CH₃)₂CH₂CH₃, CF₃, fenilo, bencilo, o NHC(=O)CH₃.

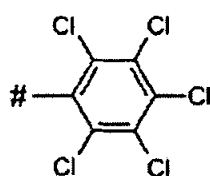
- 5 En los grupos A.20 a A.28 de la tabla B, R^{a3} preferiblemente es CH₃, CH₂CH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, o fenilo.

Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla C.

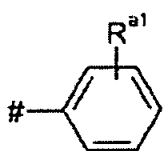
10 Tabla C



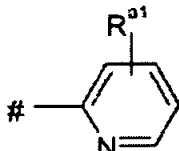
A.29



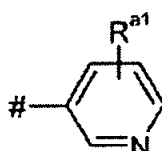
A.30



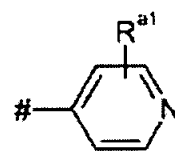
A.31



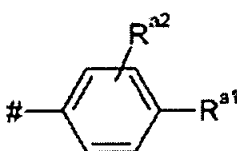
A.32



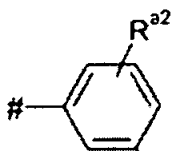
A.33



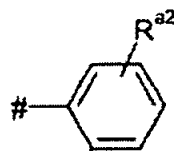
A.34



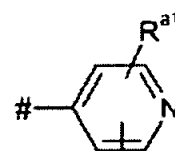
A.35



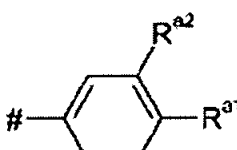
A.36



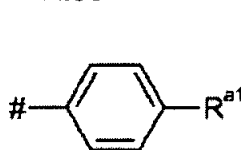
A.37



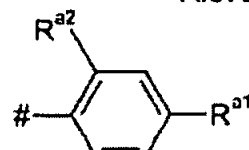
A.37a



A.38



A.39



A.40

denota el sitio de unión.

- 15 En los grupos A.31 a A.40 de la tabla C el grupo R^{a1} se selecciona de hidrógeno,

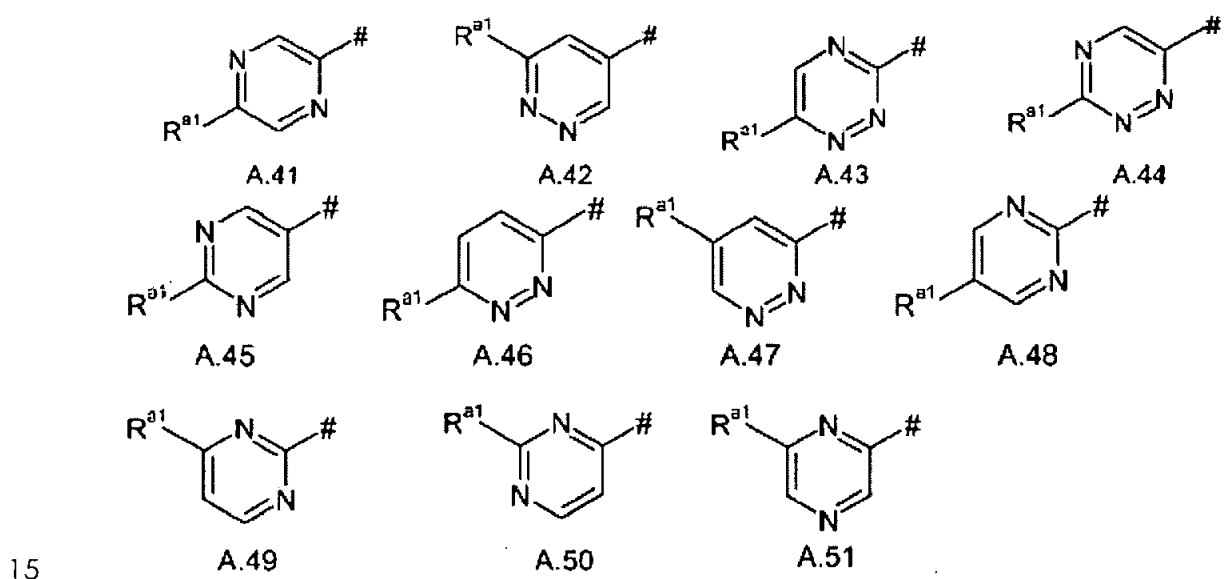
116

CH₃, CH₂CH₃, CHCH₂, CCH, CH₂CHCH₂, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)₂,
CH₂CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, C(CH₃)₃, OCH(CH₃)CH₂CH₃, bencilo, fenoxi,
tiofenilo, - S-(4-CH₃)C₆H₅, O-(4-Cl)C₆H₅, O-(3-Cl)-C₆H₅, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
OCH₃, OCF₃, OCF₂H, OCH₂CH₃, OCH₂CF₃, OCF₂CF₂H, OCF₂Cl, OCF₂Br,
5 OCH₂CH₂CH₃, OCH₂CH=CH₂, OCH(CH₃)₂, C(=O)CH₃, C(=O)OCH₃, CF₃,
CF(CF₃)₂, SCH₃, SCF₃, o SO₂CH₃, preferiblemente de CH₃, C(CH₃)₃, F, Cl, Br, I,
CN, OCH₃, SCF₃, CF₃, o CF(CF₃)₂

R^{a2} se selecciona de F, Cl, CF₃, CH₃, OCH₃, OCF₃, NO₂, o fenoxi, preferiblemente
10 de F, Cl, o CF₃.

Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla D.

Tabla D



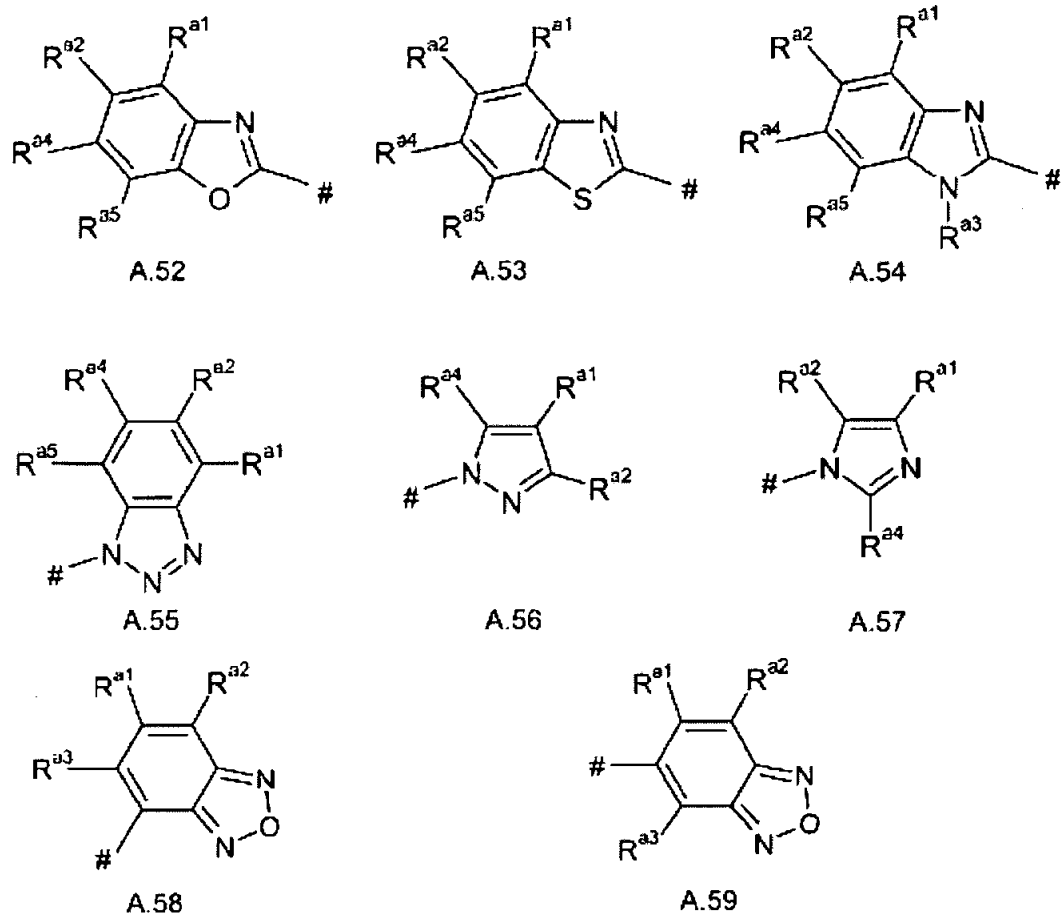
denota el sitio de unión.

En los grupos A.41 a A.51 de la tabla D el grupo R^{a1} se selecciona de hidrógeno,
20 F, Cl, Br, CN, NO₂, CH₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₂H, CH₂F, Et, CCH, CH(CH₃)₂,

C(CH₃)₃, SCH₃, SCF₃, SO₂CH₃, SO₂CF₃, OCH₂CCH, o OCH₂CCCH₃.

Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla E.

5 Tabla E



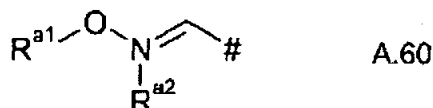
denota el sitio de unión.

En los grupos A.52 a A.57 de la tabla E los grupos R^{a1}, R^{a2}, R^{a4}, y R^{a5}
10 preferiblemente son cada uno independientemente seleccionado de hidrógeno,
CH₃, CH₂CH₃, (CH₃)₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, 1-metilciclopropilo, C(CH₃)₃,
CH(CH₃)CH₂CH₃, -CH₂-C(CH₃)₃, C(CH₃)₂CH₂CH₃, 1-metilciclohexilo, ciclohexilo, 1-
metilciclopentilo, ciclopentilo, fenilo, F, Cl, Br, CN, NO₂, OCHF₂, OCH₃, OCH₂CH₃,
CF₃, SCH₃, o SCF₃, más preferiblemente hidrógeno, CN, CH₃, F, Cl, o CF₃.

18

Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla F.

Tabla F



5

denota el sitio de unión.

En el grupo A.60 de la tabla F, R^{a1} se selecciona de hidrógeno, CH_3 , CH_2CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, CH_2CF_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CF}_3$, $(\text{CH}_2)_3\text{CF}_3$, CH_2CHCH_2 , $\text{CH}_2\text{CHC}(\text{CH}_3)_2$, CH_2CHCHCl , $\text{CH}_2\text{CHCBr}_2$, CH_2CCH , $\text{CH}_2\text{ciclopropilo}$, $\text{CH}_2\text{ciclobutilo}$, $\text{CH}_2\text{ciclopentilo}$, $\text{CH}_2\text{-ciclohexilo}$, ciclopropilo , ciclobutilo , ciclopentilo , ciclohexilo , $(\text{CH}_2)_2\text{F}$, $(\text{CH}_2)_3\text{F}$, $(\text{CH}_2)\text{C}_6\text{H}_5$, $(\text{CH}_2)(2\text{-Cl-fenilo})$, $(\text{CH}_2)(3\text{-Cl-fenilo})$ o $(\text{CH}_2)(4\text{-Cl-Fenilo})$.

15 R^{a2} se selecciona de CH_3 , CF_3 , CH_2CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, o fenilo.

Un compuesto de la Fórmula I en donde A se selecciona de la tabla G.

Tabla G



20

denota el sitio de unión.

En los grupos A.61 y A.62 de la tabla G, R^{a1} y R^{a2} cada uno se selecciona
25 independientemente de hidrógeno, CH_3 , CH_2CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$,

ciclopropilo, $(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, CH_2CCH , CH_2CHCH_2 , $\text{C}(\text{CH}_3)_3\text{CCH}$, C_6H_5 , $\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$, CF_3 , CH_2F , CH_2CN , $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$, CH_2OCH_3 , $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{F}$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{S}(=\text{O})_2\text{C}_6\text{H}_5$, o $\text{S}(=\text{O})_2[(p\text{-CH}_3)\text{C}_6\text{H}_4]$.

5

R^{a1} preferiblemente se selecciona de $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, ciclopropilo $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, CH_2CN , o CH_2OCH_3 , R^{a2} preferiblemente se selecciona de hidrógeno o CH_3 .

Un compuesto de la Fórmula I en donde

10

D se selecciona de $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}(\text{CF}_3)-$, $-(\text{CH}_2)_2-$, ciclopropilo, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$, o $-(\text{CH}_2)_4-$;

X es oxígeno, azufre, $\text{S}(=\text{O})$ o $\text{S}(=\text{O})_2$; y

15

R^1 es CH_3 , CH_2CH_3 , $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(\text{CH}_3)_3$, fenilo, pentaclorofenilo, pentafluorofenilo, CH_2CCH_2 , ciclopropilo, CH_2CCH , bencilo, CF_3 , CCl_3 , CH_2CF_3 , $\text{CH}_2\text{CHCCl}_2$, CF_2CF_3 , ciclopentilo, ciclohexilo, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CF}_3)_2$, o la porción $-\text{D}-\text{X}-\text{R}^1$ juntos forman furanilo, tetrahydrofuranilo, tiofenilo, tetrahidrotiofenilo, óxido de tetrahidrotiofenilo, dióxido de tetrahidrotiofenilo, 3- CF_3 -tiofen-1-ilo, 3- CF_3 -tetrahidrotiofen-1-ilo, 3- CF_3 -furan-1-ilo, o 3- CF_3 -tetrahydrofurano-1-ilo.

20

Un compuesto de la Fórmula I en donde la porción $\text{D}-\text{X}-\text{R}^1$ se selecciona de la tabla H.

25

20

Tabla H

No.	D	X	R'
W-1	-CH ₂ -	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-2	-CH(CH ₃)-	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-3	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-4	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-5	-CH ₂ -	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-6	-CH(CH ₃)-	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-7	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-8	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-9	-CH ₂ -	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-10	-CH(CH ₃)-	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-11	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-12	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-13	-CH ₂ -	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-14	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-15	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-16	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	(CH ₂) ₂ CH ₃
W-17	-CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂
W-18	-CH(CH ₃)-	O	CH(CH ₃) ₂
W-19	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂
W-20	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH(CH ₃) ₂
W-21	-CH ₂ -	S	CH(CH ₃) ₂
W-22	-CH(CH ₃)-	S	CH(CH ₃) ₂
W-23	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH(CH ₃) ₂
W-24	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH(CH ₃) ₂
W-25	-CH ₂ -	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-26	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-27	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-28	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH(CH ₃) ₂
W-29	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-30	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-31	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-32	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH(CH ₃) ₂
W-33	-CH ₂ -	O	C(CH ₃) ₃
W-34	-CH(CH ₃)-	O	C(CH ₃) ₃
W-35	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	C(CH ₃) ₃
W-36	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	C(CH ₃) ₃
W-37	-CH ₂ -	S	C(CH ₃) ₃

(2)

No.	D	X	R'
W-38	-CH(CH ₃)-	S	C(CH ₃) ₃
W-39	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	C(CH ₃) ₃
W-40	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	C(CH ₃) ₃
W-41	-CH ₂ -	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-42	-CH(CH ₃)-	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-43	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-44	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	C(CH ₃) ₃
W-45	-CH ₂ -	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-46	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-47	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-48	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C(CH ₃) ₃
W-49	-CH ₂ -	O	CF ₃
W-50	-CH(CH ₃)-	O	CF ₃
W-51	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₃
W-52	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₃
W-53	-CH ₂ -	S	CF ₃
W-54	-CH(CH ₃)-	S	CF ₃
W-55	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₃
W-56	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₃
W-57	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₃
W-58	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₃
W-59	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₃
W-60	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₃
W-61	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃
W-62	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₃
W-63	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃
W-64	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₃
W-65	-CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃
W-66	-CH(CH ₃)-	O	CH ₂ CF ₃
W-67	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃
W-68	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH ₂ CF ₃
W-69	-CH ₂ -	S	CH ₂ CF ₃
W-70	-CH(CH ₃)-	S	CH ₂ CF ₃
W-71	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH ₂ CF ₃
W-72	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH ₂ CF ₃
W-73	-CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-74	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-75	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-76	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ CF ₃
W-77	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃

No.	D	X	R ¹
W-78	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-79	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-80	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ CF ₃
W-81	-CH ₂ -	O	ciclo-C ₅ H ₉
W-82	-CH(CH ₃)-	O	ciclo-C ₅ H ₉
W-83	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	ciclo-C ₅ H ₉
W-84	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	ciclo-C ₅ H ₉
W-85	-CH ₂ -	S	ciclo-C ₅ H ₉
W-86	-CH(CH ₃)-	S	ciclo-C ₅ H ₉
W-87	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	ciclo-C ₅ H ₉
W-88	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	ciclo-C ₅ H ₉
W-89	-CH ₂ -	S(=O)	ciclo-C ₅ H ₉
W-90	-CH(CH ₃)-	S(=O)	ciclo-C ₅ H ₉
W-91	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	ciclo-C ₅ H ₉
W-92	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	ciclo-C ₅ H ₉
W-93	-CH ₂ -	S(=O) ₂	ciclo-C ₅ H ₉
W-94	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	ciclo-C ₅ H ₉
W-95	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	ciclo-C ₅ H ₉
W-96	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	ciclo-C ₅ H ₉
W-97	-CH ₂ -	O	C ₆ H ₅
W-98	-CH(CH ₃)-	O	C ₆ H ₅
W-99	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	C ₆ H ₅
W-100	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	C ₆ H ₅
W-101	-CH ₂ -	S	C ₆ H ₅
W-102	-CH(CH ₃)-	S	C ₆ H ₅
W-103	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	C ₆ H ₅
W-104	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	C ₆ H ₅
W-105	-CH ₂ -	S(=O)	C ₆ H ₅
W-106	-CH(CH ₃)-	S(=O)	C ₆ H ₅
W-107	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	C ₆ H ₅
W-108	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	C ₆ H ₅
W-109	-CH ₂ -	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-110	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-111	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-112	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	C ₆ H ₅
W-113	-CH ₂ -	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-114	-CH(CH ₃)-	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-115	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-116	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CH ₂ C ₆ H ₅
W-117	-CH ₂ -	S	CH ₂ C ₆ H ₅

23

No.	D	X	R ¹
W-118	-CH(CH ₃)-	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-119	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-120	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CH ₂ C ₆ H ₅
W-121	-CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-122	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-123	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-124	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CH ₂ C ₆ H ₅
W-125	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-126	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-127	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-128	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CH ₂ C ₆ H ₅
W-129	-CH ₂ -	O	CF=CF ₂
W-130	-CH(CH ₃)-	O	CF=CF ₂
W-131	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF=CF ₂
W-132	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF=CF ₂
W-133	-CH ₂ -	S	CF=CF ₂
W-134	-CH(CH ₃)-	S	CF=CF ₂
W-135	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF=CF ₂
W-136	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF=CF ₂
W-137	-CH ₂ -	S(=O)	CF=CF ₂
W-138	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF=CF ₂
W-139	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF=CF ₂
W-140	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF=CF ₂
W-141	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-142	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-143	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-144	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF=CF ₂
W-145	-CH ₂ -	O	CF ₂ CF ₃
W-146	-CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CF ₃
W-147	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₂ CF ₃
W-148	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CF ₃
W-149	-CH ₂ -	S	CF ₂ CF ₃
W-150	-CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CF ₃
W-151	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₂ CF ₃
W-152	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CF ₃
W-153	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-154	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-155	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-156	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CF ₃
W-157	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃

(24)

No.	D	X	R'
W-158	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-159	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-160	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CF ₃
W-161	-CH ₂ -	O	CF ₂ CFCI
W-162	-CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CFCI
W-163	-CH(CH ₃)CH ₂ -	O	CF ₂ CFCI
W-164	-CH ₂ CH(CH ₃)-	O	CF ₂ CFCI
W-165	-CH ₂ -	S	CF ₂ CFCI
W-166	-CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CFCI
W-167	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S	CF ₂ CFCI
W-168	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S	CF ₂ CFCI
W-169	-CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-170	-CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-171	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-172	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O)	CF ₂ CFCI
W-173	-CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-174	-CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-175	-CH(CH ₃)CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-176	-CH ₂ CH(CH ₃)-	S(=O) ₂	CF ₂ CFCI
W-177	2-tetrahidrotiofenilo		
W-178	2-tiofenilo		
W-179	5-CF ₃ -2-tetrahidrotiofenilo		
W-180	5-CF ₃ -2-tiofenilo		

Con respecto a su uso, se da preferencia particular a los compuestos IA compilados en las tablas adelante. Más aún, los grupos mencionados para un sustituyente en las tablas son propios, independientemente de la combinación en la que ellos se mencionan, una modalidad particularmente preferida del sustituyente en cuestión.

Tabla 1

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W- 1, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

125



Tabla 2

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-5, y A
5 corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 3

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-17, y A
corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

10

Tabla 4

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-21, y A
corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

15 Tabla 5

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-33, y A
corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 6

20 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-37, y A
corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 7

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH₂-, W denota W-49, y A
25 corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 8

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-53, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 9

- 5 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-65, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 10

- 10 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-69, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 11

- 15 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-81, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 12

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-85, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

20 Tabla 13

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-97, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 14

- 25 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W- 101, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 15

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W- 1 13, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

5 Tabla 16

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W- 1 17, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 17

10 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}_2-$, W denota W-129, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 18

15 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W- 131, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 19

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W- 1, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

20



Tabla 20

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-5, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

25

Tabla 21

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-17, y

28

A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 22

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-21, y

5 A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 23

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-33, y

A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

10

Tabla 24

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-37, y

A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

15 Tabla 25

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-49, y

A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 26

20 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-53, y

A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 27

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-65, y

25 A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 28

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-69, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 29

- 5 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-81, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 30

- Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-85, y
10 A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 31

- Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W-97, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.
15

Tabla 32

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W- 101, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

20 Tabla 33

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W- 13, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla 34

- 25 Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, W denota W- 17, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

130

Tabla 35

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH(CH₃)-, W denota W- 129, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

5 Tabla 36

Los compuestos de la fórmula IA en donde B denota -CH(CH₃)-, W denota W- 131, y A corresponde en cada caso a una fila de la Tabla K.

Tabla K

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-1	A.1	H	H
IA-2	A.1	H	CH ₃
IA-3	A.1	H	C(CH ₃) ₃
IA-4	A.1	H	C ₆ H ₅
IA-5	A.1	H	ciclo-C ₃ H ₅
IA-6	A.1	H	Cl
IA-7	A.1	CH ₃	H
IA-8	A.1	C(CH ₃) ₃	H
IA-9	A.1	C ₆ H ₅	H
IA-10	A.1	ciclo-C ₃ H ₅	H
IA-11	A.1	Cl	H
IA-12	A.5	H	H
IA-13	A.5	H	CH ₃
IA-14	A.5	H	C(CH ₃) ₃
IA-15	A.5	H	C ₆ H ₅
IA-16	A.5	H	ciclo-C ₃ H ₅
IA-17	A.5	H	Cl
IA-18	A.5	CH ₃	H

V31

No.	A	R ^{*1}	R ^{*2}
IA-19	A.5	C(CH ₃) ₃	H
IA-20	A.5	C ₆ H ₅	H
IA-21	A.5	ciclo-C ₃ H ₅	H
IA-22	A.5	Cl	H
IA-23	A.9	H	H
IA-24	A.9	H	CH ₃
IA-25	A.9	H	C(CH ₃) ₃
IA-26	A.9	H	C ₆ H ₅
IA-27	A.9	H	ciclo-C ₃ H ₅
IA-28	A.9	H	Cl
IA-29	A.9	CH ₃	H
IA-30	A.9	C(CH ₃) ₃	H
IA-31	A.9	C ₆ H ₅	H
IA-32	A.9	ciclo-C ₃ H ₅	H
IA-33	A.9	Cl	H
IA-34	A.14	H	H
IA-35	A.14	H	CH ₃
IA-36	A.14	H	C(CH ₃) ₃
IA-37	A.14	H	C ₆ H ₅
IA-38	A.14	H	ciclo-C ₃ H ₅
IA-39	A.14	H	Cl
IA-40	A.14	CH ₃	H
IA-41	A.14	C(CH ₃) ₃	H
IA-42	A.14	C ₆ H ₅	H
IA-43	A.14	ciclo-C ₃ H ₅	H
IA-44	A.14	Cl	H
IA-45	A.20	4-Cl-C ₆ H ₅	-
IA-46	A.20	CH ₃	-
IA-47	A.20	C(CH ₃) ₃	-
IA-48	A.20	CF ₃	-
IA-49	A.20	ciclo-C ₃ H ₅	-
IA-50	A.21	CH ₃	-

No.	A	R ^{#1}	R ^{#2}
IA-83	A.35	Cl	2-Cl
IA-84	A.35	F	2-Cl
IA-85	A.35	CH ₃	2-F
IA-86	A.35	C(CH ₃) ₃	2-F
IA-87	A.35	OCF ₃	2-F
IA-88	A.35	CF ₃	2-F
IA-89	A.35	Cl	2-F
IA-90	A.35	F	2-F
IA-91	A.35	CH ₃	3-CH ₃
IA-92	A.35	C(CH ₃) ₃	3-CH ₃
IA-93	A.35	OCF ₃	3-CH ₃
IA-94	A.35	CF ₃	3-CH ₃
IA-95	A.35	Cl	3-CH ₃
IA-96	A.35	F	3-CH ₃
IA-97	A.35	CH ₃	3-Cl
IA-98	A.35	C(CH ₃) ₃	3-Cl
IA-99	A.35	OCF ₃	3-Cl
IA-100	A.35	CF ₃	3-Cl
IA-101	A.35	Cl	3-Cl
IA-102	A.35	F	3-Cl
IA-103	A.35	CH ₃	3-F
IA-104	A.35	C(CH ₃) ₃	3-F
IA-105	A.35	OCF ₃	3-F
IA-106	A.35	CF ₃	3-F
IA-107	A.35	Cl	3-F
IA-108	A.35	F	3-F
IA-109	A.36	CH ₃	2-CH ₃
IA-110	A.36	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃
IA-111	A.36	OCF ₃	2-CH ₃
IA-112	A.36	CF ₃	2-CH ₃
IA-113	A.36	Cl	2-CH ₃
IA-114	A.36	F	2-CH ₃

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-115	A.36	CH ₃	2-Cl
IA-116	A.36	C(CH ₃) ₃	2-Cl
IA-117	A.36	OCF ₃	2-Cl
IA-118	A.36	CF ₃	2-Cl
IA-119	A.36	Cl	2-Cl
IA-120	A.36	F	2-Cl
IA-121	A.36	CH ₃	2-F
IA-122	A.36	C(CH ₃) ₃	2-F
IA-123	A.36	OCF ₃	2-F
IA-124	A.36	CF ₃	2-F
IA-125	A.36	Cl	2-F
IA-126	A.36	F	2-F
IA-127	A.36	CH ₃	4-CH ₃
IA-128	A.36	C(CH ₃) ₃	4-CH ₃
IA-129	A.36	OCF ₃	4-CH ₃
IA-130	A.36	CF ₃	4-CH ₃
IA-131	A.36	Cl	4-CH ₃
IA-132	A.36	F	4-CH ₃
IA-133	A.36	CH ₃	4-Cl
IA-134	A.36	C(CH ₃) ₃	4-Cl
IA-135	A.36	OCF ₃	4-Cl
IA-136	A.36	CF ₃	4-Cl
IA-137	A.36	Cl	4-Cl
IA-138	A.36	F	4-Cl
IA-139	A.36	CH ₃	4-F
IA-140	A.36	C(CH ₃) ₃	4-F
IA-141	A.36	OCF ₃	4-F
IA-142	A.36	CF ₃	4-F
IA-143	A.36	Cl	4-F
IA-144	A.36	F	4-F
IA-145	A.37	Cl	6-Cl
IA-146	A.40	CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂

34

No.	A	R ^{#1}	R ^{#2}
IA-147	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-148	A.40	OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-149	A.40	CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
IA-150	A.40	Cl	2,6-(CH ₃) ₂
IA-151	A.40	F	2,6-(CH ₃) ₂
IA-152	A.40	CH ₃	2,6-Cl ₂
IA-153	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-Cl ₂
IA-154	A.40	OCF ₃	2,6-Cl ₂
IA-155	A.40	CF ₃	2,6-Cl ₂
IA-156	A.40	Cl	2,6-Cl ₂
IA-157	A.40	F	2,6-Cl ₂
IA-158	A.40	CH ₃	2,6-F ₂
IA-159	A.40	C(CH ₃) ₃	2,6-F ₂
IA-160	A.40	OCF ₃	2,6-F ₂
IA-161	A.40	CF ₃	2,6-F ₂
IA-162	A.40	Cl	2,6-F ₂
IA-163	A.40	F	2,6-F ₂
IA-164	A.40	CH ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-165	A.40	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-166	A.40	OCF ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-167	A.40	CF ₃	2-CH ₃ -6-F
IA-168	A.40	Cl	2-CH ₃ -6-F
IA-169	A.40	F	2-CH ₃ -6-F
IA-170	A.40	CH ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-171	A.40	C(CH ₃) ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-172	A.40	OCF ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-173	A.40	CF ₃	2-CH ₃ -6-Cl
IA-174	A.40	Cl	2-CH ₃ -6-Cl
IA-175	A.40	F	2-CH ₃ -6-Cl
IA-176	A.40	CH ₃	2-F-6-Cl
IA-177	A.40	C(CH ₃) ₃	2-F-6-Cl
IA-178	A.40	OCF ₃	2-F-6-Cl

No.	A	R ^{o1}	R ^{o2}
IA-179	A.40	CF ₃	2-F-6-Cl
IA-180	A.40	Cl	2-F-6-Cl
IA-181	A.40	F	2-F-6-Cl
IA-182	A.48	H	-
IA-183	A.48	F	-
IA-184	A.48	Cl	-
IA-185	A.48	Br	-
IA-186	A.48	CF ₃	-
IA-187	A.48	C(CH ₃) ₃	-
IA-188	A.48	F	-
IA-189	A.48	Cl	-
IA-190	A.48	Br	-
IA-191	A.48	CF ₃	-
IA-192	A.48	C(CH ₃) ₃	-
IA-193	A.60	CH ₃	CH ₃
IA-194	A.60	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
IA-195	A.60	C(CH ₃) ₃	CH ₃
IA-196	A.60	CH ₂ CF ₃	CH ₃
IA-197	A.60	ciclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-198	A.60	CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-199	A.60	CH ₃	CF ₃
IA-200	A.60	CH(CH ₃) ₂	CF ₃
IA-201	A.60	C(CH ₃) ₃	CF ₃
IA-202	A.60	CH ₂ CF ₃	CF ₃
IA-203	A.60	ciclo-C ₃ H ₅	CF ₃
IA-204	A.60	CH ₂ -ciclo-C ₃ H ₅	CF ₃
IA-205	A.61	(CH ₂) ₂ CH ₃	H
IA-206	A.61	CH(CH ₃) ₂	H
IA-207	A.61	C(CH ₃) ₃	H
IA-208	A.61	CH ₂ CN	H
IA-209	A.61	ciclo-C ₃ H ₅	H
IA-210	A.61	CH ₂ OCH ₃	H

No.	A	R ^{a1}	R ^{a2}
IA-211	A.61	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃
IA-212	A.61	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
IA-213	A.61	C(CH ₃) ₃	CH ₃
IA-214	A.61	CH ₂ CN	CH ₃
IA-215	A.61	ciclo-C ₃ H ₅	CH ₃
IA-216	A.61	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
IA-217	A.62	(CH ₂) ₂ CH ₃	-
IA-218	A.62	CH(CH ₃) ₂	-
IA-219	A.62	C(CH ₃) ₃	-
IA-220	A.62	CH ₂ CN	-
IA-221	A.62	ciclo-C ₃ H ₅	-
IA-222	A.62	CH ₂ OCH ₃	-
IA-223	A.62	C(CH ₃) ₃	-
IA-224	A.62	C(CH ₃) ₂ CCH	-

Los compuestos de la fórmula I son especialmente adecuados para combatir eficientemente las siguientes plagas:

5

insectos del orden de lo lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyrorestia conjugella, Autographa gamma, Bupalus piniarius, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Cheimantobia brumata, Choristoneura fumiferana, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Evetria bouliana, Feltia subterranea, Galleria mellonella, Grapholitha funebrana, Grapholitha molesta, Heliotis armigera, Heliotis virescens, Heliotis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella, Lobesia botrana, Loxostege

10

15

137

- sticticalis, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Ftorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*,
5 *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganotis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*,
- 10 *escarabajos (Coleoptera)*, por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Aftona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*,
15 *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera ssp.*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica 12-punctata* *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips*
20 *typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius piri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta*
25 *nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*,

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*,
5 *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia antropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*,
10 *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*,
15 *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*,
20 *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, y *Tipula paludosa*

trips (Thysanoptera), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp,
25 *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

termitas (Isoptera), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*, y *Coptotermes formosanus*,

- 5 cucarachass (Blattaria - Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

- chinchas (Hemiptera), por ejemplo *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*,
10 *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*,
15 *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum*
20 *pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis piri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pirarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella*
25 *saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion*

avenae, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii*and, *Viteus vitifolii*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., y *Arilus critatus*.

hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidol megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp. *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, y *Linepithema humile*,

grillos, saltamontes, langostas (Orto ptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, y *Locustana pardalina*,

Aracnoides, tal como arachnids (Acarina), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tal como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Ambryomma maculatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holociclus*, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros*

moubata, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*, *Ornithonyssus bacoti*,
Otobius megnini, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus*
sanguineus, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes*
scabiei, y *Eriophyidae* spp. tal como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptura oleivora*
5 y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tal como *Phytonemus pallidus* y
Poliphagotarsonemus latus; *Tenuipalpidae* spp. tal como *Brevipalpus phoenicis*;
Tetranychidae spp. tal como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*,
Tetranychus pacificus, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus*
ulmi, *Panonychus citri*, y *Oligonychus pratensis*; *Araneida*, por ejemplo *Latrodectus*
10 *mactans*, y *Loxosceles reclusa*,

moscas (*Siphonaptera*), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*,
Xenopsylla cheopis, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,
15 pez plateado, *termobia* (*Thysanura*), por ejemplo *Lepisma saccharina* y
Thermobia domestica,

cienpiés (*Chilopoda*), por ejemplo *Scutigera coleoptrata*,

20 milpiés (*Diplopoda*), por ejemplo *Narceus* spp.,

tijeretas (*Dermaptera*), por ejemplo *forficula auricularia*,

piojos (*Ftiraptera*), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus*
25 *corporis*, *Ptirus pubis*, *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus suis*,
Linognathus vituli, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y
Solenopotes capillatus,

142

nematodos de plantas parásitas tales como nematodos de la raíz, *Meloidogyne* arenaria, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y otras especies *Meloidogyne*;

5 nematodos de quiste, *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Globodera tabacum* y otras especies *Globodera*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies *Heterodera*; nematodos galigeno, *Anguina funesta*, *Anguina tritici* y otras especies *Anguina*; nematodos de tallo y hojas, *Aphelenchoides besseyi*, *Aphelenchoides fragariae*, *Aphelenchoides*

10 *ritzemabosi* y otras especies *Aphelenchoides*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especie *Criconema*, especie *Criconemella*, especie *Criconemoides*, y especie *Mesocriconema*; nematodos del tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*,

15 *Ditylenchus bañosaci*, *Ditylenchus myceliophagus* y otras especies *Ditylenchus* species; awl nemátodos, especie *Dolichodorus*; nematodos espiral, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; nematodos de la vaina, especie *Hemicicliophora* y especie *Hemicriconemoides*;

20 especie *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* y otras especies de *Hoplolaimus*; nematodos de raíz falsos, *Nacobbus aberrans* y otras especies de *Nacobbus*; nematodos aguja, *Longidorus elongates* y otras especies *Longidorus*; nematodos de pino, especie *Paratylenchus*; nematodos de lesión, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*,

25 *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zaeae* y otras especies *Pratylenchus*; *Radinaphelenchus cocophilus* y otras

especies *Radinaphelenchus*; nematodos del banano, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nemátodos reniformes, *Rotylenchulus reniformis* y otras especies *Rotylenchulus*; especie *Scutellonema*; nematodos de raíz gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies *Trichodorus*; *Paratrichodorus minor* y otras especies *Paratrichodorus*; nematodos de malformación, *Tylenchorhynchus arcillatoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies *Tylenchorhynchus* y especie *Merlinius*; nematodos de cítricos, *Tylenchulus semipenetrans* y otras especies *Tylenchulus*; nematodos, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema index*, *Xiphinema diversicaudatum* y otras especies *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parasíticos.

Las formulaciones se preparan en una forma conocida (ver por ejemplo para revisión US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publicaciones, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo al extender el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desea emulgentes, tensoactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelante, para formulación para tratamiento de semilla también opcionalmente colorantes y ligadores.

Ejemplos de los disolventes adecuados son agua, disolventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, bencilo alcohol),
5 cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactonas), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (glicol diacetato), glicoles, dimetilamidas de ácido graso, ácidos grasos y ésteres de ácido graso. En principio, también se pueden utilizar las mezclas de disolvente.

10 Ejemplos de portadores adecuados son minerales naturales de tierra (por ejemplo caolines, arcillas, talco, yeso) y minerales sintéticos de tierra (por ejemplo sílice altamente dispersa, silicatos).

Los emulgentes adecuados son emulgentes no iónicos y aniónicos (por ejemplo
15 polioxietilen alcohol graso éteres, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Ejemplos de dispersantes son licores de desperdicio de lingnina-sulfito y metilcelulosa.

20 Los tensoactivos adecuados utilizados son sales de metal álcali, metal alcalinotérreo y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquilo, alquilsulfonatos, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicol éteres de alcohol graso sulfatados, adicionalmente condensados de naftaleno sulfonado y
25 derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno u de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilene octilfenol éter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éteres, tributilfenilo

poliglicol éter, tristearilfenilo poliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, alcohol y alcohol graso condensados de óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietilene alquilo éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril alcohol poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol, licores de desperdicio de lignosulfito y metilcelulosa.

5

Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones de rociado directo, emulsiones, pastas u dispersiones en aceite son fracciones de aceite mineral de medio a alto punto de ebullición, tal como queroseno o gasoil, adicionalmente aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, aliphatic, ciclic y hidrocarburos aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isophorona, disolventes altamente polares, por ejemplo dimetil sulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

10

15 También los agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas tales como se pueden agregar a la formulación.

Agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes basados en silicio o estearato de magnesio.

20

Polvos, materiales para rociado y productos en forma de polvillo se pueden preparar al mezclar o moler concomitantemente las sustancias activas con un portador sólido.

25

Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos, homogéneos se pueden preparar al unir los compuestos activos a portadores sólidos. Ejemplos de portadores sólidos son minerales de tierra tales como gel de

f 4b

silices, silicatos, talco, caolín, arcilla, caliza, cal, yeso, bolo, loess, arcilla, dolomita, tierra diatomácea, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos de tierra, fertilizantes, tal como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas, y productos de origen

5 vegetal, tal como harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

En general, las formulaciones comprenden de 0.01 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1 a 90% en peso, de los compuestos activos. En este caso,

10 los compuestos activos se emplean en una pureza de 90% a 100% en peso, preferiblemente 95% a 100% en peso (de acuerdo con el espectro RMN).

Los compuestos de la fórmula I se pueden utilizar como tal, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas de ellas, por ejemplo en la forma de

15 soluciones de rociado directo, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos en forma de polvillos, materiales para rociado, o gránulos, por medio de rociado, atomizado, espolvoreo, rociado o vertido. Las formas de uso dependen completamente en los propósitos destinados; ellas están destinadas a asegurar en cada caso la distribución más

20 fina posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

Las formas de uso acuosas se pueden preparar de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polveros rociables, dispersiones en aceite) al agregar agua. Para preparar emulsiones, pastas u dispersiones en aceite, las sustancias,

25 como tal o disueltas en un aceite o disolvente, se pueden homogenizar en agua por medio de un humectante, agente pegajocidad, dispersante o emulgente. Sin embargo, es también posible preparar concentrados compuestos de sustancia

147

activa, humectantes, agente pegajocidad, dispersante o emulgente y, si es apropiado, disolvente u aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

- 5 Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones listas para uso se puede variar con relativamente amplios rangos. En general, ellos son de 0.0001 a 10%, preferiblemente de 0.01 a 1% por peso.

- 10 Los compuestos activos también se pueden utilizar exitosamente en el proceso de ultra-bajo-volumen (ULV), es posible aplicar formulaciones que comprenden 95% en peso de compuesto activo, o aún aplicar el compuesto activo sin aditivos.

- Los siguientes son ejemplos de las formulaciones: 1. Productos para la dilución con agua para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento a semillas, 15 tales productos se pueden aplicar a la sémilla diluido o no diluido.

A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

- 10 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Como una alternativa, se agregan 20 humectantes u otros auxiliares. Los compuestos activos se disuelven luego de dilución con agua, por lo tanto se obtiene una formulación con 10% (p/p) de compuestos activos.

B) Concentrados dispersables (DC)

- 25 20 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 75 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La la dilución con agua da una dispersión, por lo tanto se

obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuestos activos.

C) Concentrados emulsificables (EC)

15 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 75 partes en peso
5 de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de ricino
etoxilado (en cada caso 5 partes por peso). La dilución con agua da una emulsión,
por lo tanto se obtiene una formulación con 15% de (p/p) de compuestos activos.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

10 40 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 35 partes en peso
de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de ricino
etoxilado (en cada caso 5 partes por peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes
en peso de agua por medio de una máquina emulgente (por ejemplo Ultraturrax) y
se hace en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, por
15 lo tanto se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuestos activos.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bola agitado, 20 partes en peso de los compuestos activos se
pulverizan con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70
20 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para dar una suspensión de
compuestos activos fina. La dilución con agua da una suspensión estable de los
compuestos activos, por lo tanto se obtiene una formulación con 20₁ (p/p) de
compuestos activos.

25 F) Gránulos dispersos en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

50 partes en peso de los compuestos activos se muelen finamente con adición de
50 partes en peso de dispersantes y humectantes y hechos gránulos dispersibles

en agua o solubles en agua por medio de aplicaciones técnicas (por ejemplo extrusión, torre de aspersión, lecho fluido). La dilución con agua da una dispersión estable o solución de los compuestos activos, por lo tanto se obtiene una formulación con 50% (p/p) de compuestos activos.

5

G) Polvos dispersible en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, SS, WS)

75 partes en peso de los compuestos activos se muelen en un molino rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una dispersión estable o solución de los compuestos activos,

10 por lo tanto se obtiene una formulación con 75% (p/p) de compuestos activos.

2. Productos a ser aplicados no diluidos para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento a semillas, tales productos se pueden aplicar a la semilla diluido o no diluido.

15

H) Polvos (DP, DS)

5 partes en peso de los compuestos activos se muelen finamente y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto de polvo que tiene 5% (p/p) de compuestos activos

20

I) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

0.5 parte en peso de los compuestos activos se muele finamente y se asocia con 95.5 partes por peso de portadores, por lo tanto se obtiene una formulación con 0.5% (p/p) de compuestos activos. Los métodos concurrentes son extrusión, rociado-secado o el lecho fluido. Esto da gránulos que se aplican no diluidos para uso foliar.

25

J) Soluciones ULV (UL, LS)

10 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) de compuestos activos, que se aplica no diluido para uso foliar.

5

Varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas se pueden agregar a los ingredientes activos, si es apropiado justa inmediatamente antes de uso (mezcla de tanque). Estos agentes usualmente se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una

10 proporción de peso de 1:10 a 10:1.

Los compuestos de la fórmula I son efectivos a través de contacto (por vía del suelo, vidrio, pared, red de la cama, alfombra, partes de planta o partes de animales), y ingestión (cebo, o parte de planta) y a través de trofalaxis y

15 transferencia.

De acuerdo con una modalidad preferida de la invención, los compuestos de la fórmula I se emplean por vía de aplicación al suelo. La aplicación al suelo es especialmente favorable para uso contra hormigas, termitas, grillos, o cucarachas.

20

De acuerdo con otra modalidad preferida de la invención, para uso contra plagas de no cultivo tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, langostas, o cucarachas Los compuestos de la fórmula I se preparan en una preparación de cebo.

25

El cebo puede ser una preparación líquida, una sólida o una semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en varios moldes y formas

adecuadas para la respectiva aplicación por ejemplo gránulos, bloques, palillos, discos. Los cebos líquidos se pueden llenar en varios dispositivos para asegurar aplicación apropiada, por ejemplo contenedores abiertos, dispositivos de reociado, fuentes de goteo, o fuentes de evaporación. Los geles se pueden basar en

5 matrices acuosas o aceitosas y se pueden formular para necesidades particulares en términos de viscosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

El cebo empleado en la composición es un producto que es suficientemente

10 atractivo para inducir insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc. o cucarachas a comerlo. Este atractivo se puede escoger de estimulantes de alimentación o para y/o feromonas sexuales. Estimulantes de alimentación adecuados se escogen, por ejemplo, de proteínas de animal y/o planta (carne-, pescado-, harina de sangre, partes de insecto, polvo de grillos,

15 yema de huevo), de las grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o aún melazas o miel, o de sales tales como sulfato de amonio, carbonato de amonio o acetato de amonio. Las partes frescas o decaídas de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de

20 estos también pueden servir como estimulantes alimenticios. Las feromonas se conocen por ser más específico a insecto. Las feromonas específicas se describen en la literatura y es conocida por aquellos expertos en la técnica.

Los compuestos de la fórmula I son también adecuados para la protección de las

25 semillas, propágulos, y raíces y brotes de semillero, preferiblemente las semillas, contra plagas del suelo y también para el tratamiento de semillas de planta que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido a mejora, que

52

incluye métodos de ingeniería genética.

Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen por ejemplo concentrados flotables FS, soluciones LS, polvos para tratamiento seco DS, 5 polvos dispersible en agua WS o gránulos para tratamiento en suspensión, polvos solubles en agua SS y emulsión ES. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de siembra, directamente en las semillas.

La aplicación de tratamiento de semilla de los compuestos de la fórmula I o 10 formulaciones que los contienen se lleva a cabo por rociado o espolvoreo a las semillas antes de siembra de las plantas y antes de emergencia de las plantas.

La invención también se relaciona con los productos de propagación de plantas, y especialmente las semillas tratadas que comprenden, recubrimiento con y/o que 15 contiene, un compuesto de la Fórmula I o una composición que comprende éste. El término "recubierto con y/o que contiene" generalmente significa que el ingrediente activo es para la mejor parte en la superficie del producto de propagación en el tiempo de aplicación, aunque una mayor o menor parte del ingrediente penetre en el producto de propagación, dependiendo del método de 20 aplicación. Cuando el dicho producto de propagación se (re)planta, este puede absorber el ingrediente activo.

La semilla comprende los compuestos o composiciones que los comprenden en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 k g de semilla.

25

Las composiciones de esta invención también pueden contener otros ingredientes activos, por ejemplo otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales

153

como nitrato de amonio, urea, potasa, y superfosfato, fitotxicantes y reguladores de crecimiento de la planta, aseguradores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales se pueden utilizar secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, si es apropiado también solo se agrega
5 antes de uso (mezcla del tanque). Por ejemplo, las plantas se pueden rociar con una composición de esta invención antes o después de ser tratada con otros ingredientes activos.

La siguiente lista de pesticidas junto con los compuestos de acuerdo con la
10 invención se pueden utilizar, se destinan para ilustrar las posibles combinaciones, pero no se impone ninguna limitación:

A.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-metilo, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinfos, diazinón, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, etión,
15 fenitrotión, fentión, isoxatión, malatión, metamidofos, metidatión, metil-paratión, mevinfos, monocrotofos, oxidometon-metilo, paraoxón, paratión, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidón, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfon;

20 A.2. Carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfan, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato;

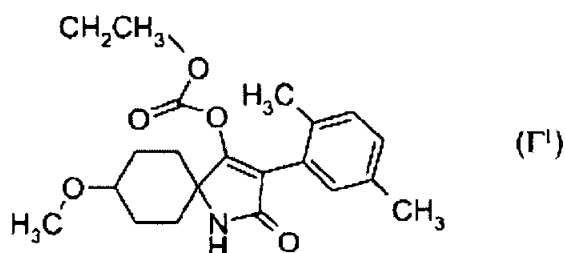
A.3. Piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina,
25 alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, praletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofen, tau-

154

fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina;

A.4. Reguladores de crecimiento: a) inhibidores de síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazurón, ciramazin, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexitiazox, etoxazol, clofentazina; b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenoza, tebufenozida, azadiractin; c) juvenoides: piriproxifen, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de biosíntesis de lípidos: espirodiclofen, espiromesifen, un derivado de ácido tetrónico de la Fórmula I¹,

10



A.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor de nicotina: clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid;

15

A.6. Compuestos antagonistas de GABA compuestos: acetoprol, endosulfan, etiprol, fipronilo, vaniliprol;

A.7. Insecticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad;

20

A.8. METI y acaricidas: fenazaquin, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad;

A.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnon;

A.10. Compuestos no acopladores: clorfenapir;

A.11. Compuestos inhibidores de fosforilación oxidativa: cihexatina, diafentiurón,
5 óxido de fenbutatin, propargita;

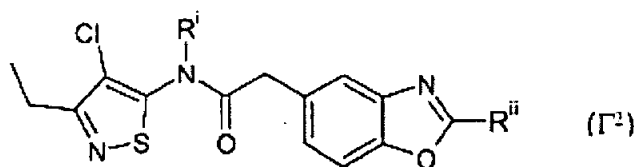
A.12. Compuestos interruptores de muda: criomazina;

A.13. Compuestos inhibidores de Función Oxidasa mezclados: butóxido de
10 piperonilo;

A.14. Compuestos bloqueadores de canal de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

A.15. Varios: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina,
15 azufre, tiociclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro-
α,α,α-tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α
-trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R''
es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, y los compuestos de aminoisotiazol de
la fórmula Γ^2 ,

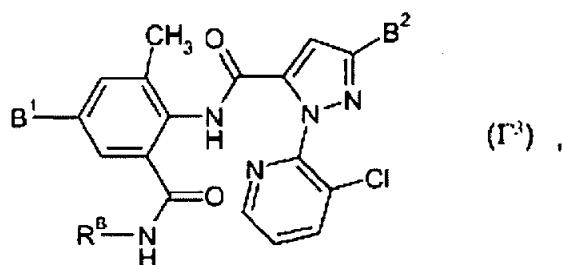
20



en donde Rⁱ es -CH₂OCH₂CH₃ o H y R'' es CF₂CF₂CF₃ o CH₂CH(CH₃)₃,
compuestos antranilamida de la fórmula Γ^3

25

LSB



en donde B¹ es hidrógeno, cloro o ciano, B² es un átomo de bromo o CF₃, y R^B es H, CH₃ o CH(CH₃)₂.

- 5 Algunas de las mezclas de los compuestos I con los anteriores pesticidas exhiben efectos pesticidas sinérgicos.

Los insectos se pueden controlar e poner en contacto el parásito/plaga objetivo, su fuente de alimento, hábitat, caldo de cultivo o su locus con una cantidad
10 pesticidamente efectiva de los compuestos de o composiciones de la Fórmula I.

“Locus” significa un hábitat, caldo de cultivo, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el que una plaga o parásito crece o puede crecer.

- 15 En general, “cantidad pesticidamente efectiva” significa la cantidad del ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable en el crecimiento, que incluye los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, u en otra forma disminuir la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad pesticidamente efectiva puede variar para los varios compuestos/composiciones
20 utilizados en la invención. Una cantidad pesticidamente efectiva de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones que prevalecen tales como efecto pesticida y duración, tiempo, especies objetivo, locus, modo de aplicación, y similares.

✓ 57

Los compuestos o composiciones de la invención también se pueden aplicar preventivamente a los sitios en los que la ocurrencia de plagas se espera.

Los compuestos de la fórmula I también se pueden utilizar para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por plagas al poner en contacto de la planta con una cantidad pesticidamente efectiva de los compuestos de la fórmula I. como tal, "poner en contacto" incluye contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente en la plaga y/o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y poner en contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

En el caso de tratamiento al suelo o de aplicación a las plagas lugar de vivienda o nido, la cantidad de ingrediente activo varía de 0.0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0.001 a 20 g por 100 m².

15

Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0.0001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0.001% en peso a 5 % en peso de compuesto activo La composición utilizada también puede comprender otros aditivos tales como un disolvente del material activo, un agente saborizante, un agente conservante, un tinte o un agente amargo. Sus atractivos también se pueden mejorar mediante un color, forma o textura especial.

20

Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la proporción de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0.1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.

25

Los compuestos de la fórmula I y composiciones que los comprenden también se pueden utilizar para controlar y prevenir infestaciones y infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (que incluyen humanos) y peces. Ellos son por ejemplo adecuados para controlar y prevenir infestaciones y infecciones

5 en mamíferos tales como ganado, ovejas, conejillos de indias, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamo y reno, y también en animales de peletería tales como visón, chinchilla y mapache, pájaros tales como gallinas, gansos, pavos y patos y pescados tal como peces de agua dulce o salada tales como trucha, carpa y

10 anguilas.

Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos picador, garrapatas, estro, garrapatas, moscas que muerden, muscoides, moscas, larvas de la mosca miasítica, niguas, sciaridas,

15 mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la fórmula I y composiciones que los comprenden son adecuados para control sistémico o no sistémico de ecto- y/o endoparásito. Ellos son activos contra todas o algunas etapas del desarrollo.

20

La administración se puede llevar a cabo profilácticamente o terapéuticamente. La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en la forma de preparaciones adecuadas, oralmente, tópicamente/dermicamente o parenteralmente.

25

Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I se pueden formular como alimentos para animales, premezclas de

alimento para animal, concentrados de alimento para animal, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, bebidas, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. En adición, los compuestos de fórmula I se pueden administrar a los animales en su agua de bebida para la administración oral, la forma de dosificación escogida se debe proporcionar al animal con 0.01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I, preferiblemente con 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

Alternativamente, los compuestos de fórmula I se pueden administrar a los animales parenteralmente, por ejemplo, mediante inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I se pueden dispersar o disolver en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I se pueden formular en un implante para administración subcutánea. En adición el compuesto de fórmula I se puede administrar transdérmicamente a los animales. Para administración 0.01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I

Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar tópicamente también a los animales en la forma de baños, polvillos, polvos, collares, medallones, rociadores, champús, formulaciones "spot-on" y unción dorsal continua y en ungüentos o emulsiones aceite-agua o agua-en aceite. Para aplicación tópica, baños y rociadores usualmente que contienen 0.5 ppm a 5,000 ppm y preferiblemente 1 ppm a 3,000 ppm del compuesto de fórmula I. En adición, los compuestos de fórmula I se pueden formular como etiquetas de oreja para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

Las preparaciones adecuadas son:

- Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de dilución, soluciones para uso en la piel o en cavidades del cuerpo, formulaciones de unción dorsal continua, geles;
- Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semi-sólidas;
- Formulaciones en las que el compuesto activo se procesa en una base de unguento o en una base de emulsión de aceite en -agua o agua en aceite;
- Las preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, glóbulos, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles y inhalantes, y artículos formados que contienen compuesto activo.

Generalmente es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg. Los compuestos activos también se pueden utilizar como una mezcla con siergistas o con otros compuesto activos que actúan contra los endo- y ectoparásito patogénicos.

En general, los compuestos de la fórmula I se aplican en una cantidad significativa parasíticamente efectiva, la cantidad del ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable en el crecimiento, que incluye los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, u otras formas de disminuir la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad parasíticamente

efectiva puede variar para los compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad parasiticidamente efectiva de las composiciones variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto parasítico deseado y duración, especies objetivo, modo de aplicación, y similares.

5

Ejemplos de Síntesis

Con la modificación debida de los compuestos de partida, los protocolos mostrados en los ejemplos de síntesis adelante se utilizan para obtener
10 adicionalmente compuestos I. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, se listan, en la Tabla I que sigue.

Los productos se caracterizan mediante Cromatografía Líquida de alto Desempeño acoplada /espectrometría de masa (HPLC/MS), por RMN o por sus
15 puntos de fusión.

Método HPLC 1: Columna HPLC analítica: columna RP-18 Chromolith Speed ROD de Merck KGaA, Alemania). Elución: acetonitrilo + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA) en un proporción de 5:95 a 95:5 en 5 minutos a 40° C. MS: Ionización de electrospray
20 cuadrupolo, 80 V (modo positivo)

Método HPLC 2: Columna HPLC analítica: Cartucho de Resolución Rápida Zorbax S-C18 (2.1 x 30 mm, 3.5 micrón). Elución: acetonitrilo/agua + 0.02% de ácido trifluoroacético en un proporción de 15:85 a 97:3 en 7 min a 40° C. MS: Ionización
25 de electrospray cuadrupolo, 80 V (modo positivo)

Las condiciones para HPLC preparativo son como sigue: columna Purospher Star

62

RP18e Hibar RT 75-25 (3 μ m), elución: acetonitrilo + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA) en un proporción de 20:80 a 100:0 en 13 minutos, detección por UV a 205 nm, 214 nm, 254 nm, 280 nm y 400 nm o por MS.

5

Ejemplo 1, compuesto 1-1: Preparación de 2-(3,4-dicloro-bencil)-2-trifluorometilsulfanilmetil-malononitrilo

A 1 13 mg (0.5 mmol) de 3,4-diclorobencilmalonodinitrilo y 138 mg (1.0 mmol) de
10 carbonato de potasio en 1 mL de dimetilformamida en un frasco de 8 mL se
agrega 53 μ l (75 mg, 0.5 mmol) de cloruro de trifluorometiltiometilo. La mezcla se
agita a aproximadamente 20 a 25° C durante 12 horas y luego se vierte en una
mezcla de dietiléter y agua. La capa acuosa se separa y se extrae dos veces más
con dietiléter (2 x 20 ml). Las fracciones de éter combinadas se secan utilizando
15 papel para separar fase y luego se concentra por rotoevaporación. El residuo se
purifica por HPLC preparativo para dar 79 mg (0.23 mmol, 46% de rendimiento) de
1-1.

Ejemplo 2, compuesto 1-7: Preparación de 2-(3,4-Dicloro-bencil)-2-(2-
20 trifluorometilsulfanil-etil)-malononitrilo

A 107 μ l (146 mg, 1 mmol) de trifluorometiltioetanol en un frasco de 8 mL poroso
con un tapón y salida de aguja se agrega 76 μ l (208 mg, 1 mmol) de bromuro de
tionilo. La mezcla se calienta a aproximadamente 60° C durante 20 min, y luego se
25 transfiere a un segundo frasco que contiene 1 13 mg (0.5 mmol) de 3,4-
diclorobencilmalonodinitrilo y 276 mg (2 mmol) de carbonato de potasio en 0.5 ml.
de dimetilformamida a aproximadamente 20 a 25° C. Después de 10 horas de

agitación, los contenidos del frasco se vierten en dietiléter y agua. La capa acuosa se separa y se extrae dos veces más con dietiléter. Las fracciones de éter combinadas se secan utilizando papel para separar fase y luego se concentra por rotoevaporación. El residuo se purifica por HPLC preparativo para dar 70 mg (0.2 mmol, 40% de rendimiento) del compuesto I-7.

Ejemplo 3, los compuestos 1-15 y compuestos 1-19. Preparación de 2-(3,4-Dicloro- bencil)-2-(2-trifluorometanosulfinil-etil)-malononitrilo (1-15) y 2-(3,4-Dicloro- bencil)-2-(2-trifluorometanosulfonil-etil)-malononitrilo (1-19)

Síntesis de p-toluenosulfonato de trifluorometilsulfiniletilo

A 1.46 gm (10 mmol) de trifluorometiltioetanol y 1.4 ml. (1.0 mg, 10 mmol) de trietilamina en 30 mL de diclorometano a 0° C se agrega 1.9 mg (10 mmol) de cloruro de p-toluenosulfonilo. La reacción luego se agita a 20 a 25° C durante 22 horas. La mezcla de reacción se lava dos veces con solución salina, y la capa orgánica se seca utilizando papel para separar fase. La remoción de disolvente por rotoevaporación y la purificación del producto crudo por cromatografía de columna flash en gel de sílice da 1.91 mg (6.36 mmol, 64% de rendimiento) de p-toluenosulfonato de trifluorometiltioetilo

A 600 mg (2.0 mmol) de p-toluenosulfonato de trifluorometiltioetilo en 10 ml. de diclorometano a 20 a 25° C se agrega 493 mg (2.2 mmol de perácido) de 77% de ácido m-cloroperbenzoico. Después de agitar durante aproximadamente 12 horas, la mezcla se lava con sulfito de sodio acuoso, bicarbonato de sodio acuoso, y la capa orgánica se seca utilizando papel para separar fase. La remoción de disolvente por rotoevaporación da 630 mg (2.0 mmol, 100% de rendimiento) de p-

toluenosulfonato de trifluorometilsulfiniletilo.

Ejemplo 3.1, compuesto I-15

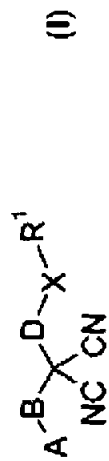
- 5 A 17 mg (0.52 mmol) de 3,4-diclorobencilmalonodinitrilo y 79 mg (0.57 mmol) de carbonato de potasio en 1 ml. de DMF se agrega 165 mg (0.52 mmol) de p-toluenosulfonato de trifluorometilsulfiniletilo. La mezcla se agita durante 12 horas a 35° C. Después de 21 horas, la mezcla de reacción se agrega a dietiléter y agua que contiene 50 µL de ácido fórmico. La fase acuosa se separa y se lava dos
- 10 veces con dietiléter. Las fracciones de éter combinadas se lavan con solución salina y se secan utilizando papel para separar fase. El disolvente se remueve por rotoevaporación, y el residuo se disuelve en 1 ml. de diclorometano y se filtra utilizando diclorometano (3 x 3 ml.) a través de una columna pequeña de gel de sílice. Después de concentración del eluado, 87 mg (0.24 mmol, 46% de
- 15 rendimiento) de I-15 se recupera como un sólido tostado, pf 122.5-129.5° C. El compuesto se debe recrystalizar a partir de acetonitrilo/hexano.

Ejemplo 3.2, compuesto I-19

- 20 A aproximadamente 92 mg (0.25 mmol) del compuesto I-15 en 2 ml. de diclorometano se agrega 200 mg (0.9 mmol de perácido) de 77% de ácido m-cloroperbenzoico. Después de agitar durante 12 horas, la mezcla de reacción se diluye con diclorometano y se lava con sulfito de sodio acuoso, bicarbonato de sodio acuoso. La capa orgánica se seca utilizando papel para separar fase. La
- 25 remoción del disolvente por rotoevaporación y la purificación de el residuo por HPLC preparativo da 75 mg (0.19 mmol, 76% de rendimiento) de I-19, pf. 164-169° C.

165

Tabla I

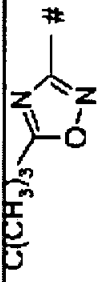
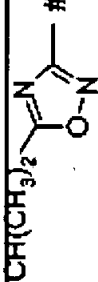
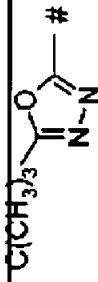
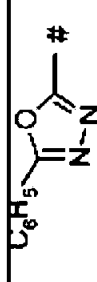
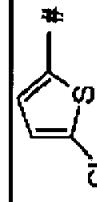
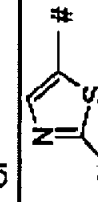
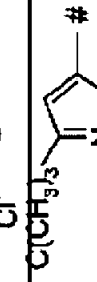


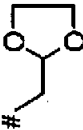
No.	A	B	D	X	R ¹	Datos físicos pf. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-1	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.61 min, m/z = 339 [M+H] ⁺
I-2	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.50 min, m/z = 339 [M+H] ⁺
I-3	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.61 min, m/z = 355 [M+H] ⁺
I-4	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.29 min, m/z = 305 [M+H] ⁺
I-5	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.65 min, ²⁾
I-6	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.66 min, m/z = 319 [M+H] ⁺ ²⁾
I-7	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.82 min, m/z = 353 [M+H] ⁺ ²⁾
I-8	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.29 min, m/z = 285 [M+H] ⁺
I-9	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	81-82°C
I-10	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.80 min, m/z = 369 [M+H] ⁺
I-11	4-SCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	40-44°C
I-12	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.77 min, m/z = 411 [M+H] ⁺
I-13	2,4,6-F ₃ -C ₆ H ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	88-96°C

166

No.	A	B	D	X	R ¹	Datos físicos pf. [°C]: HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-14	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	122-129°C
I-15	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 5.06 min, m/z = 369 [M+H] ⁺
I-16	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.07 min, m/z = 335 [M+H] ⁺
I-17	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.18 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-18	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 5.07 min, m/z = 385 [M+H] ⁺
I-19	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.44 min, m/z = 385 [M+H] ⁺
I-20	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 5.47 min, m/z = 401 [M+H] ⁺
I-21	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.17 min, m/z = 300 [M+H] ⁺
I-22	C ₆ H ₅	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O) ₂	CF ₃	RT = 4.76 min, m/z = 371 [M+H] ⁺
I-23	4-I-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S(=O)	CF ₃	RT = 4.95 min, m/z = 427 [M+H] ⁺
I-24	4-Br-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.66 min, m/z = 363 [M+H] ⁺
I-25	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 6.30 min, m/z = 341 [M+H] ⁺
I-26	4-CF(CF ₃) ₂ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 6.31 min, m/z = 453 [M+H] ⁺
I-27	2,6-Cl ₂ -pyrid-4-yl	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 5.32 min, m/z = 354 [M+H] ⁺
I-28		-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	S	CF ₃	RT = 3.89 min, m/z = 325 [M+H] ⁺

67

No.	A	B	D	X	R ¹	Datos físicos pf . [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-29		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.35 min, m/z = 333 [M+H] ⁺
I-30		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.03 min, m/z = 319 [M+H] ⁺
I-31		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 4.73 min, m/z = 333 [M+H] ⁺
I-32		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 4.89 min, m/z = 353 [M+H] ⁺
I-33		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 3.64 min ²⁾
I-34		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 3.28 min, m/z = 326[M+H] ⁺ ²⁾
I-35		-CH2-	-CH2CH2-	S	CF ₃	RT = 5.34 min, m/z = 332 [M+H] ⁺
I-36	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	62-63°C
I-37	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	RT = 4.92 min, m/z = 299 [M+H] ⁺
I-38	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH ₃	RT = 4.77 min, m/z = 283 [M+H] ⁺
I-39	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH2-	-CH2CH2-	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.57 min, m/z = 311 [M+H] ⁺

No.	A	B	D	X	R ¹	Datos físicos pf. [°C]; HPLC/MS (RT [min]; m/z [M+H] ⁺) ¹⁾
I-40	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.51 min, m/z = 328 [M+H] ⁺
I-41	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH(CH ₃) ₂	RT = 5.35 min, m/z = 311 [M+H] ⁺
I-42	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.17 min, m/z = 317 [M+H] ⁺
I-43	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.46 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-44	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	O	CH ₂ CF ₃	RT = 5.34 min, m/z = 351 [M+H] ⁺
I-45	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	#			RT = 4.43 min, m/z = 277 [M+H] ⁺
I-46	4-Cl-C ₆ H ₄	-CH ₂ -	-CH ₂ -	O	CH ₃	RT = 4.57 min, m/z = 235 [M+H] ⁺

¹⁾ a menos que se especifique de otra forma, el Método HPLC 2 se utiliza.

²⁾ el Método HPLC 1 se utiliza.

denota el sitio de unión.

Ejemplos para la acción contra plagas perjudiciales:

1. Actividad contra picudo del algodnero (*Anthonomus grandis*)

- 5 Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. 10 a 15 huevos se colocan en placas de microtítulo llenas con 2% de agar-agar en agua y 300 ppm de formalina. Los huevos se rocían con 20 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con hojas perforadas y se mantienen a 24-26° C y 75-85% de humedad con un ciclo día/noche durante 3 a 5 días. Se determina la mortalidad con base en
- 10 los huevos no incubados restantes o larvas sobre la superficie de agar y/o cantidad y profundidad de los canales de excavación originados por las larvas incubadas. Se replican las muestras 2 veces.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13,

15 I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-29, I-31, I-32, I-33, I-34, y I-43 a 2500 ppm muestran más de 75 % de mortalidad comparada con 0% de mortalidad de controles no tratados.

2. Actividad contra mosca de la fruta Mediterránea (*Ceratitis capitata*)

20

Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. 50 a 80 huevos se colocan en placas de microtítulo llenas con 0.5% de agar-agar y 14 % de dieta en agua. Los huevos se rocían con 5 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con hojas perforadas y se mantienen a 27-29 °C y 75-85% de humedad bajo luz

25 fluorescente durante 6 días. Se determina la mortalidad con base en la agilidad de las larvas incubadas. Se replican las muestras 2 veces.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-29, I-30, I-31, I-33, y I-34 a 2500 ppm muestran más de 75 % de mortalidad comparada con 0% de mortalidad de controles no tratados.

5

3. Actividad contra gusano bellotero del tabaco (*Heliotis virescens*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. 15 a 25 huevos se colocan en placas de microtítulo llenas con dieta. Los huevos se rocían con 10 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con hojas perforadas y se mantienen a 27-29° C y 75-85% de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. Se determina la mortalidad con base en la agilidad y de alimentación comparativa de las larvas incubadas. Se replican las muestras 2 veces.

4. Actividad contra el áfido la arveja (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. Discos de la hoja del haba se colocan en placas de microtítulo llenas con 0.8% de agar-agar y 2.5 ppm OPUS™. Los discos de hoja se rocían con 2.5 µl de la solución de prueba y 5 a 8 áfidos adultos se colocan en las placas de microtítulo que luego se cierran y se mantienen a 22-24° C y 35-45% de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. Se determina la mortalidad con base en los áfidos reproducidos, vitales. Se replican las muestras 2 veces.

En esta prueba, los compuestos I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-16, I-21, I-24, I-27, I-29, I-31, I-37, y I-42 a 2500 ppm muestran más de 75 % de mortalidad comparada con 0% de mortalidad de controles no tratados.

5. Actividad contra áfido dl trigo (*Rhopalosiphum padi*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. Un disco de hoja
5 Barlay se coloca en placas de microtítulo llenas con 0.8% de agar-agar y 2.5 ppm
OPUS™. Los discos de hoja se rocían con 2.5 µl de la solución de prueba y 3 a 8
áfidos adultos se colocan en las placas de microtítulo que luego se cierran y se
mantienen a 22-24° C y 35-45% de humedad bajo luz fluorescente durante 5 días.
Se determina la mortalidad con base en los áfidos vitales. Se replican las muestras
10 2 veces.

6. Actividad contra áfido de algodón (*Aphis gossypii*)

Los compuestos activos se formulan en 50:50 de acetona:agua y 100 ppm de
15 tensoactivo Kinetic™.

Las plantas de algodón en el estado cotiledón (una planta por pote) se infestan al
colocar una hoja pesadamente infestada de la colonia principal en la tapa de cada
cotiledón. Los áfidos se les permite transferir a la planta anfitriona durante la
20 noche, y la hoja utilizada para transferir los áfidos se remueve. Los cotiledones se
sumergen en la solución de prueba y se les permite secar. Después de 5 días, se
hacen los conteos de mortalidad.

7. Actividad contra gusano trozador (*Spodoptera eridania*), larvas de 2ª fase

25

Los compuestos activos se formulan para probar la actividad contra insectos y
arácnidos como 10.000 ppm de una solución en una mezcla de 35% de acetona y

F72

agua, que se diluye con agua, si se necesita.

Una hoja de frijol sieva se sumerge en la solución de prueba y se le permite secar. La hoja luego se coloca en un plato petri que contiene un papel filtro en la parte inferior y diez orugas de 2ª fase. En 5 días, se hacen observaciones mortalidad y alimentación reducida

8. Actividad contra hormiga Argentina (*Linepithema humile*), hormiga californiana (*Pogonomyrmex californicus*), hormiga acróbata (*Crematogaster* spp.), hormiga carpintero (*Camponotus floridanus*), hormiga de fuego (*Solenopsis invicta*), mosca doméstica (*Musca domestica*), mosca de los establos (*Stomoxys calcitrans*), moscón gris de la carne (*Sarcophaga* sp.), mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), mosquito doméstico (*Culex quinquefasciatus*), mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*), cucaracha (*Blattella Germanica*), piojo del gato (*Ctenocephalides felis*), y garrapata del perro (*Rhipicephalus sanguineus*) por vía contacto con vidrio

Se tratan frascos de vidrio con 0.5 mL de una solución de ingrediente activo en acetona y se le permite secar. Los insectos o garrapatas se colocan en cada frasco junto con algún suministro de humedad y alimento. Los frascos se mantienen a 22° C y se observan para los efectos de tratamiento en varios intervalos de tiempo.

9. Actividad contra larvas de mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), mosquito doméstico (*Culex quinquefasciatus*) y mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*) larvas por vía de tratamiento con agua

Se utilizan placas por pozo como arenas de prueba. El ingrediente activo se disuelve en acetona y se diluye con agua para obtener las concentraciones necesarias. Las soluciones finales que contiene aproximadamente 1 % de acetona se colocan en cada pozo. Aproximadamente 10 larvas de mosquito (4ª fase) en 1 ml agua se agregan a cada pozo. Las larvas se alimentan con una gota de polvo de hígado cada día. Los platos se cubren y se mantienen a 22° C. la mortalidad se registra diariamente y las larvas muertas y las crisálidas muertas o vivas se remueven diariamente. Al final de la prueba las larvas vivas restantes del ensayo se registran y se calcula el porcentaje de mortalidad.

10

10. Actividad contra saltador de hoja café (*nilaparvata lugens*)

Los compuestos activos se formulan en 50:50 de acetona:agua. Plántulas de arroz colocadas en maceta se rocían con 10 ml de la solución de prueba, se secan al aire, se colocan en jaulas y se inoculan con 10 adultos. Se registra e porcentaje de moraliad después de 24, 72 y 120 horas.

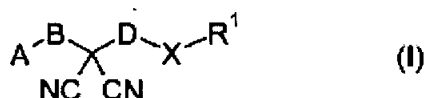
15

En esta prueba, compuesto I-35 en 300 ppm muestra más de 90% de mortalidad.

1774

REIVINDICACIONES

1. Los compuestos de la fórmula I



en donde

X es oxígeno o S(=O)_n;

10 n es 0,1 o 2;

R¹ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆,

15 fenilo o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático está unido al átomo X por vía de un átomo de carbono del anillo, y cuyo anillo fenilo o heteroaromático puede estar unido
20 por vía de una porción alquilo C₁-C₁₀ así formando una porción aril-alquilo C₁-C₁₀ o hetaril-alquilo C₁-C₁₀,

25 en donde fenilo o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

en donde los átomos de hidrógeno en los anteriores grupos R^1 pueden ser parcialmente o totalmente reemplazados por cualquier combinación de los grupos R^5 .

5

A es $-NR^b_2$, $-C(=G)GR^b$, $-C(=G)NR^b_2$, $-C(=NOR^b)R^b$, $C(=G)[N=SR^b_2]$, $-C(=G)NR^b-NR^b_2$, en donde dos grupos R^b juntos pueden formar un alcandiilo C_2-C_3 , alquenediilo C_2-C_3 o alquilo C_1-C_3 -G-alquilo C_1-C_3 de puente que se puede sustituir por 1 a 5 grupos R^2 ,

10

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7- miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

15

en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionado de oxígeno, nitrógeno y azufre,

20

en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden sustituir o no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

25

B es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 3 átomos en la cadena carbono, en donde los átomos de hidrógeno

136

de esta cadena pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R³;

D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 5 átomos en la cadena carbono o Cicloalquilo C₃-C₆, en donde los átomos de hidrógeno de esta cadena o de este cicloalquilo pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R⁴;

R² es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₃-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalqueniloxi C₃-C₆, halocicloalquiloxi C₃-C₆, halocicloalqueniloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, halocicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquenilsulfinilo C₂-C₆, alquinilsulfinilo C₃-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquenilsulfinilo C₂-C₆, haloalquinilsulfinilo C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquenilsulfonilo C₂-C₆, alquinilsulfonilo C₃-C₆, haloalquinilsulfonilo C₁-C₆, haloalquenilsulfonilo C₂-C₆, haloalquinilsulfonilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, alquenilamino C₂-C₆, alquinilamino C₂-C₆, di(alquil C₁-C₆)amino, di(alquenil C₂-C₆)amino, di(alquinil C₂-C₆)amino, tri(C₁-C₁₀)alquilsililo, o

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a

172

6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre o un grupo alquilo C₁-C₄,

5

en donde los grupos anteriores R² no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a, o

10

R² es -C(=G)R^b, -C(=G)OR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=G)[N=SR^b₂], -C(=NOR^b)R^b, -C(=NOR^b)NR^b₂, -C(=NNR^b₂)R^b, -OC(=G)-OC(=G)OR^b, N=SR^b₂, -NR^bC(=G)R^b, -N[C(=G)R^b]₂, -NR^bC(=G)OR^b, -C(=G)NR^b-NR^b₂, -C(=G)NR^b-NR^b [C(=G)R^b], -NR^b-C(=G)NR^b₂, -NR^b-NR^bC(=G)R^b, -NR^b-N[C(=G)R^b]₂, -N[(C=G)R^b]-NR^b₂, -NR^b-NR^b[(C=G)GR^b], -NR^b[(C=G)NR^b₂], -NR^b[C=NR^b]R^b, -NR^b(C=NR^b)NR^b₂, -O-NR^b₂, -O-NR^b(C=G)R^b, -SO₂NR^b₂, -NR^bSO₂R^b, -S(=O)R^b, -S(=O)₂R^b, -SO₂OR^b, o -OSO₂R^b;

15

R³ es halógeno, ciano, amino, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₃-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₃, alquiniloxi C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₃-C₆, o

20

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de

25

oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo fenilo o heteroaromático o heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre, o

2 grupos R^3 junto con el átomo de carbono de la cadena de hidrocarburo pueden formar un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno,

en donde los grupos anteriores R^3 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

R^4 es halógeno, ciano, amino, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , alcoxicarbonilo C_1-C_6 , alqueniloxicarbonilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , di(alquil C_1-C_6)amino, tri(C_1-C_{10})alquilsililo, o

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático o heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre,

179

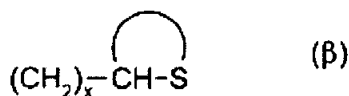
en donde los grupos anteriores R^4 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

- 5 la porción R^4 -D-X- R^1 juntos pueden formar un anillo saturado o insaturado de la Fórmula α



- que puede tener un anillo de 5 a 7 miembros y además de azufre 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno y
10 cuyo anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos seleccionados de R^a , o

la porción R^4 -D-X- R^1 juntos pueden formar un grupo de la Fórmula β en donde x es 1 a 5



- 15 que contiene un anillo saturado o insaturado que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además de azufre 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno y cuyo anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos seleccionados de R^a ;

- 20 R^5 es un grupo R^3 ;

G es oxígeno o azufre;

- R^a es cada uno independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_6 ,
25 haloquilo C_1 - C_6 , alquenilo C_2 - C_6 , haloalquenilo C_2 - C_6 , alquinilo C_2 - C_6 ,

haloalquinilo C₂-C₆-, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₆-, halocicloalquenilo C₃-C₈, fenoxi, ORⁱ, SRⁱ, S(=O)Rⁱ, S(=O)₂Rⁱ, NRⁱR^j, -S(=O)₂NRⁱR^j, C(=O)Rⁱ, C(=O)ORⁱ, C(=O)NRⁱR^j, C(=NORⁱ)R^j, -NRⁱC(=G)R^j, -N[C(=G)Rⁱ]₂, -NRⁱC(=G)OR^j, -C(=G)NRⁱ-NR^j₂, -NRⁱSO₂R^j, SiRⁱ_yR^j_{3-y} (y es 0 a 3), o

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se pueden sustituir con 1 a 5 halógenos;

Rⁱ, R^j son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆-, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₆, o halocicloalquenilo C₃-C₆;

R^b es cada uno independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆-, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, o halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, o

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático se puede unir por vía una porción alquilo C₁-C₄, y en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se

puede sustituir con 1 a 3 grupos R^a ;

o los enantiómeros o diastereómeros o sales o N-óxidos o polimorfos de estos.

5

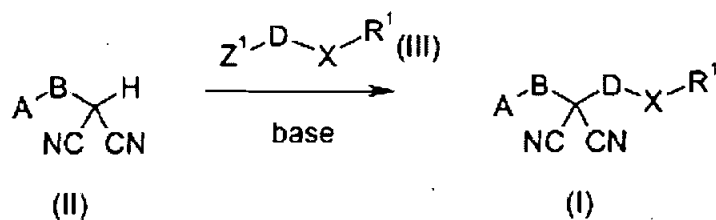
2. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con reivindicación 1 en donde X es oxígeno o azufre.

10

3. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con reivindicaciones 1 o 2 en donde D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con 2 a 4 átomos en la cadena carbono.

15

4. Un proceso para la preparación de los compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 que comprende hacer reaccionar compuestos (II) con el compuesto (III) en la presencia de una base para dar compuestos (I)



20

en donde A, B, D, X y R^1 son como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 para los compuestos de la fórmula I y Z^1 representa un grupo saliente adecuado.

5. Uso de los compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 para combatir insectos, ácaros, o nemátodos.

25

6. Un método para el control de insectos, ácaros o nemátodos al poner en contacto el insecto, ácaro o nemátodo o su suministro de alimento, hábitat, caldo de cultivo o su locus con una cantidad pesticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3.

7. Un método para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por insectos, ácaros o nemátodos al aplicar a las plantas, o al suelo o agua en el que ellas crecen, una cantidad pesticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3.

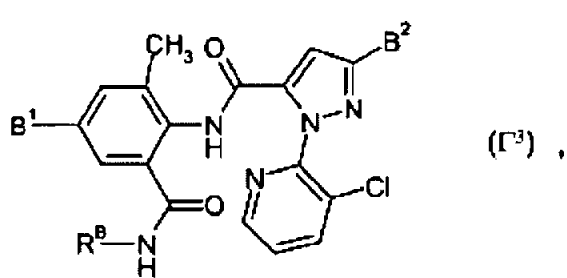
8. Un método para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende administrar oralmente, tópicamente o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad parasiticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 o sus enantiómeros o sales veterinariamente aceptables.

9. Un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 o sus enantiómeros o sales veterinariamente aceptables.

10. Composiciones que comprenden una cantidad pesticida o parasiticidamente activa de los compuestos de la fórmula I como se definió en las

reivindicaciones 1 a 3 y un portador agronómica o veterinariamente aceptable.

11. Mezclas sinérgicas que comprenden un compuesto de la Fórmula I y un
5 pesticida seleccionado de los organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores de crecimiento, neonicotinoides, compuestos agonistas/antagonistas, del receptor nicotínico, compuestos antagonistas de GABA, insecticidas de lactona macrocíclica, acaricidas compuestos METI I, METI II y III, compuestos inhibidores de fosforilación oxidativa, compuestos
10 que interrumpen la muda, compuesto inhibidor de función oxidasa, compuestos bloqueadores de canal de sodio, benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-
15 hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, y compuestos de antranilamida de la fórmula Γ^3



20 en donde B¹ es hidrógeno, cloro o ciano, B² es un átomo de bromo o CF₃, y R^B es H, CH₃ o CH(CH₃)₂.

BY

COMPUESTOS DE MALONITRILO

RESUMEN

5 Los compuestos de la fórmula I en donde X es O o S(=O)_n; n es 0,1 o 2; R¹ es alquilo opcionalmente SUSTITUIDO, haloalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, cicloalquenilo, halocicloalquenilo, fenilo, hetarilo, fenilalquilo, hetaril alquilo, opcionalmente fusionado a fenilo, hetarilo o heterociclilo; A es -NR^b₂, -C(=G)GR^b, -C(=G)NR^b₂, -
10 C(=NOR^b)R^b, C(=G)[N=SR^b₂], -C(=G)NR^b-NR^b₂, alcandiilo C₂-C₆, alquenediilo C₂-C₆, alquilo C₁-C₃-G- -alquilo C₁-C₃, en donde R^b es como se define en la descripción, o fenilo opcionalmente sustituido, hetarilo, heterociclilo, opcionalmente fusionado a fenilo o heterociclilo; B es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada opcionalmente sustituida con 1 a 3 átomos en
15 la cadena carbono; D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada opcionalmente sustituida con 1 a 5 átomos en la cadena carbono o cicloalquilo C₃-C₆; G es oxígeno o azufre; o los enantiómeros o diastereómeros o sales o N-óxidos de estos, procesos para preparar el compuesto I, composiciones pesticidas y mezclas sinérgicas que comprenden compuestos I, métodos para el
20 control de insectos, ácaros o nemátodos al poner en contacto la plaga o su suministro de alimento, hábitat o caldos de cultivo con una cantidad pesticidamente efectiva de los compuestos formula I, y un método para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende administrar oralmente, tópicamente o parenteralmente o
25 aplicar a los animales una cantidad parasiticidamente efectiva de los compuestos de la fórmula I.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2006/069686

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. A01N37/34 A01N43/40 A01N43/52 A01N47/02 C07C255/37
C07C317/10 C07C321/20 C07D213/67 C07D271/06 C07D277/32
C07D317/32 C07D333/28

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)

A01N C07C 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, CHEM ABS 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 93/23385 A (FISONS PLC [GB]) 25 November 1993 (1993-11-25) example 4c	1-4,9
X	----- DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; YOKOZAWA, TSUTOMU ET AL: "Spontaneous addition of active methine compounds to enol ethers and .alpha.,.beta.-unsaturated ketones in aprotic polar solvent" XP002426531 retrieved from STN Database accession no. 2000:141061 abstract & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, 65(6), 1895-1897 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 2000, ----- -/--	1-4,9

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 March 2007

Date of mailing of the international search report

10/04/2007

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Cooper, Simon

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/069686

186

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SWARINGEN, ROY A., JR. ET AL: "Reaction of orthoformates with acidic methines" XP002426532 retrieved from STN Database accession no. 1980:22462 abstract & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, 44(26), 4825-9 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 1979, -----	1-4,9
X	EP 1 555 259 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]) 20 July 2005 (2005-07-20) cited in the application claims 8-10 -----	1-11
A	DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HOSOKAWA, AKEMI ET AL: "Malononitrile derivatives and herbicides containing them" XP002426533 retrieved from STN Database accession no. 1998:76233 abstract & JP 10 029966 A (MITSUBISHI CHEMICAL INDUSTRIES LTD., JAPAN) 3 February 1998 (1998-02-03) -----	1-4,6-10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2006/069686

Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

- 1. ☒ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Although claim 8 is directed to a method of treatment of the animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound/composition.
- 2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
- 3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

- 1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
- 2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
- 3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
- 4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/069686

588

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9323385	A	25-11-1993	NONE	
EP 1555259	A	20-07-2005	CN 1648122 A	03-08-2005
JP 10029966	A	03-02-1998	NONE	

189

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT**NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE**(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

ISENBRUCK, Günter
Isenbruck, Bösl, Hörschler, Wichmann, Huhn
Theodor-Heuss-Anlage 12
68165 Mannheim
ALLEMAGNEDate of mailing (day/month/year)
11 April 2008 (11.04.2008)Applicant's or agent's file reference
B05/1207PCInternational application No.
PCT/EP2006/069686**IMPORTANT NOTIFICATION**International filing date (day/month/year)
13 December 2006 (13.12.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☐ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
67056 Ludwigshafen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☒ the name ☐ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address

BASF SE
67056 Ludwigshafen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Nissen Diana

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail Diana.Nissen@wipo.int

Telephone No. +41 22 338 80 54

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNEDate of mailing (day/month/year)
13 November 2007 (13.11.2007)Applicant's or agent's file reference
0000057450International application No.
PCT/EP2006/069686

IMPORTANT NOTIFICATION

International filing date (day/month/year)
13 December 2006 (13.12.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representativeName and Address
HOFMANN, Michael
Lutherstr. 2
67059 Ludwigshafen
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residenceName and Address
HOFMANN, Michael
Traminerweg 1
67098 Bad Dürkheim
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☒ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Sanson Eric

Facsimile No. +41 22 338 70 80

e-mail pt11.pct@wipo.int

Telephone No. +41 22 338 74 11

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNEDate of mailing (day/month/year)
13 November 2007 (13.11.2007)Applicant's or agent's file reference
0000057450

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP2006/069686International filing date (day/month/year)
13 December 2006 (13.12.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representativeName and Address
POHLMAN, Matthias
Bluntschlistr. 16
69115 Heidelberg
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residenceName and Address
POHLMAN, Matthias
Jahnstrasse 8
67251 Freinsheim
GermanyState of Nationality
DEState of Residence
DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☒ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Sanson Eric

Facsimile No. +41 22 338 70 80

e-mail pt11.pct@wipo.int
Telephone No. +41 22 338 74 11

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year)

13 March 2007 (13.03.2007)

Applicant's or agent's file reference

0000057450

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP2006/069686

International filing date (day/month/year)

13 December 2006 (13.12.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant☒ the inventor☐ the agent☐ the common representative

Name and Address

HOKAMA, Takeo
707 Continental Circle, Apt. 625
Mountain View, CA 94040
United States of America

State of Nationality

State of Residence

US

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person☐ the name☐ the address☒ the nationality☐ the residence

Name and Address

HOKAMA, Takeo
707 Continental Circle, Apt. 625
Mountain View, CA 94040
United States of America

State of Nationality

US

State of Residence

US

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office☒ the International Searching Authority☐ the International Preliminary Examining Authority☐ the designated Offices concerned☐ the elected Offices concerned☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Forax Richard

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Facsimile No. +41 22 338 70 80

Telephone No. +41 22 338 81 99

193

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BASF Aktiengesellschaft
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year)

13 March 2007 (13.03.2007)

Applicant's or agent's file reference

0000057450

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP2006/069686

International filing date (day/month/year)

13 December 2006 (13.12.2006)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant☒ the inventor☐ the agent☐ the common representative

Name and Address

PALMER, Christopher
2094 Walnut Grove Avenue
San Jose, CA 95128
United States of America

State of Nationality

State of Residence

US

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person☐ the name☐ the address☒ the nationality☐ the residence

Name and Address

PALMER, Christopher
2094 Walnut Grove Avenue
San Jose, CA 95128
United States of America

State of Nationality

GB

State of Residence

US

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office☒ the International Searching Authority☐ the International Preliminary Examining Authority☐ the designated Offices concerned☐ the elected Offices concerned☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Forax Richard

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Facsimile No. +41 22 338 70 80

Telephone No. +41 22 338 81 99

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 B05/1207PC		FOR FURTHER ACTION		See Form PCT/PEA/416
International application No. PCT/EP2006/069686		International filing date (day/month/year) 13.12.2006		Priority date (day/month/year) 22.12.2005
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC INV. A01N37/34				
Applicant BASF Aktiengesellschaft				
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 <u>4</u> 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 <u>12</u> 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 607 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 2007-10-16		Date of completion of this report 07.04.2008		
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465		Authorized officer Cooper, Simon Telephone No. +49 89 2399-8323		

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2006/069686

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

1-12, 14-59	as originally filed
13, 60-62	filed with telefax on 21.12.2007

Claims, Numbers

1-13	filed with telefax on 21.12.2007
------	----------------------------------

- ☐ 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*):

5. ☐ This opinion has been established taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 70.2 (e)).

196

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2006/069686

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	<u>1-13</u>
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	<u>1-13</u>
	No: Claims	
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	<u>1-13</u>
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

(9)

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

International application No.

PCT/EP2006/069686

D6 = WO-02/090320

Section V.

- 1). The compounds according to the present application differ from those according to D6 in that R3 of the compounds according to D6 can not accommodate the compulsory chalcogen atom represented by X in the present compounds. The subject-matter of the claims is thus novel over D6.
- 2). The object of the present application is seen in the provision of pesticidal compounds having an improved pesticidal activity as compared to those according to D6. A comparative test has been filed which shows that the insertion of the chalcogen atom X into the compounds of D6 achieves this effect. That a change of this order of magnitude leads to an improved effect could not be predicted in advance. The present claims are thus seen as being based on an inventive step.
- 3). Claim 10 relates to a subject-matter considered by this Authority to be covered by the provision of Rule 39.1(iv)/67.1(iv) PCT. The patentability can be dependent upon the formulation of the claims. The EPO, for example, does not recognise as patentable claims to the use of a compound in medical treatment, but may allow claims to a product, in particular substances or compositions for use in a first or further medical treatment.

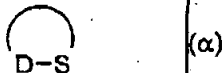
13

- A 5- or 6-membered heteroaromatic ring which contains 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur may be a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, such as pyrrol, pyrazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, thiazol, isothiazol, thiodiazol; or a 5-membered heteroaromatic ring containing 1 heteroatom selected from oxygen and sulfur, such as furane or thiophen; or a 6-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 to 2 further heteroatoms independently selected from oxygen, nitrogen and sulfur, preferably from nitrogen, such as pyridine, pyrazine, pyrimidine, pyridazine or triazine.
- When fused to a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, this fused ring system is e.g. pyrimidotriazolyl.

- A 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen is e.g. a 5- to 7-membered heteroaromatic ring containing 1 nitrogen atom and 0 or 1 further heteroatoms independently selected from oxygen and nitrogen, such as morpholine, piperazin, piperidine, or pyrrolidine.
- When fused to a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, this fused ring system is e.g. indoline.

- Phenyl which is fused to phenyl or a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur is e.g. naphthalin, benzoxazolyl, benzthiazolyl, benzimidazolyl, benzoxadiazolyl, or benzthiadiazolyl.

The saturated or unsaturated ring of formula α



- which may have 5 to 7 ring members and besides X 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen, e.g. is furanyl, thiophenyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydrothiophenyl, tetrahydrothiophenyl oxide or tetrahydrothiophenyl dioxide.

The group of formula β



- which contains a saturated or unsaturated ring which may have 5 to 7 ring members and besides X 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen e.g. is $\text{-CH}_2\text{-furanyl}$, $\text{-CH}_2\text{-thiophenyl}$, $\text{-CH}_2\text{-tetrahydrofuranyl}$, $\text{-CH}_2\text{-tetrahydrothiophenyl}$, $\text{-CH}_2\text{-tetrahydrothiophenyl oxide}$, $\text{-CH}_2\text{-tetrahydrothiophenyl dioxide}$, $\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-furanyl}$, $\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-thiophenyl}$, $\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-tetrahydrofuranyl}$, $\text{-(CH}_2\text{)}_2\text{-}$

199

60

Examples for the action against harmful pests:

1. Activity against Boll weevil (*Anthonomus grandis*)

5 The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. 10 to 15 eggs were placed into microtiterplates filled with 2% agar-agar in water and 300 ppm formaline. The eggs were sprayed with 20 µl of the test solution, the plates were sealed with pierced foils and kept at 24-26°C and 75-85% humidity with a day/night cycle for 3 to 5 days. Mortality was assessed on the basis of the remaining unhatched eggs or larvae on the agar surface and/or quantity and depth of the digging channels caused by the hatched larvae. Tests were replicated 2 times.

15 In this test, compounds I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-29, I-31, I-32, I-33, I-34, and I-43 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

2. Activity against Mediterranean fruitfly (*Ceratitis capitata*)

20 The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. 50 to 80 eggs were placed into microtiterplates filled with 0.5% agar-agar and 14 % diet in water. The eggs were sprayed with 5 µl of the test solution, the plates were sealed with pierced foils and kept at 27-29°C and 75-85% humidity under fluorescent light for 6 days. Mortality was assessed on the basis of the agility of the hatched larvae. Tests were replicated 2 times.

25 In this test, compounds I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-29, I-30, I-31, I-33, and I-34 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

30

3. Activity against Tobacco budworm (*Heliothis virescens*)

35 The active compounds are formulated in 1:3 DMSO : water. 15 to 25 eggs are placed into microtiterplates filled with diet. The eggs are sprayed with 10 µl of the test solution, the plates are sealed with pierced foils and kept at 27-29°C and 75-85% humidity under fluorescent light for 6 days. Mortality is assessed on the basis of the agility and of comparative feeding of the hatched larvae. Tests are replicated 2 times.

4. Activity against Vetch aphid (*Megoura viciae*)

40

The active compounds were formulated in 1:3 DMSO : water. Bean leaf disks were placed into microtiterplates filled with 0.8% agar-agar and 2.5 ppm OPUS™. The leaf

61

disks were sprayed with 2.5 µl of the test solution and 5 to 8 adult aphids were placed into the microtiterplates which were then closed and kept at 22-24°C and 35-45% under fluorescent light for 6 days. Mortality was assessed on the basis of vital, reproduced aphids. Tests were replicated 2 times.

5

In this test, compounds I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-16, I-21, I-24, I-27, I-29, I-31, I-37, and I-42 at 2500 ppm showed over 75 % mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

10 5. Activity against Wheat aphid (*Rhopalosiphum padi*)

The active compounds are formulated in 1:3 DMSO : water. Barley leaf disk are placed into microtiterplates filled with 0.8% agar-agar and 2.5 ppm OPUS™. The leaf disks are sprayed with 2.5 µl of the test solution and 3 to 8 adult aphids are placed into the microtiterplates which are then closed and kept at 22-24°C and 35-45% humidity under fluorescent light for 5 days. Mortality is assessed on the basis of vital aphids. Tests are replicated 2 times.

15

20 6. Activity against Cotton aphid (*Aphis gossypii*)

20

The active compounds are formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic™ surfactant.

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

25

30 7. Activity against Southern armyworm (*Spodoptera eridania*), 2nd instar larvae

The active compounds are formulated for testing the activity against insects and arachnids as a 10.000 ppm solution in a mixture of 35% acetone and water, which is diluted with water, if needed.

35

A Sieva lima bean leaf is dipped in the test solution and allowed to dry. The leaf is then placed in a petri dish containing a filter paper on the bottom and ten 2nd instar caterpillars. At 5 days, observations are made of mortality and reduced feeding.

40 8. Activity against Argentine ant (*Linepithema humile*), harvester ant (*Pogonomyrmex californicus*), acrobat ant (*Cremafogaster spp.*), carpenter ant (*Camponotus floridanus*), fire ant (*Solenopsis invicta*), house fly (*Musca domestica*), stable fly (*Stomoxys calci-*

62

trans), flesh fly (*Sarcophaga sp.*), yellowfever mosquito (*Aedes aegyptii*), house mosquito (*Culex quinquefasciatus*), malaria mosquito (*Anopheles albimanus*), German cockroach (*Blattella Germanica*), cat flea (*Ctenocephalides felis*), and brown dog tick (*Rhipicephalus sanguineus*) via glass contact

5

Glass vials are treated with 0.5 ml of a solution of active ingredient in acetone and allowed to dry. Insects or ticks are placed into each vial together with some food and moisture supply. The vials are kept at 22 °C and are observed for treatment effects at various time intervals.

10

9. Activity against yellowfever mosquito (*Aedes aegyptii*), house mosquito (*Culex quinquefasciatus*) and malaria mosquito (*Anopheles albimanus*) larvae via water treatment

15

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

20

10. Activity against brown planthopper (*nilaparvata lugens*)

25

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water. Potted rice seedlings were sprayed with 10 ml test solution, air dried, placed in cages and inoculated with 10 adults. Percent mortality was recorded after 24, 72 and 120 hours.

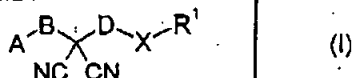
In this test, compound I-35 at 300 ppm showed over 90% mortality.

30

63

Amended Claims:

1. Compounds of formula I



5 wherein

X is oxygen or S(=O)_n;

10 n is 0, 1 or 2;

R¹ is C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl,15 phenyl or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring is bonded to the X atom via a carbon atom of the ring, and which phenyl or which heteroaromatic ring may be bonded via a C₁-C₁₀-alkyl group thus forming an aryl-C₁-C₁₀-alkyl or hetaryl-C₁-C₁₀-alkyl moiety,

20 wherein phenyl or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

25 wherein the hydrogen atoms in the above groups R¹ may be partially or in total be replaced by any combination of groups R⁵.30 A is -NR^b₂, -C(=G)GR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=NOR^b)R^b, C(=G)[N=SR^b₂], -C(=G)NR^b-NR^b₂, wherein two groups R^b together may form a C₂-C₆-alkandiyl, C₂-C₆-alkenediyl or C₁-C₃-alkyl-G-C₁-C₃-alkyl bridge which may be substituted by 1 to 5 groups R²,

35 phenyl or a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

40 wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3

203

64

heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

wherein phenyl or the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or substituted by any combination of 1 to 6 groups R².

B is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 3 carbon chain atoms, wherein the hydrogen atoms of this chain may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R³;

D is a saturated or partially unsaturated hydrocarbon chain with one to 5 carbon chain atoms or C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the hydrogen atoms of this chain or of this cycloalkyl may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R⁴;

R² is halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₃-C₆-cycloalkyloxy, C₃-C₆-cycloalkenyloxy, C₃-C₆-halocycloalkyloxy, C₃-C₆-halocycloalkenyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₃-C₆-cycloalkylthio, C₃-C₆-halocycloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₂-C₆-alkenylsulfinyl, C₃-C₆-alkynylsulfinyl, C₁-C₆-haloalkylsulfinyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfinyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₃-C₆-alkynylsulfonyl, C₁-C₆-haloalkylsulfonyl, C₂-C₆-haloalkenylsulfonyl, C₃-C₆-haloalkynylsulfonyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkynylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₂-C₆-alkenyl)amino, di(C₂-C₆-alkynyl)amino, tri(C₁-C₁₀)alkylsilyl, or

phenyl or a 5- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl and which heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom or a C₁-C₄-alkyl-group,

wherein the above groups R² are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a, or

65

5

R² is -C(=G)R^b, -C(=G)OR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=G)[N=SR^b₂], -C(=NOR^b)R^b, -C(=NOR^b)NR^b₂, -C(=NNR^b₂)R^b, -OC(=G)-OC(=G)OR^b, N=SR^b₂, -NR^bC(=G)R^b, -N[C(=G)R^b]₂, -NR^bC(=G)OR^b, -C(=G)NR^b-NR^b₂, -C(=G)NR^b-NR^b [C(=G)R^b], -NR^b-C(=G)NR^b₂, -NR^b-NR^bC(=G)R^b, -NR^b-N[C(=G)R^b]₂, -N[(C=G)R^b]-NR^b₂, -NR^b-NR^b[(C=G)GR^b], -NR^b[(C=G)NR^b₂], -NR^b[C=NR^b]R^b, -NR^b(C=NR^b)NR^b₂, -O-NR^b₂, -O-NR^b(C=G)R^b, -SO₂NR^b₂, -NR^bSO₂R^b, -S(=O)R^b, -S(=O)₂R^b, -SO₂OR^b, or -OSO₂R^b;

10

R³ is halogen, cyano, amino, C₁-C₁₀-alkyl, C₁-C₁₀-haloalkyl, C₂-C₁₀-alkenyl, C₂-C₁₀-haloalkenyl, C₂-C₁₀-alkynyl, C₃-C₁₀-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, or

15

20

phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl or which heterocyclic or heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom, or

25

2 groups R³ together with the carbon atom of the hydrocarbon chain may form a 3- to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen,

30

wherein the above groups R³ are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a, or

35

R⁴ is halogen, cyano, amino, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₃-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₃-C₆-haloalkynyloxy, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkenyloxy carbonyl, C₁-C₆-alkylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, tri(C₁-C₁₀)alkylsilyl, or

40

phenyl or a 5-to 7-membered saturated or partially unsaturated heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from

205

66

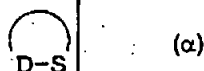
oxygen, sulfur and nitrogen or a 5- to 6-membered heteraromatic ring system which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which phenyl and which heterocyclic or heteroaromatic ring may be bonded via an oxygen or a sulfur atom,

5

wherein the above groups R^4 are unsubstituted, or the hydrogen atoms in these groups may all or in part be replaced with any combination of groups selected from R^a , or

10

the moiety $R^4-D-X-R^1$ together may form a saturated or unsaturated ring of formula α



15

which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a , or

the moiety $R^4-D-X-R^1$ together may form a group of formula β wherein x is 1 to 5,



20

containing a saturated or unsaturated ring which may have 5 to 7 ring members and besides sulfur 1 to 2 further heteroatoms selected from oxygen, sulfur and nitrogen and which ring may be substituted with 1 to 5 groups selected from R^a ;

25

R^5 is a group R^3 ;

G is oxygen or sulfur;

30

R^a is each independently halogen, cyano, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_2 - C_6 -haloalkynyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -halocycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkenyl, C_3 - C_6 -halocycloalkenyl, phenoxy, OR^1 , SR^1 , $S(=O)R^1$, $S(=O)_2R^1$, NR^1R^1 , $-S(=O)_2NR^1R^1$, $C(=O)R^1$, $C(=O)OR^1$, $C(=O)NR^1R^1$, $C(=NOR^1)R^1$, $-NR^1C(=G)R^1$, $-N[C(=G)R^1]_2$, $-NR^1C(=G)OR^1$, $-C(=G)NR^1-NR^1_2$, $-NR^1SO_2R^1$, $SIR^1R^1_{3-y}$ (y is 0 to 3), or

35

phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,

40

67

wherein the carbon atoms in phenyl or in the heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 5 halogens;

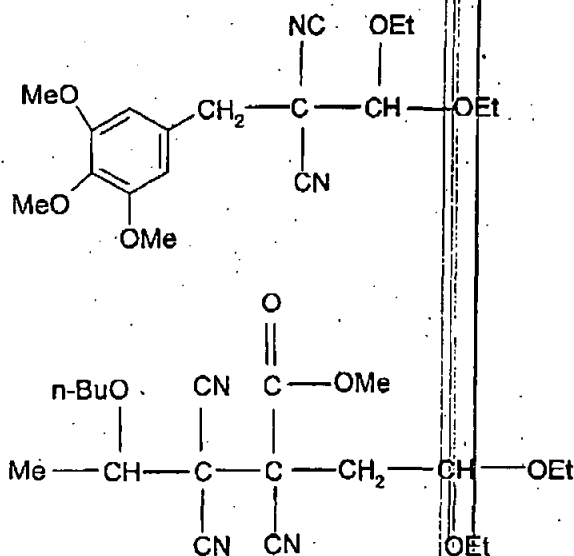
R^a, R^b are each independently hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, or C₃-C₆-halocycloalkenyl;

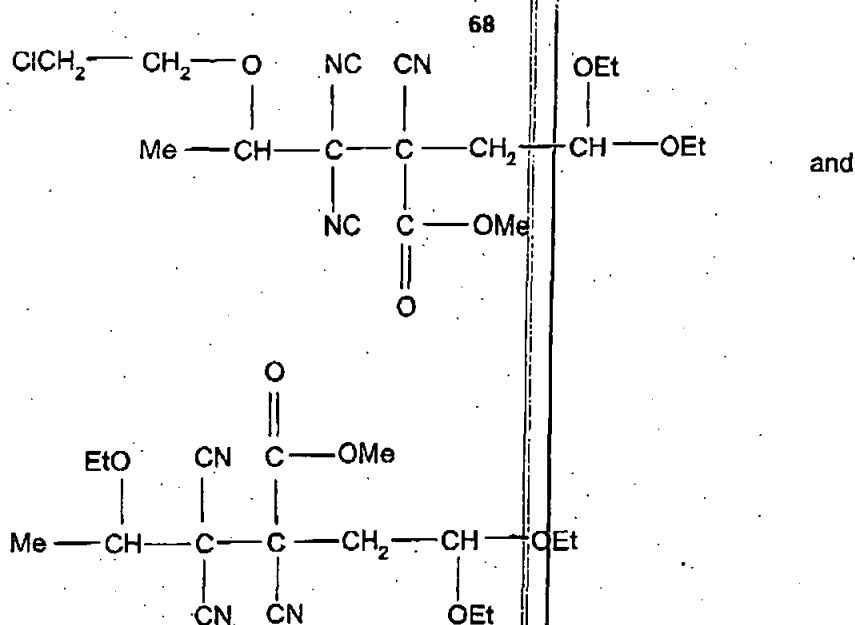
R^b is each independently C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₂-C₆-haloalkynyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₃-C₆-halocycloalkyl, C₃-C₆-cycloalkenyl, C₃-C₆-halocycloalkenyl, C₃-C₆-cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, or C₃-C₆-halocycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, or

phenyl or a 5- to 6-membered heteraromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, which heteroaromatic ring may be bound via a C₁-C₄-alkyl-moiety, and wherein the carbon atoms in phenyl or in the heteroaromatic ring may be substituted with 1 to 3 groups R^a;

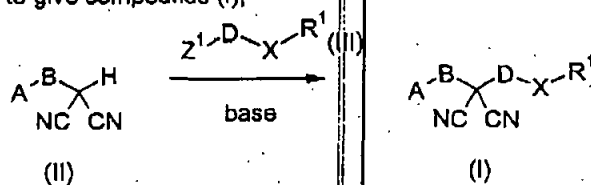
or the enantiomers or diastereomers or salts or N-oxides or polymorphs thereof, with the proviso that the following compounds are excluded:

2-[1,3-Dioxolan-2-yl]ethyl-2-[2-phenylethoxy]ethylpropanedinitrile,





- 5 2. A compound of formula I according to claim 1 wherein X is S(=)_n and n = 0, 1 or 2.
3. A compound of formula I according to claim 1 wherein R¹ is C₁-C₆-haloalkyl.
- 10 4. A compound of formula I wherein A is phenyl or a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein phenyl, the heterocyclic ring, or the heteroaromatic ring may be fused to a ring selected from phenyl and a 5-6-membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocyclic ring which may contain 1 to 3 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein phenyl or the 5- to 6-
- 15 membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted by any combination of 1 to 6 groups R².
5. Compounds of formula I according to claims 1 or 2 wherein D is a saturated or
- 20 partially unsaturated hydrocarbon chain with 2 to 4 carbon chain atoms.
6. A process for the preparation of compounds of formula I as defined in claims 1 to 5 which comprises reacting compounds (II) with compound (III) in the presence of a base to give compounds (I),



69

wherein A, B, D, X and R¹ are as defined in claims 1 to 3 for compounds of formula I and Z¹ represents a suitable leaving group.

- 5 7. Use of compounds of formula I as defined in claims 1 to 5 for combating insects, acarids, or nematodes.
8. A method for the control of insects, acarids or nematodes by contacting the insect, acarid or nematode or their food supply, habitat, breeding ground or their locus with a pesticidally effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 5.
- 10 9. A method of protecting growing plants from attack or infestation by insects, acarids or nematodes by applying to the plants, or to the soil or water in which they are growing, a pesticidally effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 5.
- 15 10. A method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasitically effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 5 or their enantiomers or veterinarily acceptable salts.
- 20 11. A process for the preparation of a composition for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises a parasitically effective amount of compositions or compounds of formula I as defined in claims 1 to 5 or their enantiomers or veterinarily acceptable salts.
- 25 12. Compositions comprising a pesticidally or parasitically active amount of compounds of formula I as defined in claims 1 to 5 and an agronomically or veterinarily acceptable carrier.
- 30 13. Synergistic mixtures comprising a compound of formula I and a pesticide selected from the organo(thio)phosphates, carbamates, pyrethroids, growth regulators, neonicotinoids, nicotinic receptor agonists/antagonists compounds, GABA antagonist compounds, macrocyclic lactone insecticides, METI I acaricides, METI II and III compounds, oxidative phosphorylation inhibitor compounds, moulting disruptor compounds, mixed function oxidase inhibitor compound, sodium channel blocker compounds, benclothiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''cyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone,
- 35 40

209

EP2006069686

21-12-2007 007 16:19
PF 57450

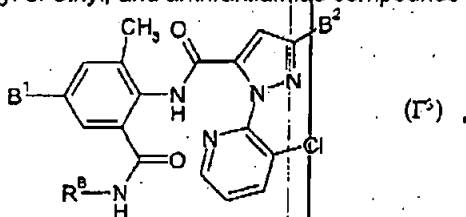
ISENBRUCK MANNH 49 521 4227131

CLMSPAMD

2007-12-21
NR. 726 EP2006069686

70

wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl
and R''' is methyl or ethyl, and anthranilamide compounds of formula I³



wherein B¹ is hydrogen, chlorine or cyano, B² is a bromine atom or CF₃, and R⁵ is H,
5 CH₃ or CH(CH₃)₂.

Un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre puede ser un anillo heteroaromático de 5 miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 12 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre tal como pirrol, pirazol, imidazol, triazol, oxazol, isoxazol, oxadiazol, tiazol, isotiazol, tiodiazol; o un anillo heteroaromático de 5 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de oxígeno y azufre, tal como furano o tiofeno; a un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 12 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, preferiblemente de nitrógeno, tal como piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, o triazina.

Cuando se fusiona a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 a 6 miembros que puede contener uno a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, este sistema de anillo fusionado es por ejemplo pirimidotriazolilo.

Un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3 a 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno es por ejemplo un anillo heteroaromático de 5 a 7 miembros que contiene 1 átomo de nitrógeno y 0 a 1 heteroátomos adicionales independientemente seleccionados de oxígeno y nitrógeno, tal como morfolino, piperazino, piperidino, o pirrolidino.

Cuando se fusiona a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 a 6 miembros que pueda contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, este sistema de anillo fusionado es por ejemplo indolina.

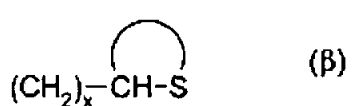
El fenilo que se fusiona a fenilo o a un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre es por ejemplo naftalina, benzoxazolilo, benzotiazolilo, bencimidazolilo, benzoxadiazolilo, o benztiadiazolilo.

El anillo saturado o insaturado de fórmula α



que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además X 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno, por ejemplo es furanilo, tiofenilo, tetrahydrofuranilo, tetrahydrotiofenilo, oxido de tetrahydrotiofenilo o dióxido de tetrahydrotiofenilo.

El grupo de fórmula β



que contiene un anillo saturado o insaturado que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además X 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno por ejemplo es $-\text{CH}_2$ -furanilo, $-\text{CH}_2$ -tiofenilo, $-\text{CH}_2$ -tetrahydrofuranilo, $-\text{CH}_2$ -tetrahydrotiofenilo, $-\text{CH}_2$ -oxido de tetrahydrotiofenilo, $-\text{CH}_2$ -dióxido de tetrahydrotiofenilo, $-(\text{CH}_2)_2$ -furanilo, $-(\text{CH}_2)_2$ -tiofenilo, $-(\text{CH}_2)_2$ -tetrahydrofuranilo, $-(\text{CH}_2)_2$ -

Ejemplos de la acción contra plagas dañinas:

1. Actividad contra el picudo de algodón (*Anthonomus grandis*)

- 5 Los compuestos activos se formularon en 1:3 de DMSO: agua. 10 a 15 huevos fueron colocados en placas microtituladoras llenadas con 2% de agar-agar en agua y 300 ppm de formalina. Los huevos fueron rociados con 20 µl de solución de prueba, las placas fueron selladas con hojas perforadas y mantenidas a 24-26°C y 75-85% de humedad con un ciclo de día/noche durante 3 a 5 días. La mortalidad se evaluó sobre la base de los huevos no eclosionados restantes o las larvas sobre la superficie de agar y/o la cantidad de profundidad de los canales perforados originados por las larvas eclosionadas. Las pruebas fueron aplicadas 2 veces.
- 10
- 15 En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-29, I-31, I-32, I-33, I-34, y I-43, a 2500 ppm mostró mas del 75% de mortalidad comparado con el 0% de mortalidad de los controles no tratados.

20 2. Actividad contra la mosca de fruta mediterránea (*Ceratitis capitata*)

- Los compuestos activos fueron formulados en 1:3 de DMSO: agua. 50 a 80 huevos fueron colocados en placas microtituladoras llenadas a 0.5% de agar-agar y 14% de dieta en agua. Los huevos fueron rociados con 5 µl de solución de prueba, las placas fueron selladas con hojas perforadas y mantenidas a 27-29°C y 75-85% de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó
- 25

sobre la base de la agilidad de las larvas eclosionadas. Las pruebas fueron replicadas 2 veces.

En esta prueba, los compuestos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-13,
5 I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-29, I-30, I-31,
I-33, y I-34, a 2500 ppm mostraron mas del 75% de mortalidad comparado con el
0% de mortalidad de los controles no tratados.

3. Actividad contra el gusano de brote del tabaco (*Heliothis virescens*)

10

Los compuestos activos se formulan en 1:3 de DMSO: agua. 15 a 25 huevos
fueron colocados en placas microtituladoras llenadas con la dieta. Los huevos
fueron rociados con 10 μ l de la solución de prueba, las placas fueron selladas con
hojas perforadas y mantenidas a 27-29°C y 75-85% de humedad bajo luz
15 fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó sobre a base de la agilidad y
la alimentación comparativa de las larvas eclosionadas. Las pruebas se replicaron
2 veces.

4. Actividad contra áfido de algarrobo (*Megoura viciae*)

20

Los compuestos activos se formularon en 1:3 de DMSO: agua. Discos de la hoja
de frijol fueron colocados en placas microtituladas llenadas con 0.8% de agar-agar
y 2.5 ppm de OPUSTM. Los discos de hoja fueron rociados con 2.5 μ l de la
solución de prueba y 5 a 8 áfidos adultos fueron colocados en las placas
25 microtituladas que fueron entonces cerradas y mantenidas a 22-24°C y 35-45%
bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó sobre la base de los
áfidos reproducidos vitales. Las pruebas se replicaron 2 veces.

En esta prueba, los compuestos I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-16, I-21, I-24, I-27, I-29, I-31, I-37, y I-42, a 2500 ppm mostraron mas del 75% de mortalidad comparado con el 0% de mortalidad de los controles no tratados.

5

5. Actividad contra el áfido del trigo (*Rhopalosiphum padi*)

Los compuestos activos se formularon en 1:3 de DMSO: agua. Discos de hojas de cebada se colocaron en placas microtituladas llenadas con 0.8% de agar-agar y 2.5 ppm de OPUSTM. Los discos de hojas son rociados con 2.5 µl de la solución de prueba y 3 a 8 áfidos adultos se colocaron en las placas microtituladas que son entonces cerradas y mantenidas a 22-24°C y 35-45% de humedad bajo luz fluorescente durante 5 días. La mortalidad se evaluó sobre la base de los áfidos vitales. Las pruebas son replicadas 2 veces.

15

6. Actividad contra el áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 de acetona:agua y 100 ppm de tensioactivo KineticaTM.

20

Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por maceta) se infestaron al colocar la hoja fuertemente infestada de la colonia principal sobre la parte superior de cada cotiledón. A los áfidos se les permite transferirse a la planta huésped durante la noche, y la hoja utilizada para transferir los áfidos es removida.

Los cotiledones son sumergidos en la solución de prueba hasta que se secan. Después de 5 días, se hace un conteo de la mortalidad.

25

7. Actividad contra el gusano soldado del sur (*Spodoptera eridania*), larvas del segundo instar.

Los compuestos activos se formulan para probar la actividad contra los insectos y los arácnidos como una solución con 10.000 ppm en una mezcla de 35% de acetona y agua, que se diluye con agua si es necesario.

Una hoja de frijol Sieva lima se sumerge en la solución de prueba y se le permite secarse. La hoja es luego colocada en una caja petri que contiene un papel de filtro sobre el fondo y 10 orugas del segundo instar. A los 5 días, se hacen observaciones de la mortalidad y de la alimentación reducida.

8. Actividad contra la hormiga Argentina (*Linepithema humile*), la hormiga cosechadora (*Pogonomirmex californicus*), la hormiga acróbata (*Crematogaster spp.*), la hormiga carpintera (*Camponotus floridanus*), la hormiga de fuego (*Solenopsis invicta*), la mosca casera (*Musca domestica*), la mosca estable (*Stomoxys calcitrans*), la mosca de la carne (*Sarcophaga sp.*), el mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), el mosquito casero (*Culex quinquefasciatus*), el mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*), la cucaracha alemana (*Blattella Germanica*), la pulga del gato (*Ctenocephalides felis*), y la garrapata café del perro (*Rhipicephalus sanguineus*) por vía de contacto con el vidrio.

Los frascos de vidrio son tratados a 0.5 ml de solución del ingrediente activo en acetona y se les permite secar. Los insectos o las garrapatas son colocados en cada frasco junto con algo de alimento y suministro de humedad. Los frascos son mantenidos a 22°C y se observan los efectos del tratamiento en varios intervalos de tiempo.

9. Actividad contra las larvas del mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), el mosquito casero (*Culex quinquefasciatus*) y el mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*) por vía de tratamiento con agua.

5

Las placas de pozo son utilizadas como sitios de prueba. El ingrediente activo se disuelve en acetona y se diluye con agua para obtener las concentraciones necesarias. Las soluciones finales contienen aproximadamente 1% de acetona y se colocan en cada pozo. Aproximadamente 10 larvas de mosquito (4^{to} instar) en 1 ml de agua se agregan a cada pozo. Las larvas se alimentan con una gota de polvo de hígado cada día. Los platos son cubiertos y mantenidos a 22°C. La mortalidad se registra diariamente y las larvas muertas y vivas o las pupas muertas se remueven diariamente. Al final de la prueba las larvas vivas restantes registran y se calcula la mortalidad porcentual.

15

10. Actividad contra el saltamontes de plantas café (*nilaparvata lugens*)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 de acetona:agua. Plántulas de arroz en maceta fueron rociadas con 10 ml de solución de prueba, secadas al aire, colocadas en jaulas e inoculadas con 10 adultos. La mortalidad porcentual se registro después de 24,72 y 120 horas.

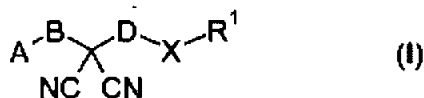
En esta prueba, los compuestos I-35 a 300 ppm mostraron más del 90% de mortalidad.

217

REIVINDICACIONES MODIFICADAS
PARA REALIZAR EL EXAMEN DE
PATENTABILIDAD

REIVINDICACIONES CORREGIDAS

1. Los compuestos de la fórmula I



en donde

X es oxígeno o S(=O)_n;

n es 0,1 o 2;

R¹ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆,

fenilo o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático está unido al átomo X por vía de un átomo de carbono del anillo, y cuyo anillo fenilo o heteroaromático puede estar unido por vía de una porción alquilo C₁-C₁₀ así formando una porción aril-alquilo C₁-C₁₀ o hetaril-alquilo C₁-C₁₀,

en donde fenilo o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

en donde los átomos de hidrógeno en los anteriores grupos R^1 pueden ser parcialmente o totalmente reemplazados por cualquier combinación de los grupos R^5 .

5 A es $-NR^b_2$, $-C(=G)GR^b$, $-C(=G)NR^b_2$, $-C(=NOR^b)R^b$, $C(=G)[N=SR^b_2]$, $-C(=G)NR^b-NR^b_2$, en donde dos grupos R^b juntos pueden formar un alcandiilo C_2-C_3 , alquenediilo C_2-C_3 o alquilo C_1-C_3 -G-alquilo C_1-C_3 de puente que se puede sustituir por 1 a 5 grupos R^2 ,

10 fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7- miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

15 en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionado de oxígeno, nitrógeno y azufre,

20 en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden sustituir o no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

25 B es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 3 átomos en la cadena carbono, en donde los átomos de hidrógeno de esta cadena pueden todos o en parte ser colocados con cualquier

D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con uno a 5 átomos en la cadena carbono o Cicloalquilo C₃-C₆, en donde los átomos de hidrógeno de esta cadena o de este cicloalquilo pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R⁴;

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de

oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre o un grupo alquilo C₁-C₄,

5 en donde los grupos anteriores R² no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a, o

10 R² es -C(=G)R^b, -C(=G)OR^b, -C(=G)NR^b₂, -C(=G)[N=SR^b₂], -C(=NOR^b)R^b, -C(=NOR^b)NR^b₂, -C(=NNR^b₂)R^b, -OC(=G)-OC(=G)OR^b, N=SR^b₂, -NR^bC(=G)R^b, -N[C(=G)R^b]₂, -NR^bC(=G)OR^b, -C(=G)NR^b-NR^b₂, -C(=G)NR^b-NR^b [C(=G)R^b], -NR^b-C(=G)NR^b₂, -NR^b-NR^bC(=G)R^b, -NR^b-N[C(=G)R^b]₂, -N[(C=G)R^b]-NR^b₂, -NR^b-NR^b[(C=G)GR^b], -NR^b[(C=G)NR^b₂], -NR^b[C=NR^b]R^b, -NR^b(C=NR^b)NR^b₂, -O-NR^b₂, -O-NR^b(C=G)R^b, -SO₂NR^b₂, -NR^bSO₂R^b, -S(=O)R^b, -S(=O)₂R^b, -SO₂OR^b, o -OSO₂R^b;

15

R³ es halógeno, ciano, amino, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₃-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₃, alquiniloxi C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₃-C₆, o

20

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo fenilo o heteroaromático o

25

heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre, o

2 grupos R^3 junto con el átomo de carbono de la cadena de hidrocarburo pueden formar un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3- a 7-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno,

en donde los grupos anteriores R^3 no son sustituidos, o los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

R^4 es halógeno, ciano, amino, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , halocicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , alcóxicarbonilo C_1-C_6 , alqueniloxicarbonilo C_1-C_6 , alquilamino C_1-C_6 , di(alquil C_1-C_6)amino, tri(C_1-C_{10})alquilsililo, o

fenilo o un anillo heterocíclico saturado o parcialmente insaturado de 5 o 7 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno o un sistema de anillo heteroaromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo fenilo y cuyo anillo heteroaromático o heterocíclico puede estar unido por vía de un átomo de oxígeno o azufre,

en donde los grupos anteriores R^4 no son sustituidos, o los átomos de

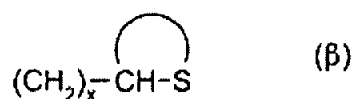
hidrógeno en estos grupos pueden todos o en parte ser colocados con cualquier combinación de los grupos seleccionados de R^a , o

la porción R^4 -D-X- R^1 juntos pueden formar un anillo saturado o insaturado de la Fórmula α



que puede tener un anillo de 5 a 7 miembros y además de azufre 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno y cuyo anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos seleccionados de R^a , o

la porción R^4 -D-X- R^1 juntos pueden formar un grupo de la Fórmula β en donde x es 1 a 5



que contiene un anillo saturado o insaturado que puede tener 5 a 7 miembros en el anillo y además de azufre 1 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de oxígeno, azufre y nitrógeno y cuyo anillo se puede sustituir con 1 a 5 grupos seleccionados de R^a ;

R^5 es un grupo R^3 ;

G es oxígeno o azufre;

R^a es cada uno independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_6 , haloquilo C_1 - C_6 , alquenilo C_2 - C_6 , haloalquenilo C_2 - C_6 , alquinilo C_2 - C_6 , haloalquinilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , halocicloalquilo C_3 - C_8 , cicloalquenilo

C₃-C₆-, halocicloalquenilo C₃-C₈, fenoxi, ORⁱ, SRⁱ, S(=O)Rⁱ, S(=O)₂Rⁱ, NRⁱR^j, -S(=O)₂NRⁱR^j, C(=O)Rⁱ, C(=O)ORⁱ, C(=O)NRⁱR^j, C(=NORⁱ)R^j, -NRⁱC(=G)R^j, -N[C(=G)Rⁱ]₂, -NRⁱC(=G)OR^j, -C(=G)NRⁱ-NR^j₂, -NRⁱSO₂R^j, SiRⁱ_yR^j_{3-y} (y es 0 a 3), o

5

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre,

10

en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se pueden sustituir con 1 a 5 halógenos;

15

Rⁱ, R^j son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆-, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₆, o halocicloalquenilo C₃-C₆;

20

R^b es cada uno independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆-, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₆, halocicloalquenilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆- alquilo C₁-C₄, o halocicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, o

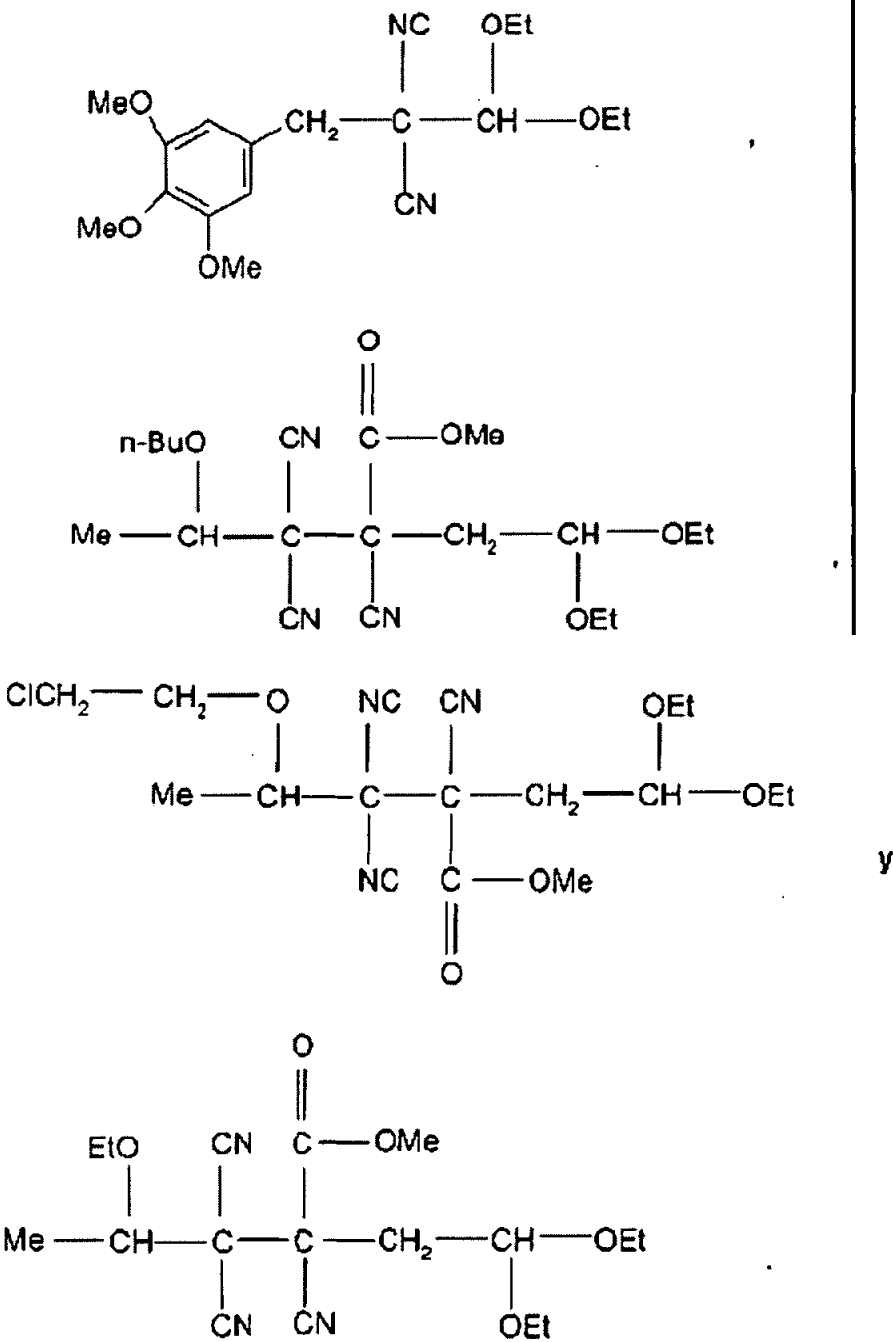
25

fenilo o un anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, cuyo anillo heteroaromático se puede unir por vía una porción alquilo C₁-C₄, y en donde los átomos de carbono en el anillo fenilo o en el anillo heteroaromático se puede sustituir con 1 a 3 grupos R^a;

o los enantiómeros o diastereómeros o sales o N-óxidos o polimorfos de estos,

con la condición que los siguientes compuestos se excluyen

5 2[1,3-Dioxolan-2-il]etil-2-[2-feniletoksi]etilpropanodinitrilo,



10 2. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con reivindicación 1 en donde X

es $S(=)_n$ y $n = 0, 1$ o 2 .

3. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con reivindicación 1 en donde R^1 es haloalquilo C1-C6.

5

4. Un compuesto de la Fórmula I en donde A es fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo, el anillo heterocíclico, o el anillo heteroaromático se puede fusionar a un anillo seleccionado de fenilo y un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 5- a 6-miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, en donde fenilo o el anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o los sistemas de anillo fusionados respectivos se pueden no sustituir mediante cualquier combinación de 1 a 6 grupos R^2 .

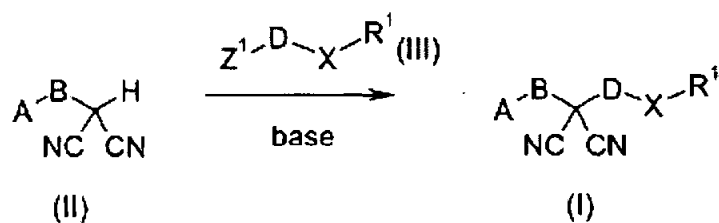
10

15

5. Compuestos de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 en donde D es una cadena de hidrocarburo saturada o parcialmente insaturada con 2 a 4 átomos de carbono en la cadena.

20

6. Un proceso para la preparación de los compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5 que comprende hacer reaccionar compuestos (II) con el compuesto (III) en la presencia de una base para dar compuestos (I)



25

en donde A, B, D, X y R¹ son como se definió en las reivindicaciones 1 a 3 para los compuestos de la fórmula I y Z¹ representa un grupo saliente adecuado.

5

7. Uso de los compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5 para combatir insectos, ácaros, o nemátodos.

10

8. Un método para el control de insectos, ácaros o nemátodos al poner en contacto el insecto, ácaro o nemátodo o su suministro de alimento, hábitat, caldo de cultivo o su locus con una cantidad pesticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5.

15

9. Un método para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por insectos, ácaros o nemátodos al aplicar a las plantas, o al suelo o agua en el que ellas crecen, una cantidad pesticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5.

20

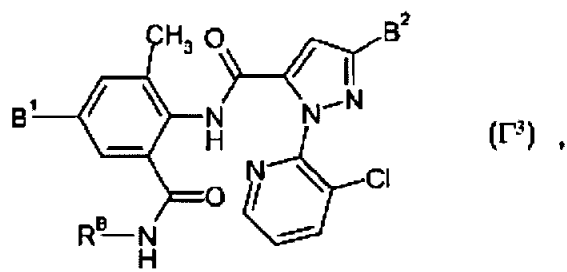
10. Un método para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende administrar oralmente, tópicamente o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad parasiticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5 o sus enantiómeros o sales veterinariamente aceptables.

25

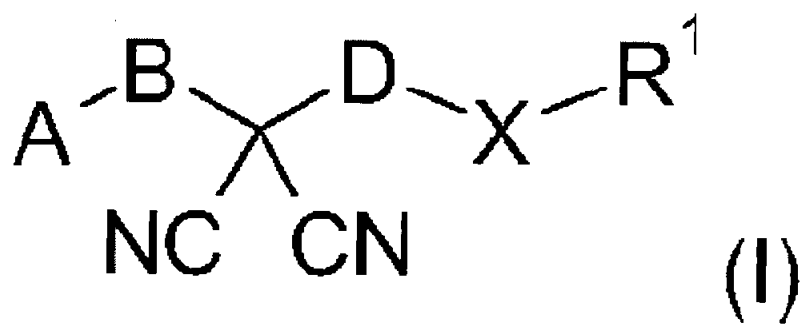
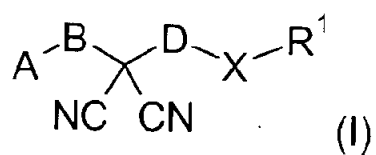
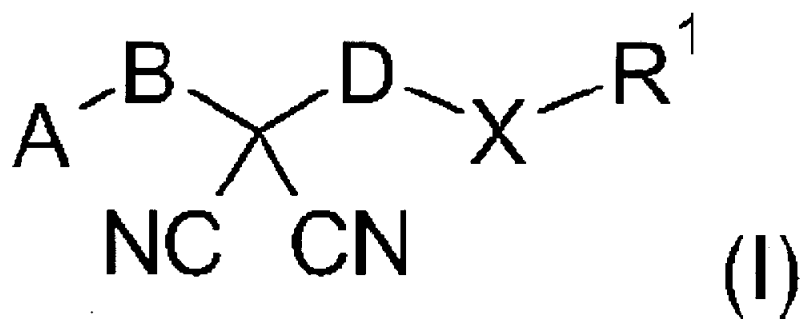
11. Un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticidamente efectiva de composiciones o compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5 o sus enantiómeros o sales veterinariamente aceptables.

12. Composiciones que comprenden una cantidad pesticida o parasiticidamente activa de los compuestos de la fórmula I como se definió en las reivindicaciones 1 a 5 y un portador agronómico o veterinariamente aceptable.

13. Mezclas sinérgicas que comprenden un compuesto de la Fórmula I y un pesticida seleccionado de los organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores de crecimiento, neonicotinoides, compuestos agonistas/antagonistas, del receptor nicotínico, compuestos antagonistas de GABA, insecticidas de lactona macrocíclica, acaricidas compuestos METI I, METI II y III, compuestos inhibidores de fosforilación oxidativa, compuestos que interrumpen la muda, compuesto inhibidor de función oxidasa, compuestos bloqueadores de canal de sodio, benclofiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, y compuestos de antranilamida de la fórmula Γ^3



en donde B¹ es hidrógeno, cloro o ciano, B² es un átomo de bromo o CF₃, y R^B es H, CH₃ o CH(CH₃)₂.



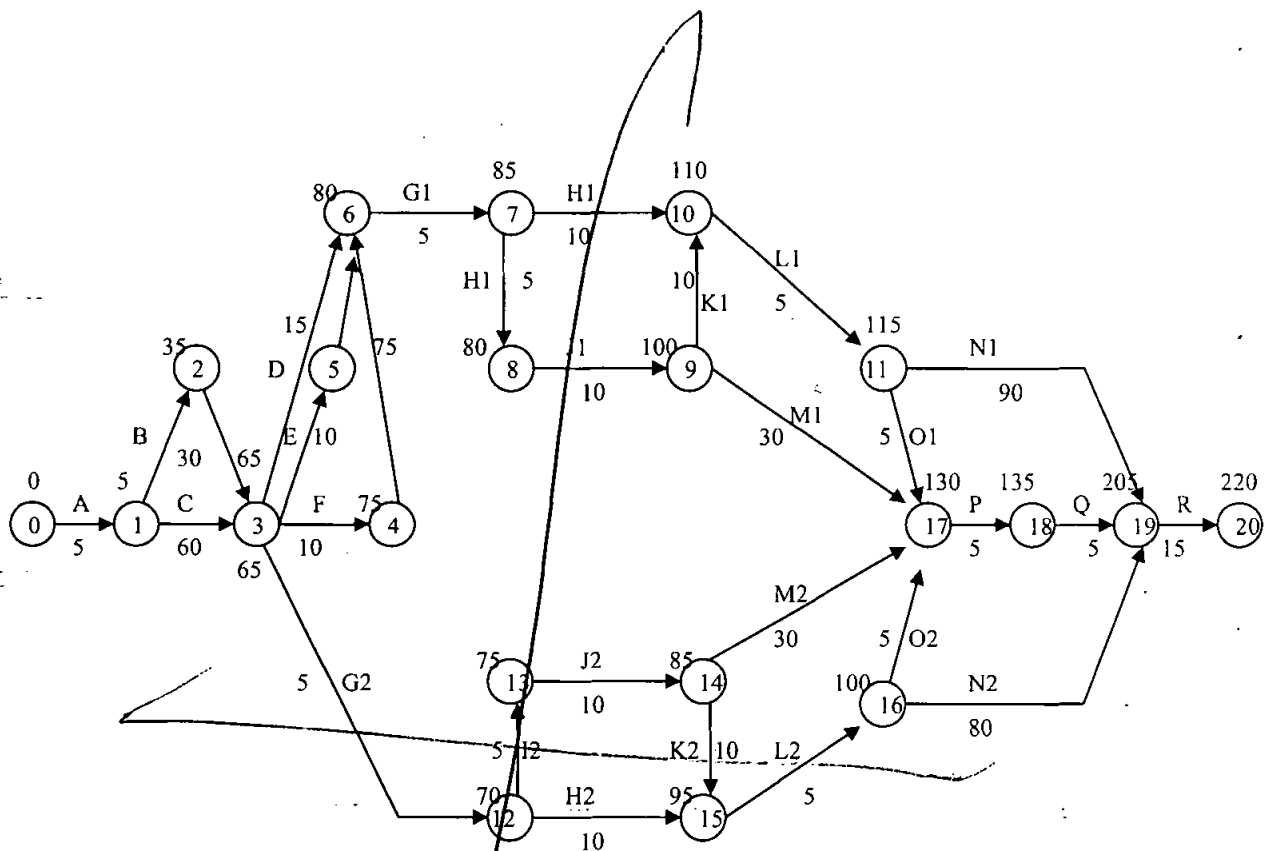


FIG. 9 ASIGNACION DE DURACIONES Y CÁLCULO DE TPI

2321

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 90017

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075123- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:22:48 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 411 PRESENTACION Folios: 232

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 56,245
FECHA : JULIO 14 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2678330	14/07/2008	20,595,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
		TOTAL :	\$ 501,000.00

SON: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

010 ~~B936-841-069~~ 16452 - 841-009-9

933

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075123- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:22:48 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 232



y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION

☒

MODELO DE UTILIDAD ☐

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente ☒
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☒
- ◆ Descripción de la invención ☒
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes ☒
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☒

COMPLETA ☒

INCOMPLETA ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial ☐
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☐
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☐

COMPLETA ☐

INCOMPLETA ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado ☐
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☐
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado ☐
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☐

COMPLETA ☐

INCOMPLETA ☐

SIZ

Firma Responsable

Fecha

2010-07-01

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

934

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

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

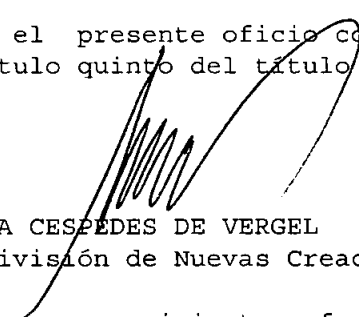
REFERENCIA	Radicación No.	8 75123
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/069686
	Fecha inicio fase nacional	22/07/2008
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio No.	10725

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. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, deben legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil.

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

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


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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 22 AGO. 2008
jfernand