



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA



Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

Organización y
Digitalización CSA Ltda

DYN
NOV

SOLICITUD

PCT

PATENTE DE INVENCION

08-75128

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

COMPOSICIONES PESTICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF SE

DOMICILIO

LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,



PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075128- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:28:00 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 362

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

22 Julio 2008

SOLICITUD DE:

- 1

☒ Patente de Invención.
☒ Capítulo I.
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ 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. Markus KORDES Bensheimer Ring 13 d, 67227 Frankenthal, Alemania 3. Ronan LE VEZOUET Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim, Alemania 5. Deborah L. CULBERSTON 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, North Caroline 27526, Estados Unidos de América 2. Livio TEDESCHI Otto-Beck-Strasse 12, 68165 Mannheim, Alemania 4. Christopher KORADIN Riedlangstrasse 15, 67067 Ludwigshafen, Alemania

5 PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2006/069525</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2007/071585 A1</u>	Fecha: <u>11 de diciembre de 2006</u> Fecha: <u>28 de junio de 2007</u>

6 Título (54) <u>COMPOSICIONES PESTICIDAS</u>

7 Clasificación Internacional (51) <u>C07D 417/012</u>

8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>US</u>	(32) Fecha <u>22 de diciembre de 2005</u>	(31) Número de Solicitud <u>60/753,367</u>

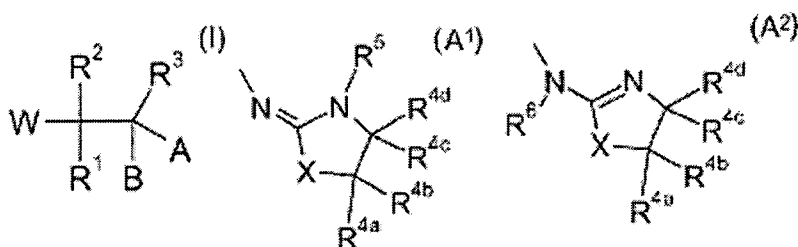
9 Comprobante de pago No.: <u>08-56,241</u> Fecha: <u>14 de julio de 2008</u>

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 :**

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2007/071585 A1

Descripción:

Páginas 120 en el idioma original

Páginas 168 en español

Reivindicaciones: Número (s) 38

Figuras: Número (s)

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

3. ☒ **Forma PCT/IB/306.** Notificación de la inscripción del cambio de solicitante de **BASF AKTIENGESELLSCHAFT** a **BASF SE**.

4. ☒ Extracto de publicación.

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

CAVELIER

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

179

Representación y Poder ^{re} autentificación 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,

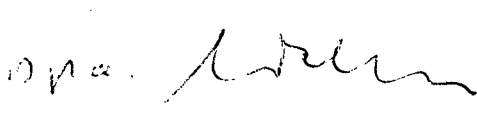
protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, 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.

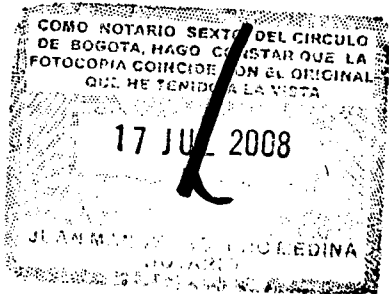
Dado y firmado hoy/Given and signed this 3rd day of April 2008
en/in Ludwigshafen am Rhein
por/by _____

Firma BASF SE

Signatura

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

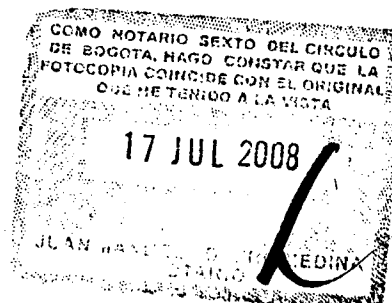
BASF SE (Societas Europaea = European Company),
Ludwigshafen/Rhine. I certify that this firm is a legal person duly organized under the laws of the Federal Republic of Germany and under the laws of the EUROPEAN UNION and that it is registered at the District Court of Ludwigshafen/Germany (**HR B 6000**).

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



notary public

Wert: 5.112,92 Euro



1337

APOSTILLE

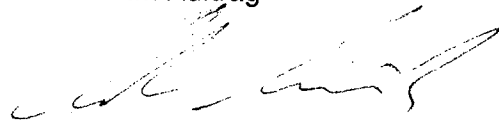
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel - Fischer
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

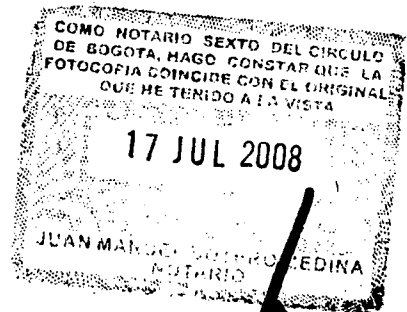
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 7. April 2008
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 511/08
9. Siegel/Stempel:

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



Notar/Notary Public

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.

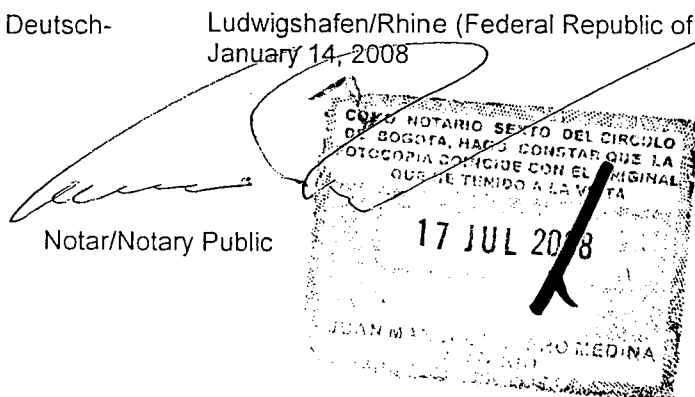
Therefore, BASF SE is the legal successor of BASF Aktiengesellschaft.

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 aforementioned legal succession.

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



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.

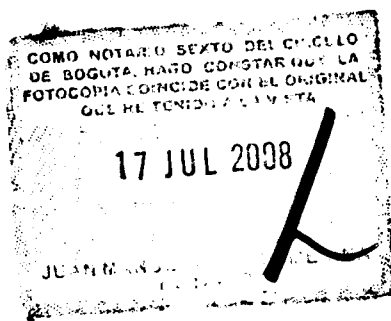
Ludwigshafen/Rhine
(Federal Republic of Germany),
January 22, 2008



Notar/Notary Public

Gebührenwert: 2.000,--EUR

Value of fee: 2.000,--EUR



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

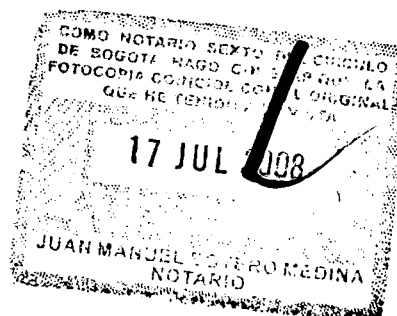
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 7. April 2008
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 512/08

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

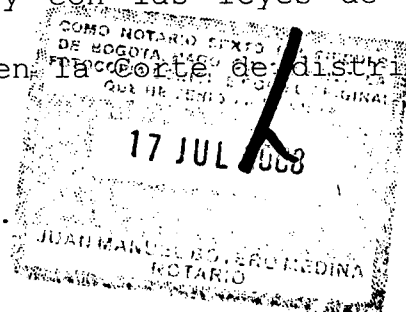
Yo, Ludwig Draxel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente certifico y confirmo que las dos firmas arriba mencionadas de 1- El químico graduado Dr. Thomas Cimniak, químico de Ludwigshafen/Rhine, personalmente conocido mío 2- El químico graduado Dr.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

Eduardo Cabado N.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
BOGOTÁ
9 MAY 12 A 11:06
OFF DE LEY
BOGOTÁ D.C.

BOGOTÁ
9 MAY 12 A 11:06
OFF DE LEY
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
17 JUL 2008
JUAN MANUEL LÓPEZ MEDINA
NOTARIO

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE Alfredo Celso Boguera COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL (ELLOS) EN ESTA NOTARIA SANTAFE 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 17 JUL 2008

JUAN MANUEL BOLA MEDINA

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€

MINISTERIO DE JUSTICIA
BOGOTÁ D.C.
12 A 11: 06

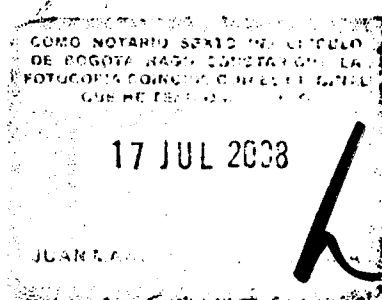
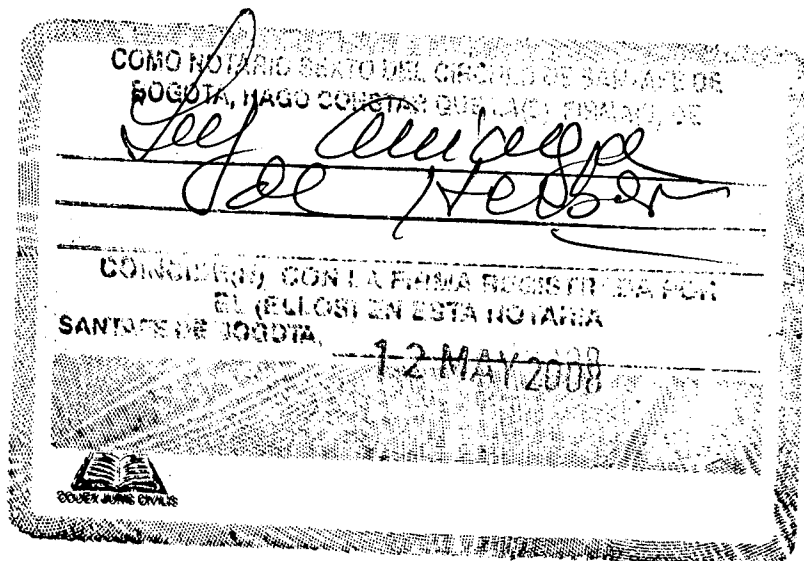
160676
LUZ ARRIAGA

SE ASISTE
REGISTRADO
DEL TRIBUNAL

Resolución No. 14939
COMO NOTARIO SEXTO DE GRADO
DE BOGOTÁ, HAGO CONEYAR QUE LA
FOTOCOPIA QUE SE ME PRESENTA
QUE HE VERIFICADO LA ORIGINAL

17 JUL 2008

PLAN MAN...



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

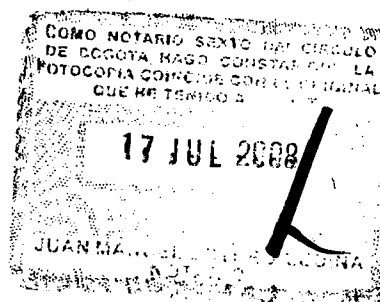
Yo, el notario, certifico la sucesión antes descrita por haber tenido hoy a la vista los dos Registros Mercantiles antes mencionados.

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

Fdo.: firma ilegible
Notario

(sello redondo en tinta)
Ludwig Draxel-Fischer

COPIA AUTÉNTICA DEL ORIGINAL
DE LA NOTARÍA DE LUDWIGSHAFEN AM RHEIN
FOLIO 17 JUL 2008



(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)

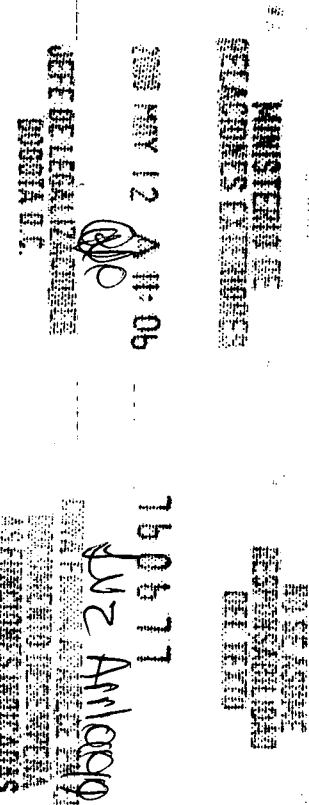
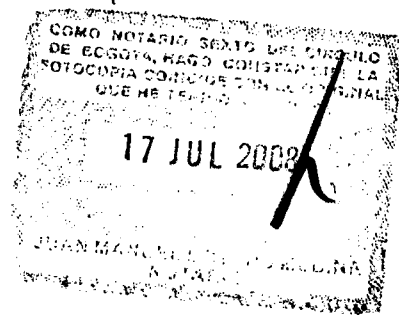
- 10. Firma
p. e. Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

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

Handwritten signature: Cruz Amador

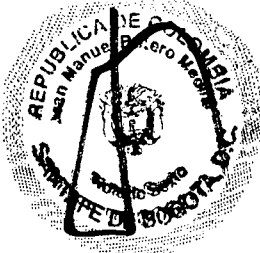


COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE

[Handwritten signatures]

COINCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR EL(LOS) EN ESTA NOTARIA

SANTAFE DE BOGOTA, 12 MAY 2008



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA EMPLEADA EN EL ORIGINAL QUE SE PRESENTA...

17 JUL 2008

JUAN M. ROLDAN

249

Colombia

15

0000057476

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a No. 72-35
BOGOTA, 8 - COLOMBIA

CESION

ASSIGNMENT

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

I (we), the undersigned

Markus Kordes
Bensheimer Ring 13 d, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of Germany

Livio Tedeschi
Otto-Beck-Str. 12, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Italy

Ronan Le Vezouet
Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim
Germany
Citizen of France

Christopher Koradin
Riedlangstr. 15, 67067 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany

Deborah L. Culbertson
6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526
United States of America
Citizen of United States of America

domiciliado(s) en

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

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

Pesticidal compositions

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

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

BASF Aktiengesellschaft

constituída y existente de conformidad con las leyes de

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of

Germany

domiciliada en

domiciled in

67056 Ludwigshafen, Germany

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

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

16

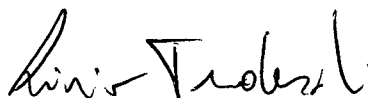
Dado y firmado hoy Given and signed this 1st day of December 2006

Firma

Signature



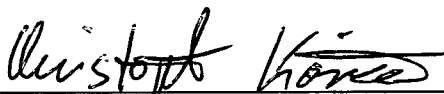
Markus Kordes



Livio Tedeschi



Ronan Le Vezouet



Christopher Koradin



Deborah L. Culbertson

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

U.R.Nr. 3063/2006

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

1. Mr. Markus **Kordes**, residing at Bensheimer Ring 13 d, 67227 Frankenthal, Germany, personally known to me,
2. Mr. Livio **Tedeschi**, residing at Otto-Beck-Str. 12, 68165 Mannheim, Germany, Citizen of Italy, personally known to me,
3. Mr. Ronan **Le Vezouet**, residing at Neckarpromenade 20, 68165 Mannheim, Germany, Citizen of France, personally known to me,
4. Mr. Christopher **Koradin**, residing at Riedlangstr. 15, 67067 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 1st day of December, 2006



A large, stylized handwritten signature in black ink, which appears to be 'Ludwig Draxel-Fischer', is written over the 'notary public' text.

notary public

Wert 5.112,92 €

17

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
Draxel-Fischer
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 6. Dezember 2006
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1496/06

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



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

Kostenvermerk:
Gebühr 12,00 €

STATE OF NORTH CAROLINA



Department of The
Secretary of State

PF 57476 CO

APOSTILLE

(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

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

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 22ND DAY OF NOVEMBER, 2006
7. by Secretary of State or Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 26700
9. Seal/Stamp
10. Signature



Claine J. Marshall
Claine J. Marshall

Secretary of State



Office of Register of Deeds

CERTIFICATION OF NOTARY

STATE OF NORTH CAROLINA
DURHAM COUNTY

I, Willie L. Covington, Register of Deeds of the aforesaid County and State, do hereby certify that Deborah Martin, at the time of signing this document was a duly commissioned Notary Public in and for the County of Durham, State of North Carolina.

IN WITNESS WHEREOF, I have hereunto set my hand and affixed my official seal. This 13th day of November, 2006.

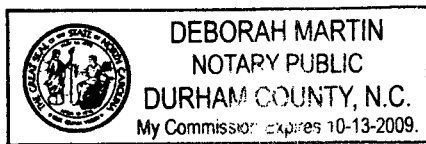
Willie L. Covington
Register of Deeds

BY Deborah Morris
Deborah Morris, Deputy Register of Deeds

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

I, Deborah Martin, a Notary Public for the aforementioned jurisdiction,
do hereby certify that Deborah L. Culbertson personally appeared before me this
day and acknowledge the due execution of the foregoing instrument.

Witness my hand and official seal
this 2nd day of November 2006



Deborah Martin
Signature of Notary Public
Name: Deborah Martin

My Commission Expires October 13, 2009.

**AUTHENTICATION
CERTIFICATE
ATTACHED**

21

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a No. 72-35
BOGOTA, 8 - COLOMBIA

CESION

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

domiciliado(s) en

declaro(amos) bajo juramento ser único(s) y verdadero(s)
inventor(es) de la invención:declaro(amos) así mismo que cedo(emos) y
transfiero(erimos), sin limitación, a favor de la sociedad

constituída y existente de conformidad con las leyes de

domiciliada en

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

ASSIGNMENT

I (we), the undersigned

Markus Kordes
Bensheimer Ring 13 d, 67227 Frankenthal
Germany
Citizen of GermanyLivio Tedeschi
Otto-Beck-Str. 12, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of ItalyRonan Le Vezouet
Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim
Germany
Citizen of FranceChristopher Koradin
Riedlangstr. 15, 67067 Ludwigshafen
Germany
Citizen of GermanyDeborah L. Culbertson
6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526
United States of America
Citizen of United States of Americastate(s) under oath to be sole and true inventor(s) of the
invention:

Pesticidal compositions

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

BASF Aktiengesellschaft

a corporation constituted and existing in conformity with
the laws of
Germanydomiciled in
67056 Ludwigshafen, Germanyall rights inherent to said invention and that the above
mentioned company hereby is enabled to apply, in its name,
for the corresponding patent in the Republic of Colombia.

Dado y firmado hoy

Given and signed this

Firma

Signature

Markus Kordes

Livio Tedeschi

Ronan Le Vezouet

Christopher Koradin

Deborah L. Culbertson 2-Nov-2006
Deborah L. Culbertson

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

TRADUCCIÓN OFICIAL 144/2008 DE UN DOCUMENTO EN INGLÉS Y EN ESPAÑOL, REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL AUTORIZADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 POR EL MINISTERIO DE JUSTICIA Y DEBIDAMENTE REGISTRADO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA. DE ACUERDO CON DICHO DOCUMENTO **MARKUS KORDES, BENSHEIMER RING 13 d, 67227 FRANKENTHAL, ALEMANIA, CIUDADANO DE ALEMANIA; LIVIO TEDESCHI, OTTO-BECK-STR. 12, 68165, MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO DE ITALIA; RONAN LE VEZOUET, NECKARPROMENADE 20, 68167, MANNHEIM, ALEMANIA, CIUDADANO FRANCÉS; CHRISTOPHER KORADIN, RIEDLANGSTR. 15, 67067, LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, CIUDADANO DE ALEMANIA; DEBORAH L. CULBERTSON, 6400 VINTAGE RIDGE LANE, FUQUAY VARINA, NC 27526, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA, CIUDADANO DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA** DECLARAN BAJO JURAMENTO SER LOS INVENTORES ÚNICOS Y VERDADEROS DE LA INVENCION **COMPUESTOS PESTICIDAS**. ADEMÁS QUE CEDEN SIN RESERVAS NI LIMITACIONES EN FAVOR DE **BASF AKTIENGESSELLSCHAFT**, UNA SOCIEDAD CONSTITUIDA Y EXISTENTE DE CONFORMIDAD CON LAS LEYES DE ALEMANIA, DOMICILIADA EN 67056 LUDWIGSHAFEN, ALEMANIA, TODOS LOS DERECHOS INHERENTES A DICHA INVENCION Y QUE LA CITADA COMPAÑÍA QUEDA FACULTADA PARA SOLICITAR EN SU NOMBRE LA PATENTE CORRESPONDIENTE EN LA REPÚBLICA DE COLOMBIA. DADO Y FIRMADO POR MARKUS KORDES, LIVIO TEDESCHI, RONAN LE VEZOUET, CHRITOPHER KORADIN (EL 1 DE DICIEMBRE DE 2006) Y POR DEBORAH L. CULBERTSON (2 DE NOVIEMBRE DE 2006).

U. R NR. 3063/2006

Yo, Ludwig Drexel-Fischer, notario público de Ludwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por el presente certificamos y confirmamos que las firmas

precedentes de MARKUS KORDES, LIVIO TEDESCHI, RONAN LE VEZOUET Y CHRISTOPHER KORADIN, son verídicas y válidas.

Ludwigshafen/Rhine, 1 de diciembre de 2006.

Firma ilegible: notario público.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE, CONDADO DE DURHAM

DECLARACIÓN JURAMENTADA

Yo, Deborah Martin, notario público para la jurisdicción arriba mencionada, por la presente certifico que DEBORAH L. CULBERTON compareció personalmente ante mí hoy y reconoció haber firmado debidamente el documento precedente.

Atestiguo mediante mi firma y sello oficiales, hoy 2 de noviembre de 2006.

Firmado: DEBORAH MARIN, notario público

Nombre: Deborah Martin.

Sello : DEBORAH MARTIN, NOTARIO PÚBLICO, CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE. Mi cargo vence el 13 de octubre de 2009.

SELLO: CERTIFICADO DE AUTENTICACIÓN ADJUNTO.

CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE

OFICINA DE REGISTRO DE ESCRITURAS

CERTIFICACIÓN DE NOTARIO

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE, CONDADO DE DURHAM

Yo, Willie L. Covington, registrador de escrituras del estado y condado arriba nombrados, por la presente certifico que Deborah Martin, al momento de firmar este documento era un notario público debidamente nombrado para el condado de Durham, estado de Carolina del Norte.

En testimonio de lo cual, he firmado y fijado mi sello oficial, hoy 13 de noviembre de 2006.

Willie L. Covington, registrador de escrituras.

Por: DEBORAH MORRIS, registradora suplente de escrituras.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE, DEPARTAMENTO DE LA SECRETARIA
DE ESTADO

APOSTILLA

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

1. PAÍS: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Este documento público

2. ha sido firmado por DEBORAH MORRIS

3. quien actúa en su calidad de REGISTRADOR SUPLENTE DE
ESCRITURAS, WILLIE L COVINGTON, REGISTRADOR DE ESCRITURAS

4. lleva el sello/estampilla del condado de Durham, Carolina
del Norte

CERTIFICADO

5. en Raleigh, Carolina del Norte 6. 22 de noviembre de 2006

7. por la Secretaria de estado o secretario de estado
suplente, estado de Carolina del Norte

8. No. 26700

9. Sello/estampilla: DEPARTAMENTO DE ESTADO DEL ESTADO DE
CAROLINA DEL NORTE

10. Firma: ELAINE F MARSHALL, secretaria de estado

APOSTILLA # 91 Eb-1496/06

COLO-16452-841-004-0

ECN\ECN\ID-127519\WPCL002G

Bogotá, 4 de junio de 2008.

Eduardo Calado N.
Eduardo Calado N.
Eduardo Calado N.
Eduardo Calado N.

26

La presente traducción oficial No. 0104/08 fue elaborada por Hernando Torres Barrera, Traductor e Intérprete Oficial, según Resolución 01305 de 1998 del Ministerio de Justicia y del Derecho.

A continuación se traduce una apostilla en alemán, que acompaña a una CESIÓN.

APOSTILLA
(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania
2. Este documento público
3. está firmado por el Notario
4. Draxel-Fischer
5. en su calidad de Notario Público
6. lleva el sello del Notario Ludwig Draxel-Fischer
7. en Ludwigshafen am Rhein

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 6 de diciembre de 2006
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb – 1496/06
9. Sello/timbre
10. Firma
- En representación:

(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

771812
Hernando Torres

Anotación de Gastos Notariales:
Tasa 12,00 €

SELLO EN ALTO RELIEVE: TRIBUNAL REGIONAL EN FRANKENTHAL (PFALZ) *

Bogotá, D.C., 3 de junio de 2008


HERNANDO TORRES BARRERA
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
RES. No. 1305 MINJUSTICIA 1998

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
28 June 2007 (28.06.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/071585 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 417/12 (2006.01)

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

(21) International Application Number:
PCT/EP2006/069525

(22) International Filing Date:
11 December 2006 (11.12.2006)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/753,367 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): KORDES, Markus [DE/DE]; Bensheimer Ring 13 D, 67227 Frankenthal (DE). TEDESCHI, Livio [IT/DE]; Otto-Beck-Str. 12, 68165 Mannheim (DE). VEZOUET, Ronan [FR/DE]; Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim (DE). KORADIN, Christopher [DE/DE]; Riedlangstr. 15, 67067 Ludwigshafen (DE). CULBERTSON, Deborah L. [US/US]; 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526 (US).

(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.

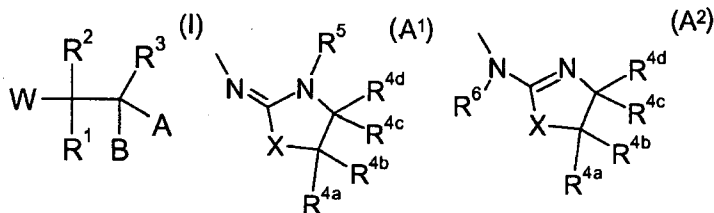
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT,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



1-(Azolin-2-yl)-amino-alkane compounds of the general formula (I) wherein A is a radical of the formulae (A¹) or (A²); and wherein X is sulfur or oxygen and W, B and R¹ to R⁶ are defined as in the description.

(57) Abstract: The present invention relates to 1-(Azolin-2-yl)-amino-alkane compounds, which are useful for combating insects, arachnids and nematodes. The present invention also relates to a method for combating animal pests selected from insects, arachnids and nematodes, and to agricultural compositions for combating animal pests. It has been found that animal pests can be combated by

Pesticidal compositions

The present invention relates to 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds, which are useful for combating insects, arachnids and nematodes. The present invention also relates to a method for combating animal pests selected from insects, arachnids and nematodes, and to agricultural compositions for combating animal pests.

Animal pests and in particular insects, arachnids and nematodes destroy growing and harvested crops and attack wooden dwelling and commercial structures, causing large economic loss to the food supply and to property. While a large number of pesticidal agents are known, due to the ability of target pests to develop resistance to said agents, there is an ongoing need for new agents for combating insects, arachnids and nematodes.

Azoline compounds have been mentioned for different uses in conventional art:

JP 63203672 discloses thiazoles as anti-ulcer agents and liver disease therapeutics.

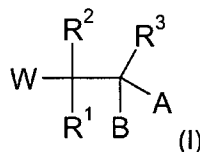
In US 2002/0010199 substituted cyclic amidine derivatives have been described as inhibitors of cell adhesion.

In GB 2121414 heterocyclic amines are employed for fungicidal purposes. The heterocyclic imino derivatives disclosed in WO 95/33717 are used for pest control.

And in WO 2005/063724 azoline compounds with different substitution scheme are also employed for pest control.

It is therefore an object of the present invention to provide compounds having a good pesticidal activity and showing a broad activity spectrum against a large number of different animal pests, especially against difficult to control insects, arachnids and nematodes.

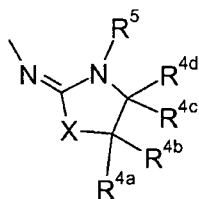
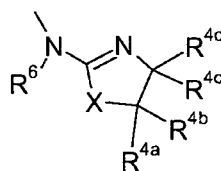
It has been found that these objectives can be achieved by 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of the general formula I:



wherein

R¹, R², R³ are selected from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the
 5 aforementioned groups may carry any combination of one, two or three
 radicals, independently of one another selected from the group consisting of
 halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-
 alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-
 haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;
 phenyl or benzyl, each unsubstituted or substituted with any combination of
 10 one to five halogen, one to three C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkylthio,
 C₁-C₆-haloalkylthio, C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₆-haloalkoxy groups;
 If A corresponds to A² and R³ is hydrogen, R¹ and R² are preferably selected
 dependently from one another not identically to the combination of R³ and B.

15 A is a radical of the formulae A¹ or A²:

A¹A²

wherein

20 X is sulfur or oxygen;

R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d} are each independently selected from one another from
 25 hydrogen, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkylamino, C₁-C₆-
 alkoxy, C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals
 of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or
 three radicals, independently of one another selected from the group
 consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl,
 C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy,
 30 C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;

R⁵, R⁶, R⁹ are each independently selected from one another from
 hydrogen, cyano, nitro, formyl, C(=O)R^{5c} or C(=O)R^{6c} or C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-
 alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-
 35 alkoxy)methylen, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl or C₁-C₆-
 alkylsulfonyl wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the

30

aforementioned groups may carry any combination of 1, 2 or 3 radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

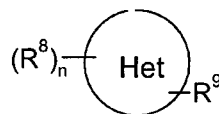
C(O)NR^{5a}R^{5b} or C(O)NR^{6a}R^{6b} or C(O)NR^{9a}R^{9b}, (SO₂)NR^{5a}R^{5b} or (SO₂)NR^{6a}R^{6b} or (SO₂)NR^{9a}R^{9b},

phenyl, phenyloxy or benzyl, each of the last three mentioned radicals may be unsubstituted or substituted with 1 to 5 radicals, independently of one another selected from the group consisting of one to five halogen radicals, one to three C₁-C₆-alkyl, one to three C₁-C₆-haloalkyl, one to three C₁-C₆-alkylthio, one to three C₁-C₆-haloalkylthio, one to three C₁-C₆-alkoxy and one to three C₁-C₆-haloalkoxy radicals;

and wherein R^{5a}, R^{6a}, R^{9a}, R^{5b}, R^{6b}, R^{9b}, R^{5c}, R^{6c} and R^{9c} are defined as below

B is an optionally substituted phenyl ring system

W is 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 4 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur, wherein the heteroaromatic ring may optionally 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, and wherein the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or optionally substituted by R⁹ and/or any combination of 1 to 4 groups R⁸:



wherein n is 0, 1, 2, 3, or 4;
and R⁸ is defined as below;
and R⁹ is defined as above

and wherein

R⁸ is selected from halogen, OH, SH, NH₂, SO₃H, COOH, cyano, azido, nitro, formyl, CONH₂, CSNH₂, CH=N-OH, CH=N-O-(C₁-C₆)-alkyl, C(=O)R^{8c}, C(=S)R^{8c}, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkynylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino,

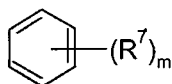
- 5 di(C₂-C₆-alkenyl)amino, di(C₂-C₆-alkynyl)amino, C₁-C₆-alkylthio, C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-alkynylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₂-C₆-alkynylsulfonyl, (C₁-C₆-alkyl)carbonyl, (C₂-C₆-alkenyl)-carbonyl, (C₂-C₆-alkynyl)-carbonyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, (C₁-C₆-alkoxy)carbonyl, (C₂-C₆-alkenyloxy)carbonyl, (C₂-C₆-alkynyloxy)-carbonyl, (C₁-C₆-alkyl)carbonyloxy, (C₂-C₆-alkenyl)-carbonyl-oxy, (C₂-C₆-alkynyl)-carbonyloxy, (C₁-C₆-alkyl)carbonyl-amino, (C₂-C₆-alkenyl)carbonyl-amino, (C₂-C₆-alkynyl)carbonyl-amino, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;
- 10 C(O)NR^{8a}R^{8b}, (SO₂)NR^{8a}R^{8b}; wherein R^{8a}, R^{8b} and R^{8c} are defined as below,
- 15 a radical Y-Ar or a radical Y-Cy, wherein
Y is a single bond, O, S, NH, C₁-C₆-alkandiyl or C₁-C₆-alkandyloxy;
Ar is phenyl, naphthyl or a mono- or bicyclic 5- to 10-membered
- 20 heteroaromatic ring, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, wherein Ar is unsubstituted or may carry any combination of one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;
- 25 Cy is C₃-C₁₂-cycloalkyl, which is unsubstituted or substituted with one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;
- 30 and wherein
- 35 R^{5a}, R^{6a}, R^{8a} and R^{5b}, R^{6b}, R^{8b} are each independently selected from one another from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, or C₂-C₆-alkynyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;
- 40

and R^{5c} , R^{6c} , R^{8c} and R^{9c}

are selected each independently from one another from hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkoxy, $(C_1$ - C_6 -alkyl)amino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, hydrazino, $(C_1$ - C_6 -alkyl)hydrazino, di(C_1 - C_6 -alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O, S and N

or the enantiomers, diastereomers or salts thereof.

Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound wherein B is selected from:



and wherein

m is 0, 1, 2, 3, 4 or 5;

and R^7 is selected from halogen, OH, SH, NH_2 , SO_3H , $COOH$, cyano, azido, nitro, formyl, $CONH_2$, $CSNH_2$, $CH=N-OH$, $CH=N-O-(C_1-C_6)$ -alkyl, $C(=O)R^{7c}$, $C(=S)R^{7c}$, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_6 -alkenylamino, C_2 - C_6 -alkynylamino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, di(C_2 - C_6 -alkenyl)amino, di(C_2 - C_6 -alkynyl)amino, C_1 - C_6 -alkylthio, C_2 - C_6 -alkenylthio, C_2 - C_6 -alkynylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_2 - C_6 -alkenylsulfonyl, C_2 - C_6 -alkynylsulfonyl, $(C_1$ - C_6 -alkyl)carbonyl, $(C_2$ - C_6 -alkenyl)-carbonyl, $(C_2$ - C_6 -alkynyl)-carbonyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, $(C_1$ - C_6 -alkoxy)carbonyl, $(C_2$ - C_6 -alkenyloxy)carbonyl, $(C_2$ - C_6 -alkynyloxy)-carbonyl, $(C_1$ - C_6 -alkyl)carbonyloxy, $(C_2$ - C_6 -alkenyl)-carbonyl-oxy, $(C_2$ - C_6 -alkynyl)-carbonyloxy, $(C_1$ - C_6 -alkyl)carbonyl-amino, $(C_2$ - C_6 -alkenyl)carbonyl-amino, $(C_2$ - C_6 -alkynyl)carbonyl-amino, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl and C_1 - C_6 -alkylthio; $C(O)NR^{7a}R^{7b}$ or $(SO_2)NR^{7a}R^{7b}$; wherein R^{7a} , R^{7b} and R^{7c} are defined as below, a radical Y-Ar or a radical Y-Cy, wherein

Y is a single bond, O, S, NH, C_1 - C_6 -alkandiyl or C_1 - C_6 -alkandiyloxy;

Ar is phenyl, naphthyl or a mono- or bicyclic 5- to 10-membered heteroaromatic ring, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, wherein Ar is

unsubstituted or may carry any combination of one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

5 Cy is C₃-C₁₂-cycloalkyl, which is unsubstituted or substituted with one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

and wherein the radical R⁷ that is bound to adjacent carbon atoms of the phenyl rings may optionally form, together with said carbon atoms, a fused benzene ring, a fused saturated or partially unsaturated 5-, 6-, or 7-membered carbocycle or a fused 5-, 6- or 15 7-membered heterocycle, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, and wherein the fused ring is unsubstituted or may carry 1, 2, 3 or 4 radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

and wherein R^{7a} and R^{7b} are each independently selected from one another from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, or C₂-C₆-alkynyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any 25 combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;

30 and wherein R^{7c} are selected each independently from one another from hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, hydrazino, (C₁-C₆-alkyl)hydrazino, di(C₁-C₆-alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from 35 O, S and N.

Therefore, the present invention relates to 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of the general formula I and to the agriculturally acceptable salts thereof. These compounds have a high pesticidal activity and are active against a 40 broad spectrum of animal pests selected from insects, arachnids and nematodes.

34

- Therefore the invention relates also to a method of combating animal pests, selected from insects, arachnids and nematodes, which comprises contacting the animal pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material or environment in which the animal pests are growing or may grow, or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from I attack or infestation by insects, arachnids or nematodes with a pesticidally effective amount of at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of the general formula I of the general formula I and/or at least one agriculturally acceptable salt thereof.
- 5
- 10 Furthermore, the present invention provides a method for protecting crops from attack or infestation by insects, arachnids or nematodes, which comprises contacting a crop with a pesticidally effective amount of a 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of the general formula I and/or at least one salt thereof.
- 15 Furthermore, the invention relates to agricultural compositions, preferably in the form of directly sprayable solutions, emulsions, pastes oil dispersions, powders, materials for scattering, dusts or in the form of granules, which comprise at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of the general formula I as defined above or a salt thereof, admixed with one or more agronomically acceptable inert, solid or liquid carrier(s) and, if desired, at least one surfactant.
- 20

The compounds of the formula I may have one or more centers of chirality, in which case they are present as mixtures of stereoisomers, such as enantiomers or diastereomers. The present invention provides both the pure stereoisomers, e.g. the pure enantiomes or diastereomers, and mixtures thereof. The compounds of the formula I may also exist in the form of different tautomers. The invention comprises the single tautomers, if seperable, as well as the tautomer mixtures.

25

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

30

Suitable agriculturally useful salts are especially the salts of those cations or the acid addition salts of those acids whose cations and anions, respectively, do not have any adverse effect on the action of the compounds according to the present invention. Suitable cations are in particular the ions of the alkali metals, preferably lithium, sodium and potassium, of the alkaline earth metals, preferably calcium, magnesium and barium, and of the transition metals, preferably manganese, copper, zinc and iron, and also ammonium (NH_4^+) and substituted ammonium in which one to four of the hydrogen atoms are replaced by C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -hydroxyalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 -

35

40

35

- C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, hydroxy-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, phenyl and/or benzyl.
Examples of substituted ammonium ions comprise methylammonium, isopropylammonium, dimethylammonium, diisopropylammonium, trimethylammonium, tetramethylammonium, tetraethylammonium, tetrabutylammonium, 2-
5 hydroxyethylammonium, 2-(2-hydroxyethoxy)ethylammonium, bis(2-hydroxyethyl)ammonium, benzyltrimethylammonium and benzyltriethylammonium, furthermore phosphonium ions, sulfonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium, and sulfoxonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium.
- 10 Anions of useful acid addition salts are primarily chloride, bromide, fluoride, hydrogen sulfate, sulfate, dihydrogen phosphate, hydrogen phosphate, phosphate, nitrate, hydrogen carbonate, carbonate, hexafluorosilicate, hexafluorophosphate, benzoate, and the anions of C₁-C₄-alkanoic acids, preferably formate, acetate, propionate and butyrate. They can be formed by reacting a compound of formulae I with an acid of
15 the corresponding anion, preferably of hydrochloric acid, hydrobromic acid, sulfuric acid, phosphoric acid or nitric acid.

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

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

- 25 Examples of other meanings are:

- The term "C₁-C₆-alkyl" as used herein and in the alkyl moieties of C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-alkylsulfoxyl, C₁-C₆-alkylcarbon
30 yl, C₁-C₆-alkoxycarbonyl, C₁-C₆-alkylthiocarbonyl, and C₁-C₆-alkylcarbonyloxy refer to a saturated straight-chain or branched hydrocarbon group having 1 to 6 carbon atoms, especially 1 to 4 carbon groups, for example methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-
35 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, 1-ethyl-2-methylpropyl, heptyl, octyl, 2-ethylhexyl, nonyl and
40 decyl and their isomers. C₁-C₄-alkyl means for example methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl or 1,1-dimethylethyl.

The term "C₁-C₆-haloalkyl" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated 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-C₄-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, pentafluoroethyl and the like.

10

The term, "C₁-C₆-alkoxy" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via an oxygen atom. Examples include C₁-C₆-alkoxy such as methoxy, ethoxy, OCH₂-C₂H₅, OCH(CH₃)₂, n-butoxy, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂, OC(CH₃)₃, n-pentoxy, 1-methylbutoxy, 2-methylbutoxy, 3-methylbutoxy, 1,1-dimethylpropoxy, 1,2-dimethylpropoxy, 2,2-dimethyl-propoxy, 1-ethylpropoxy, n-hexoxy, 1-methylpentoxy, 2-methylpentoxy, 3-methylpentoxy, 4-methylpentoxy, 1,1-dimethylbutoxy, 1,2-dimethylbutoxy, 1,3-dimethylbutoxy, 2,2-dimethylbutoxy, 2,3-dimethylbutoxy, 3,3-dimethylbutoxy, 1-ethylbutoxy, 2-ethylbutoxy, 1,1,2-trimethylpropoxy, 1,2,2-trimethylpropoxy, 1-ethyl-1-methylpropoxy, 1-ethyl-2-methylpropoxy and the like.

20

The term "C₁-C₆-haloalkoxy" as used herein refers to a C₁-C₆-alkoxy group as mentioned above wherein the hydrogen atoms are partially or fully substituted by fluorine, chlorine, bromine and/or iodine, i.e., for example, C₁-C₆-haloalkoxy such as chloromethoxy, dichloromethoxy, trichloromethoxy, fluoromethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, chlorofluoromethoxy, dichlorofluoromethoxy, chlorodifluoromethoxy, 2-fluoroethoxy, 2-chloroethoxy, 2-bromoethoxy, 2-iodoethoxy, 2,2-difluoroethoxy, 2,2,2-trifluoroethoxy, 2-chloro-2-fluoroethoxy, 2-chloro-2,2-difluoroethoxy, 2,2-dichloro-2-fluoroethoxy, 2,2,2-trichloroethoxy, pentafluoroethoxy, 2-fluoropropoxy, 3-fluoropropoxy, 2,2-difluoropropoxy, 2,3-difluoropropoxy, 2-chloropropoxy, 3-chloropropoxy, 2,3-dichloropropoxy, 2-bromopropoxy, 3-bromopropoxy, 3,3,3-trifluoropropoxy, 3,3,3-trichloropropoxy, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxy, heptafluoropropoxy, 1-(fluoromethyl)-2-fluoroethoxy, 1-(chloromethyl)-2-chloroethoxy, 1-(bromomethyl)-2-bromoethoxy, 4-fluorobutoxy, 4-chlorobutoxy, 4-bromobutoxy, nonafluorobutoxy, 5-fluoro-1-pentoxy, 5-chloro-1-pentoxy, 5-bromo-1-pentoxy, 5-iodo-1-pentoxy, 5,5,5-trichloro-1-pentoxy, undecafluoropentoxy, 6-fluoro-1-hexoxy, 6-chloro-1-hexoxy, 6-bromo-1-hexoxy, 6-iodo-1-hexoxy, 6,6,6-trichloro-1-hexoxy or dodecafluorohexoxy, in particular chloromethoxy, fluoromethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, 2-fluoroethoxy, 2-chloroethoxy or 2,2,2-trifluoroethoxy.

40

37

- The term "C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl" as used herein refers to C₁-C₆-alkyl wherein 1 carbon atom carries a C₁-C₆-alkoxy radical as mentioned above. Examples are CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-propoxymethyl, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-butoxymethyl, (1-methylpropoxy)methyl, (2-methylpropoxy)methyl, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(methoxy)ethyl, 2-(ethoxy)ethyl, 2-(n-propoxy)ethyl, 2-(1-methylethoxy)ethyl, 2-(n-butoxy)ethyl, 2-(1-methylpropoxy)ethyl, 2-(2-methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-dimethylethoxy)ethyl, 2-(methoxy)propyl, 2-(ethoxy)propyl, 2-(n-propoxy)propyl, 2-(1-methylethoxy)propyl, 2-(n-butoxy)propyl, 2-(1-methylpropoxy)propyl, 2-(2-methylpropoxy)propyl, 2-(1,1-dimethylethoxy)propyl, 3-(methoxy)propyl, 3-(ethoxy)propyl, 3-(n-propoxy)propyl, 3-(1-methylethoxy)propyl, 3-(n-butoxy)propyl, 3-(1-methylpropoxy)propyl, 3-(2-methylpropoxy)propyl, 2-(methoxy)butyl, 2-(ethoxy)butyl, 2-(n-propoxy)butyl, 2-(1-methylethoxy)butyl, 2-(n-butoxy)butyl, 2-(1-methylpropoxy)butyl, 2-(2-methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-dimethylethoxy)butyl, 3-(methoxy)butyl, 3-(ethoxy)butyl, 3-(n-propoxy)butyl, 3-(1-methylethoxy)butyl, 3-(n-butoxy)butyl, 3-(1-methylpropoxy)butyl, 3-(2-methylpropoxy)butyl, 3-(1,1-dimethylethoxy)butyl, 4-(methoxy)butyl, 4-(ethoxy)butyl, 4-(n-propoxy)butyl, 4-(1-methylethoxy)butyl, 4-(n-butoxy)butyl, 4-(1-methylpropoxy)butyl, 4-(2-methylpropoxy)butyl, 4-(1,1-dimethylethoxy)butyl and the like.
- 20 The term "(C₁-C₆-alkyl)carbonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded via the carbon atom of the carbonyl group at any bond in the alkyl group. Examples include C₁-C₆-alkylcarbonyl such CO-CH₃, CO-C₂H₅, n-propylcarbonyl, 1-methylethylcarbonyl, n-butylcarbonyl, 1-methylpropylcarbonyl, 2-methylpropylcarbonyl, 1,1-dimethylethylcarbonyl, n-pentylcarbonyl, 1-methylbutylcarbonyl, 2-methylbutylcarbonyl, 3-methylbutylcarbonyl, 1,1-dimethylpropylcarbonyl, 1,2-dimethylpropylcarbonyl, 2,2-dimethylpropylcarbonyl, 1-ethylpropylcarbonyl, n-hexylcarbonyl, 1-methylpentylcarbonyl, 2-methylpentylcarbonyl, 3-methylpentylcarbonyl, 4-methylpentylcarbonyl, 1,1-dimethylbutylcarbonyl, 1,2-dimethylbutylcarbonyl, 1,3-dimethylbutylcarbonyl, 2,2-dimethylbutylcarbonyl, 2,3-dimethylbutylcarbonyl, 3,3-dimethylbutylcarbonyl, 1-ethylbutylcarbonyl, 2-ethylbutylcarbonyl, 1,1,2-trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-trimethylpropylcarbonyl, 1-ethyl-1-methylpropylcarbonyl or 1-ethyl-2-methylpropylcarbonyl and the like.
- 35 The term "(C₁-C₆-alkoxy)carbonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched alkoxy group (as mentioned above) having 1 to 6 carbon atoms attached via the carbon atom of the carbonyl group, for example CO-OCH₃, CO-OC₂H₅, COO-CH₂-C₂H₅, CO-OCH(CH₃)₂, n-butoxycarbonyl, CO-OCH(CH₃)-C₂H₅, CO-OCH₂-CH(CH₃)₂, CO-OC(CH₃)₃, n-pentoxycarbonyl, 1-methylbutoxycarbonyl, 2-methylbutoxycarbonyl, 3-methylbutoxycarbonyl, 2,2-dimethylpropoxycarbonyl, 1-ethylpropoxycarbonyl, n-hexoxycarbonyl, 1,1-dimethylpropoxycarbonyl, 1,2-dimethylpropoxycarbonyl, 1-methylpentoxycarbonyl, 2-methylpentoxycarbonyl, 3-

methylpentoxycarbonyl, 4-methylpentoxycarbonyl, 1,1-dimethylbutoxycarbonyl, 1,2-dimethylbutoxycarbonyl, 1,3-dimethylbutoxycarbonyl, 2,2-dimethylbutoxycarbonyl, 2,3-dimethylbutoxycarbonyl, 3,3-dimethylbutoxycarbonyl, 1-ethylbutoxycarbonyl, 2-ethylbutoxycarbonyl, 1,1,2-trimethylpropoxycarbonyl, 1,2,2-trimethylpropoxycarbonyl, 1-ethyl-1-methylpropoxycarbonyl or 1-ethyl-2-methylpropoxycarbonyl.

The term "(C₁-C₆-alkyl)carbonyloxy" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded via the carbon atom of the carbonyloxy group at any bond in the alkyl group, for example O-CO-CH₃, O-CO-C₂H₅, n-propylcarbonyloxy, 1-methylethylcarbonyloxy, n-butylcarbonyloxy, 1-methylpropylcarbonyloxy, 2-methylpropylcarbonyloxy, 1,1-dimethylethylcarbonyloxy, n-pentylcarbonyloxy, 1-methylbutylcarbonyloxy, 2-methylbutylcarbonyloxy, 3-methylbutylcarbonyloxy, 1,1-dimethylpropylcarbonyloxy or 1,2-dimethylpropylcarbonyloxy.

The term "C₁-C₆-alkylthio (C₁-C₆-alkylsulfanyl: C₁-C₆-alkyl-S-)" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfur atom, for example C₁-C₄-alkylthio such as methylthio, ethylthio, propylthio, 1-methylethylthio, butylthio, 1-methylpropylthio, 2-methylpropylthio, 1,1-dimethylethylthio, n-pentylthiocarbonyl, 1-methylbutylthio, 2-methylbutylthio, 3-methylbutylthio, 2,2-dimethylpropylthio, 1-ethylpropylthio, n-hexylthio, 1,1-dimethylpropylthio, 1,2-dimethylpropylthio, 1-methylpentylthio, 2-methylpentylthio, 3-methylpentylthio, 4-methylpentylthio, 1,1-dimethylbutylthio, 1,2-dimethylbutylthio, 1,3-dimethylbutylthio, 2,2-dimethylbutylthio, 2,3-dimethylbutylthio, 3,3-dimethylbutylthio, 1-ethylbutylthio, 2-ethylbutylthio, 1,1,2-trimethylpropylthio, 1,2,2-trimethylpropylthio, 1-ethyl-1-methylpropylthio or 1-ethyl-2-methylpropylthio.

The term "(C₁-C₆-alkylthio)carbonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched alkthio group (as mentioned above) having 1 to 6 carbon atoms attached via the carbon atom of the carbonyl group. Examples include CO- SCH₃, CO- SC₂H₅, CO-SCH₂-C₂H₅, CO- SCH(CH₃)₂, n-butylthiocarbonyl, CO-SCH(CH₃)-C₂H₅, CO-SCH₂- CH(CH₃)₂, CO- SC(CH₃)₃, n-pentylthiocarbonyl, 1-methylbutylthiocarbonyl, 2-methylbutylthiocarbonyl, 3-methylbutylthiocarbonyl, 2,2-dimethylpropylthiocarbonyl, 1-ethylpropylthiocarbonyl, n-hexylthiocarbonyl, 1,1-dimethylpropylthiocarbonyl, 1,2-dimethylpropylthiocarbonyl, 1-methylpentylthiocarbonyl, 2-methylpentylthiocarbonyl, 3-methylpentylthiocarbonyl, 4-methylpentylthiocarbonyl, 1,1-dimethylbutylthiocarbonyl, 1,2-dimethylbutylthiocarbonyl, 1,3-dimethylbutylthiocarbonyl, 2,2-dimethylbutylthiocarbonyl, 2,3-dimethylbutylthiocarbonyl, 3,3-dimethylbutylthiocarbonyl, 1-ethylbutylthiocarbonyl, 2-ethylbutylthiocarbonyl, 1,1,2-

trimethylpropylthiocarbonyl, 1,2,2-trimethylpropylthiocarbonyl, 1-ethyl-1-methylpropylthiocarbonyl or 1-ethyl-2-methylpropylthiocarbonyl.

5 The term "C₁-C₆-alkylsulfinyl" (C₁-C₆-alkylsulfoxyl: C₁-C₆-alkyl-S(=O)-), as used herein refers to a straight-chain or branched saturated hydrocarbon group (as mentioned above) having 1 to 6 carbon atoms bonded through the sulfur atom of the sulfinyl group at any bond in the alkyl group, for example SO- CH₃, SO- C₂H₅, n-propylsulfinyl, 1-methylethylsulfinyl, n-butylsulfinyl, 1-methylpropylsulfinyl, 2-methylpropylsulfinyl, 1,1-dimethylethylsulfinyl, n-pentylsulfinyl, 1-methylbutylsulfinyl, 2-methylbutylsulfinyl, 3-methylbutylsulfinyl, 1,1-dimethylpropylsulfinyl, 1,2-dimethylpropylsulfinyl, 2,2-dimethylpropylsulfinyl, 1-ethylpropylsulfinyl, n-hexylsulfinyl, 1-methylpentylsulfinyl, 2-methylpentylsulfinyl, 3-methylpentylsulfinyl, 4-methylpentylsulfinyl, 1,1-dimethylbutylsulfinyl, 1,2-dimethylbutylsulfinyl, 1,3-dimethylbutylsulfinyl, 2,2-dimethylbutylsulfinyl, 2,3-dimethylbutylsulfinyl, 3,3-dimethylbutylsulfinyl, 1-ethylbutylsulfinyl, 2-ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-trimethylpropylsulfinyl, 1-ethyl-1-methylpropylsulfinyl or 1-ethyl-2-methylpropylsulfinyl.

20 The term "C₁-C₆-alkylamino" refers to a secondary amino group carrying one alkyl group as defined above, e.g. methylamino, ethylamino, propylamino, 1-methylethylamino, butylamino, 1-methylpropylamino, 2-methylpropylamino, 1,1-dimethylethylamino, pentylamino, 1-methylbutylamino, 2-methylbutylamino, 3-methylbutylamino, 2,2-dimethylpropylamino, 1-ethylpropylamino, hexylamino, 1,1-dimethylpropylamino, 1,2-dimethylpropylamino, 1-methylpentylamino, 2-methylpentylamino, 3-methylpentylamino, 4-methylpentylamino, 1,1-dimethylbutylamino, 1,2-dimethylbutylamino, 1,3-dimethylbutylamino, 2,2-dimethylbutylamino, 2,3-dimethylbutylamino, 3,3-dimethylbutylamino, 1-ethylbutylamino, 2-ethylbutylamino, 1,1,2-trimethylpropylamino, 1,2,2-trimethylpropylamino, 1-ethyl-1-methylpropylamino or 1-ethyl-2-methylpropylamino.

30 The term "di(C₁-C₆-alkyl)amino" refers to a tertiary amino group carrying two alkyl radicals as defined above, e.g. dimethylamino, diethylamino, di-n-propylamino, diisopropylamino, N-ethyl-N-methylamino, N-(n-propyl)-N-methylamino, N-(isopropyl)-N-methylamino, N-(n-butyl)-N-methylamino, N-(n-pentyl)-N-methylamino, N-(2-butyl)-N-methylamino, N-(isobutyl)-N-methylamino, N-(n-pentyl)-N-methylamino, N-(n-propyl)-N-ethylamino, N-(isopropyl)-N-ethylamino, N-(n-butyl)-N-ethylamino, N-(n-pentyl)-N-ethylamino, N-(2-butyl)-N-ethylamino, N-(isobutyl)-N-ethylamino or N-(n-pentyl)-N-ethylamino.

40 The term "C₁-C₆-alkylsulfonyl" (C₁-C₆-alkyl-S(=O)₂-) as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is bonded via the sulfur atom of the sulfonyl group at any bond in the

alkyl group, for example $\text{SO}_2\text{-CH}_3$, $\text{SO}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, n-propylsulfonyl, $\text{SO}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, n-butylsulfonyl, 1-methylpropylsulfonyl, 2-methylpropylsulfonyl, $\text{SO}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_3$, n-pentylsulfonyl, 1-methylbutylsulfonyl, 2-methylbutylsulfonyl, 3-methylbutylsulfonyl, 1,1-dimethylpropylsulfonyl, 1,2-dimethylpropylsulfonyl, 2,2-dimethylpropylsulfonyl, 1-ethylpropylsulfonyl, n-hexylsulfonyl, 1-methylpentylsulfonyl, 2-methylpentylsulfonyl, 3-methylpentylsulfonyl, 4-methylpentylsulfonyl, 1,1-dimethylbutylsulfonyl, 1,2-dimethylbutylsulfonyl, 1,3-dimethylbutylsulfonyl, 2,2-dimethylbutylsulfonyl, 2,3-dimethylbutylsulfonyl, 3,3-dimethylbutylsulfonyl, 1-ethylbutylsulfonyl, 2-ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-trimethylpropylsulfonyl, 1-ethyl-1-methylpropylsulfonyl or 1-ethyl-2-methylpropylsulfonyl.

The term "C₂-C₆-alkenyl" as used herein and in the alkenyl moieties of C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, (C₂-C₆-alkenyl)carbonyl, (C₂-C₆-alkenyloxy)carbonyl and (C₂-C₆-alkenyl)carbonyloxy refers to a straight-chain or branched 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.

The term, "C₂-C₆-alkenyloxy" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkenyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via an oxygen atom, such as vinyloxy, allyloxy (propen-3-yloxy), methallyloxy, buten-4-yloxy, etc.

The term "C₂-C₆-alkenylthio" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkenyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is

attached via a sulfur atom, for example vinylsulfanyl, allylsulfanyl (propen-3-ylthio), methallylsufanyl, buten-4-ylsulfanyl, etc..

5 The term "C₂-C₆-alkenylamino" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkenyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfur atom, for example vinylamino, allylamino (propen-3-ylamino), methallylamino, buten-4-ylamino, etc.

10 The term "C₂-C₆-alkenylsulfonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkenyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfonyl (SO₂) group, for example vinylsulfonyl, allylsulfonyl (propen-3-ylsulfonyl), methallylsufonyl, buten-4-ylsulfonyl, etc.

15 The term "C₂-C₆-alkynyl" as used herein and in the alkynyl moieties of C₂-C₆-alkynyloxy, C₂-C₆-alkynylamino, C₂-C₆-alkynylthio, C₂-C₆-alkynylsulfonyl, C₂-C₆-alkynylcarbonyl, C₂-C₆-alkynyloxycarbonyl and C₁-C₆-alkynylcarbonyloxy refers to a straight-chain or branched unsaturated hydrocarbon group having 2 to 10 carbon atoms and containing at least one triple bond, such as ethynyl, prop-1-yn-1-yl, prop-2-yn-1-yl, n-but-1-yn-1-yl, n-but-1-yn-3-yl, n-but-1-yn-4-yl, n-but-2-yn-1-yl, n-pent-1-yn-1-yl, n-pent-1-yn-3-yl, n-pent-1-yn-4-yl, n-pent-1-yn-5-yl, n-pent-2-yn-1-yl, n-pent-2-yn-4-yl, n-pent-2-yn-5-yl, 3-methylbut-1-yn-3-yl, 3-methylbut-1-yn-4-yl, n-hex-1-yn-1-yl, n-hex-1-yn-3-yl, n-hex-1-yn-4-yl, n-hex-1-yn-5-yl, n-hex-1-yn-6-yl, n-hex-2-yn-1-yl, n-hex-2-yn-4-yl, n-hex-2-yn-5-yl, n-hex-2-yn-6-yl, n-hex-3-yn-1-yl, n-hex-3-yn-2-yl, 3-methylpent-1-yn-1-yl, 3-methylpent-1-yn-3-yl, 3-methylpent-1-yn-4-yl, 3-methylpent-1-yn-5-yl, 4-methylpent-1-yn-1-yl, 4-methylpent-2-yn-4-yl or 4-methylpent-2-yn-5-yl and the like.

20

25

The term, "C₂-C₆-alkynyloxy" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkynyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via an oxygen atom, such as propargyloxy (propin-3-yloxy), butin-3-yloxy, and butin-4-yloxy.

30

The term "C₂-C₆-alkynylthio" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkynyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfur atom, such as propargylsulfanyl (propin-3-ylthio), butin-3-ylsufanyl and butin-4-ylsulfanyl.

35

The term "C₂-C₆-alkynylamino" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkynyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfur atom, such as propargylamino (propin-3-ylamino), butin-3-amino, and butin-4-ylamino.

40

42

The term "C₂-C₆-alkynylsulfonyl" as used herein refers to a straight-chain or branched saturated alkynyl group having 2 to 6 carbon atoms (as mentioned above) which is attached via a sulfonyl (SO₂) group, such as propargylsulfonyl (propin-3-ylsulfonyl), butin-3-ylsulfonyl and butin-4-ylsulfonyl.

5

The term "C₃-C₁₂-cycloalkyl" as used herein refers to a mono- or bi- or polycyclic hydrocarbon radical having 3 to 12 carbon atoms, in particular 3 to 6 carbon atoms. Examples of monocyclic radicals comprise cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl, cyclononyl and cyclodecyl. Examples of bicyclic radicals comprise bicyclo[2.2.1]heptyl, bicyclo[3.1.1]heptyl, bicyclo[2.2.2]octyl and bicyclo[3.2.1]nonyl. Examples of tricyclic radicals are adamantyl and homoadamantyl.

10

The term "mono- or bicyclic heteroaromatic ring" as used herein refers to a monocyclic heteroaromatic radical which has 5 or 6 ring members, which may comprise a fused 5, 6 or 7 membered ring thus having a total number of ring members from 8 to 10, wherein in each case 1, 2, 3 or 4 of these ring members are heteroatoms selected, independently from each other, from the group consisting of oxygen, nitrogen and sulfur. The heterocyclic radical may be attached to the remainder of the molecule via a carbon ring member or via a nitrogen ring member. The fused ring comprises C₅-C₇-cycloalkyl, C₅-C₇-cycloalkenyl, or 5 to 7 membered heterocyclyl and phenyl.

15

20

Examples for monocyclic 5- to 6-membered heteroaromatic rings include triazinyl, pyrazinyl, pyrimidyl, pyridazinyl, pyridyl, thienyl, furyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, thiazolyl, oxazolyl, thiadiazolyl, oxadiazolyl, isothiazolyl and isoxazolyl.

25

Examples for 5- to 6-membered heteroaromatic rings carrying a fused phenyl ring are quinolinyl, isoquinolinyl, indolyl, indolizinyll, isoindolyl, indazolyl, benzofuryl, benzthienyl, benzo[b]thiazolyl, benzoxazolyl, benzthiazolyl, benzoxazolyl, and benzimidazolyl. Examples for 5- to 6-membered heteroaromatic rings carrying a fused cycloalkenyl ring are dihydroindolyl, dihydroindolizinyll, dihydroisoindolyl, dihydrochinolyl, dihydroisochinolyl, chromenyl, chromanyl and the like.

30

The term "5 to 7 membered heterocyclyl" comprises monocyclic heteroaromatic rings as defined above and nonaromatic saturated or partially unsaturated heterocyclic rings having 5, 6 or 7 ring members. Examples for non-aromatic rings include pyrrolidinyl, pyrazolinyl, imidazolinyl, pyrrolinyl, pyrazolinyl, imidazolinyl, tetrahydrofuranyl, dihydrofuranyl, 1,3-dioxolanyl, dioxolenyl, thiolanyl, dihydrothienyl, oxazolidinyl, isoxazolidinyl, oxazolinyll, isoxazolinyll, thiazolinyl, isothiazolinyl, thiazolidinyl, isothiazolidinyl, oxathiolanyl, piperidinyl, piperazinyl, pyranyl, dihydropyranyl, tetrahydropyranyl, dioxanyl, thiopyranyl, dihydrothiopyranyl, tetrahydrothiopyranyl, morpholinyl, thiazinyl and the like.

35

40

43

As regards the pesticidal activity of the compounds of formula I, preference is given to those 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of formula I, in which the variables - independently of one another or in combination with any of the other variables - have the following meanings:

Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds, wherein R¹, R² and R³ are selected from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio; If A corresponds to A² and R³ is hydrogen, R¹ and R² are preferably selected dependently from one another not identically to the combination of R³ and B.

More preferred are (Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds, wherein R¹, R² and R³ are selected from hydrogen and C₁-C₆-alkyl, especially methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl and iso-butyl.

Most preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound, wherein R¹, R² and R³ are selected from hydrogen.

Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds according to claim 1, wherein R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d} are each independently selected from one another from hydrogen, halogen, C₁-C₆-alkyl and C₁-C₆-haloalkyl

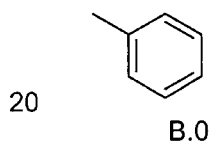
More preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds according to claim 1, wherein R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} and R^{4d} are selected from hydrogen.

Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds according to claim 1, wherein R⁵, R⁶, R⁹ are each independently selected from one another from hydrogen, cyano, nitro, formyl, C(=O)R^{5c}, C(=O)R^{6c}, C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, (C₁-C₆-alkoxy)methylen, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl or C₁-C₆-alkylsulfonyl wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of 1, 2 or 3 radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio and wherein R^{5c}, R^{6c} and R^{9c} are selected each independently from one another from hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, hydrazino, (C₁-C₆-alkyl)hydrazino, di(C₁-C₆-

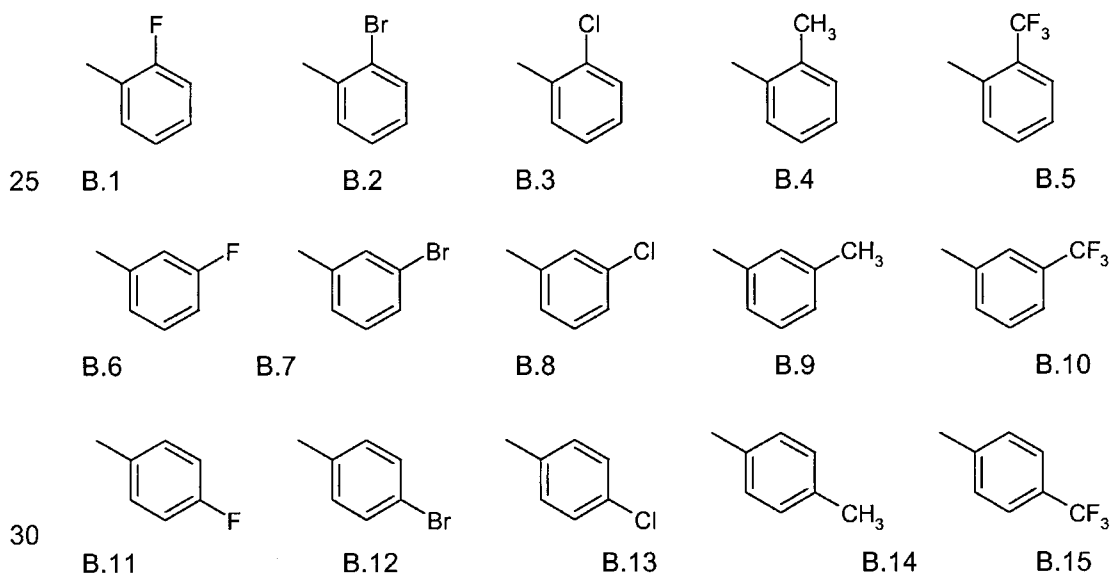
alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N.

- 5 More preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds according to claim 1, wherein R^5 , R^6 , R^9 are each independently selected from one another from hydrogen, cyano, nitro, formyl, $C(=O)R^{5c}$ or $C(=O)R^{6c}$ or $C(=O)R^{9c}$ and C_1 - C_6 -alkyl and wherein R^{5c} , R^{6c} and R^{9c} are selected each independently from one another from hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 -aleny, C_2 - C_6 -alkinyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkoxy, $(C_1$ - C_6 -alkyl)amino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, hydrazino, $(C_1$ - C_6 -alkyl)hydrazino, di(C_1 - C_6 -alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N.
- 10
- 15 Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of formula I wherein B is selected from:

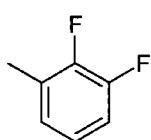
a) Phenyl:



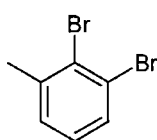
b) Monosubstituted phenyl radicals:



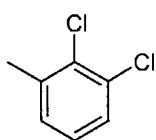
c) disubstituted phenyl radicals:



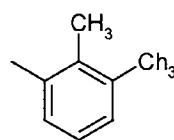
B.16



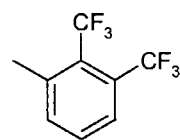
B.17



B.18

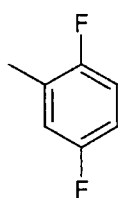


B.19

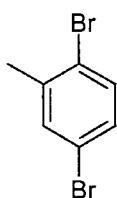


B.20

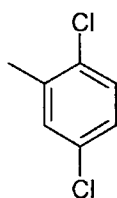
5



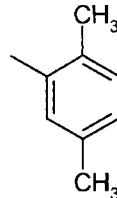
B.21



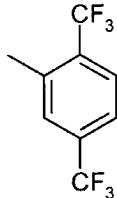
B.22



B.23

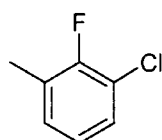


B.24

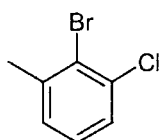


B.25

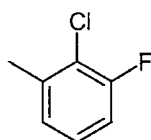
10



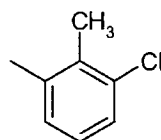
B.26



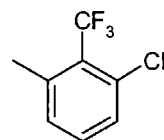
B.27



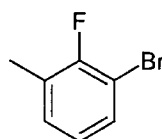
B.28



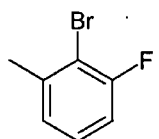
B.29



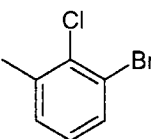
B.30



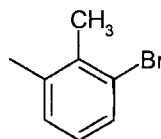
B.31



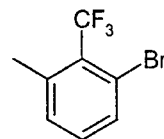
B.32



B.33

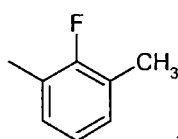


B.34

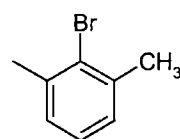


B.35

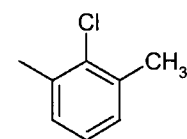
15



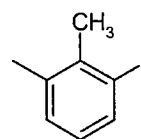
B.36



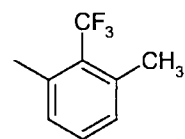
B.37



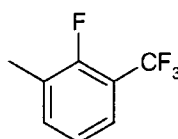
B.38



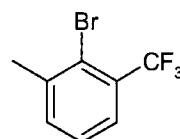
B.39



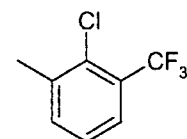
B.40



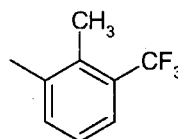
B.41



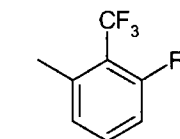
B.42



B.43



B.44

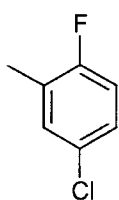


B.45

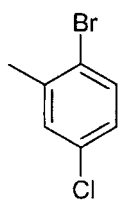
20

46

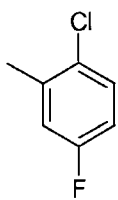
19



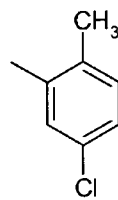
B.46



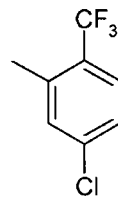
B.47



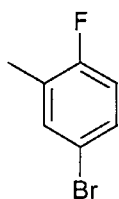
B.48



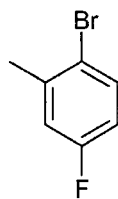
B.49



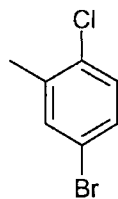
B.50



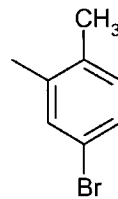
5 B.51



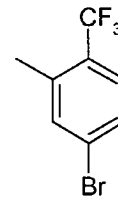
B.52



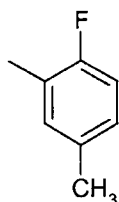
B.53



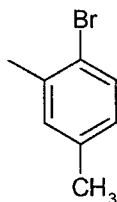
B.54



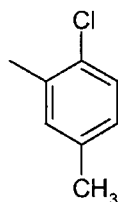
B.55



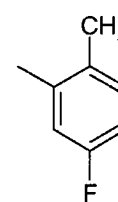
B.56



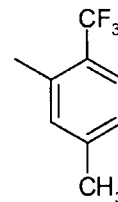
B.57



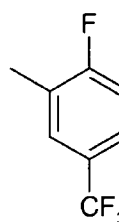
B.58



B.59

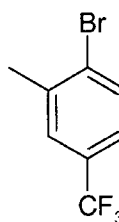


B.60

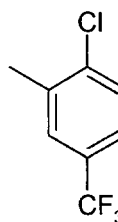


10

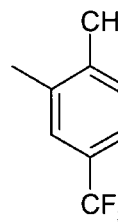
B.61



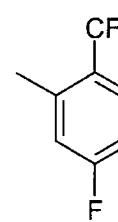
B.62



B.63



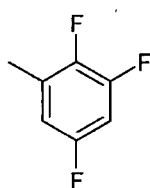
B.64



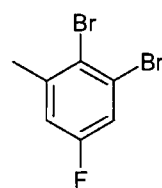
B.65

d) and trisubstituted phenyl radicals:

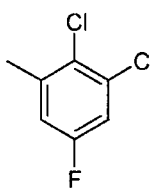
15



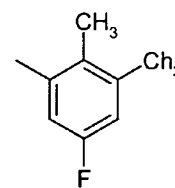
B.66



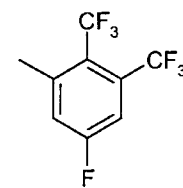
B.67



B.68

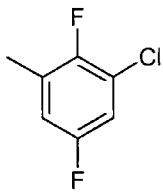


B.69

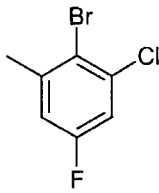


B.70

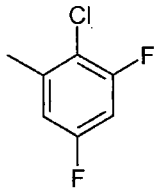
47



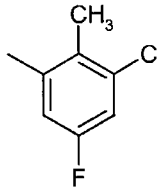
B.71



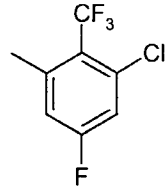
B.72



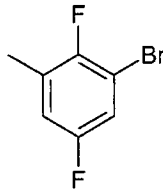
B.73



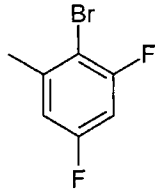
B.74



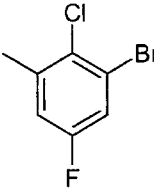
B.75



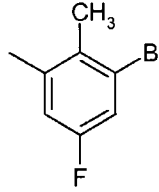
B.76



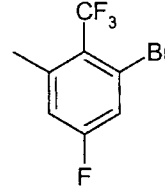
B.77



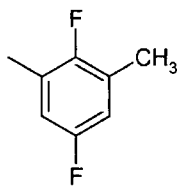
B.78



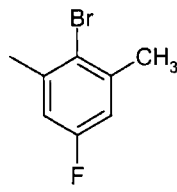
B.79



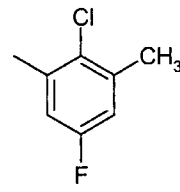
B.80



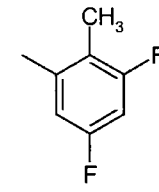
B.81



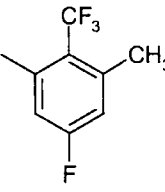
B.82



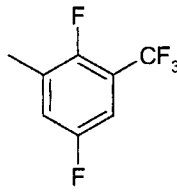
B.83



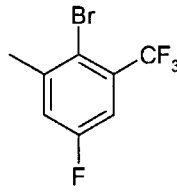
B.84



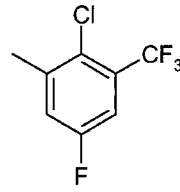
B.85



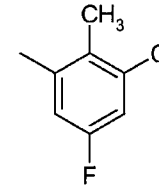
B.86



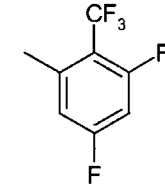
B.87



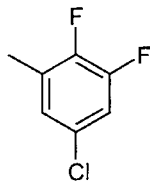
B.88



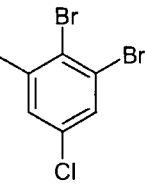
B.89



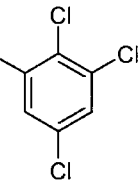
B.90



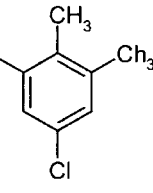
B.91



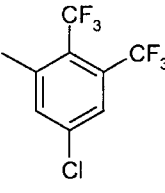
B.92



B.93

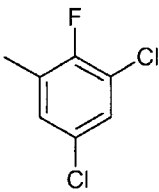


B.94

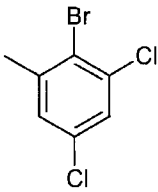


B.95

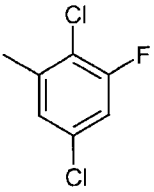
21



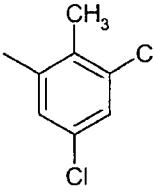
B.96



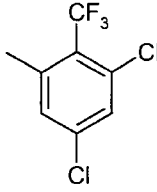
B.97



B.98

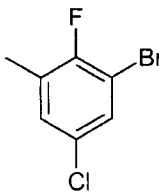


B.99

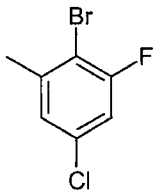


B.100

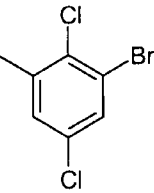
5



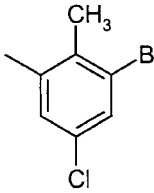
B.101



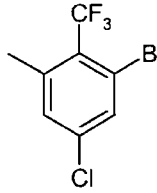
B.102



B.103

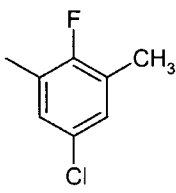


B.104

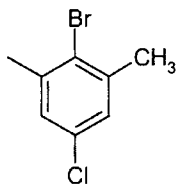


B.105

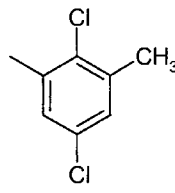
10



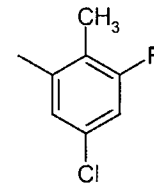
B.106



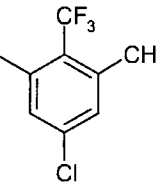
B.107



B.108

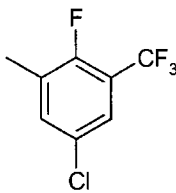


B.109

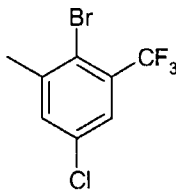


B.110

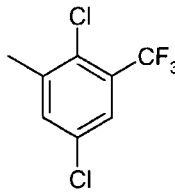
15



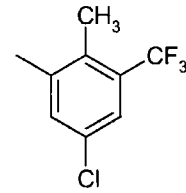
B.111



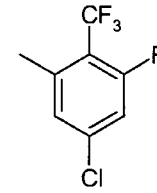
B.112



B.113

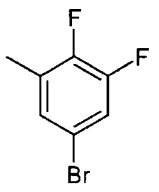


B.114

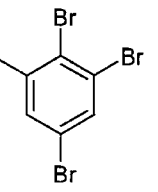


B.115

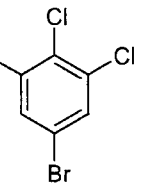
20



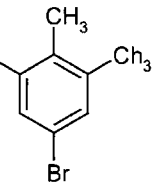
B.116



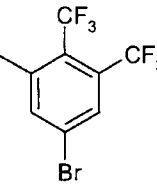
B.117



B.118

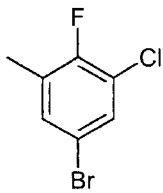


B.119

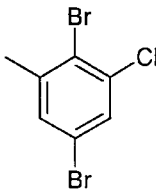


B.120

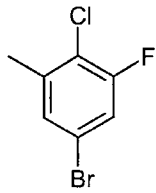
22



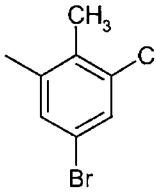
B.121



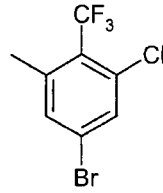
B.122



B.123

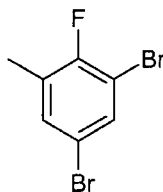


B.124

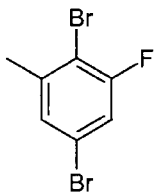


B.125

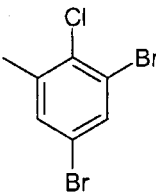
5



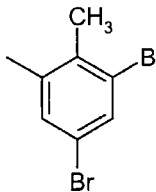
B.126



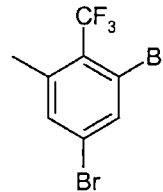
B.127



B.128

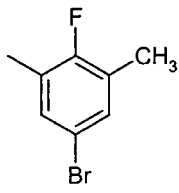


B.129

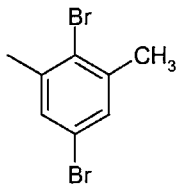


B.130

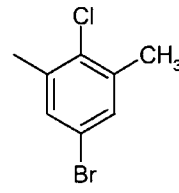
10



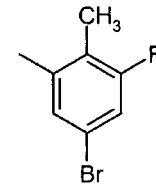
B.131



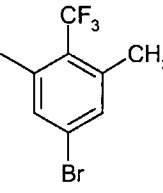
B.132



B.133

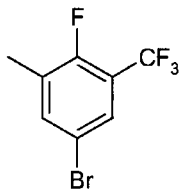


B.134

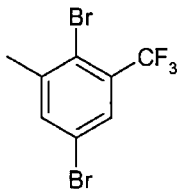


B.135

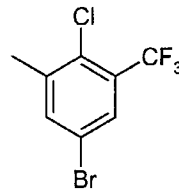
15



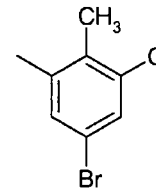
B.136



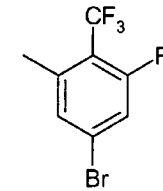
B.137



B.138

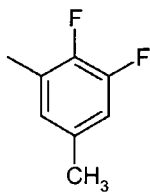


B.139

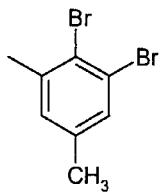


B.140

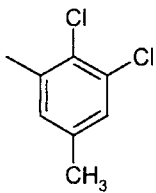
20



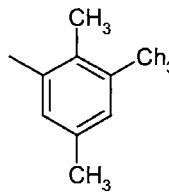
B.141



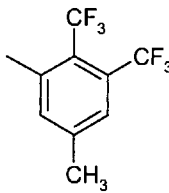
B.142



B.143



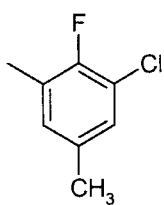
B.144



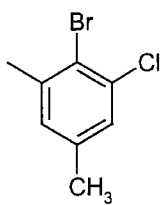
B.145

SO

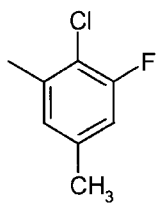
23



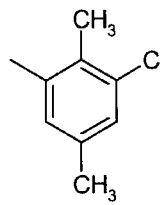
B.146



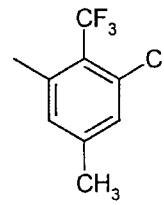
B.147



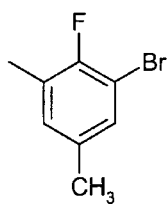
B.148



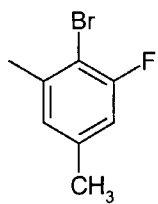
B.149



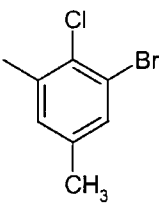
B.150



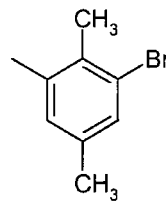
B.151



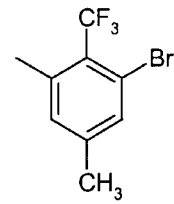
B.152



B.153

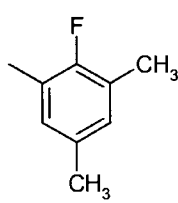


B.154

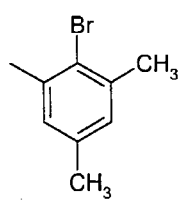


B.155

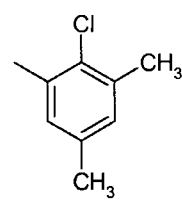
5



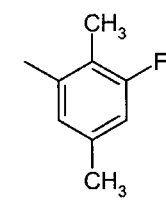
10 B.156



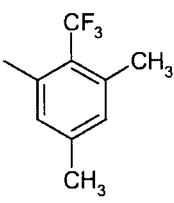
B.157



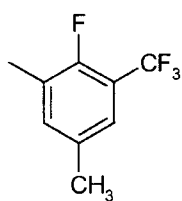
B.158



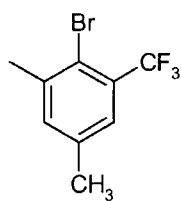
B.159



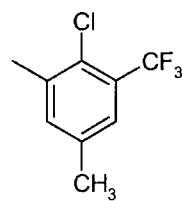
B.160



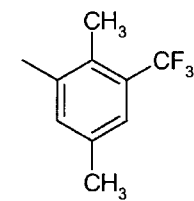
B.161



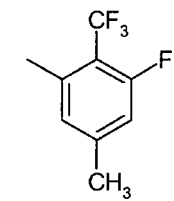
B.162



B.163

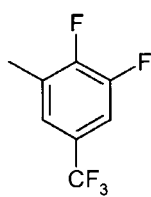


B.164

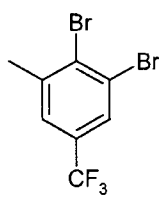


B.165

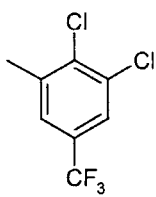
15



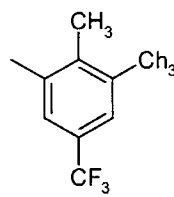
B.166



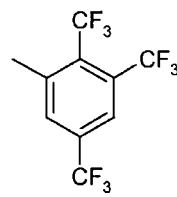
B.167



B.168



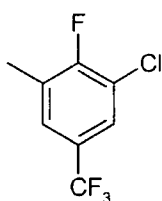
B.169



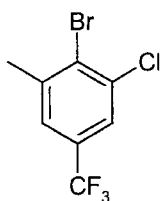
B.170

20

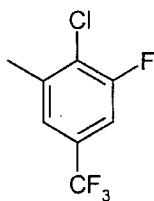
51



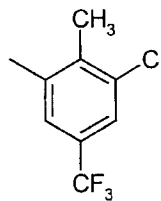
B.171



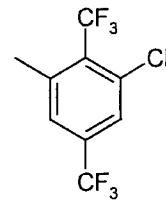
B.172



B.173

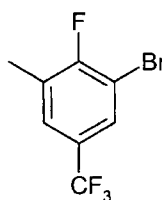


B.174

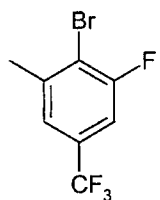


B.175

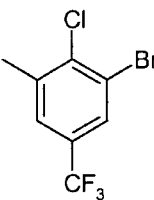
5



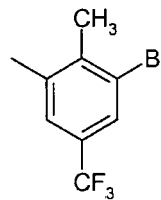
B.176



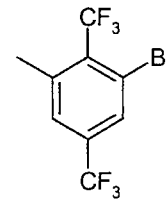
B.177



B.178

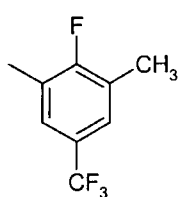


B.179

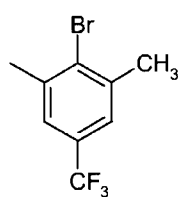


B.180

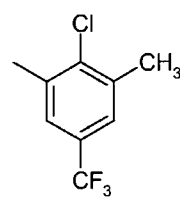
10



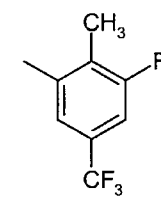
B.181



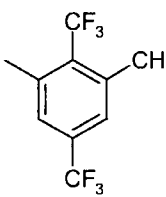
B.182



B.183

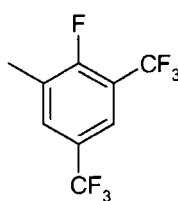


B.184

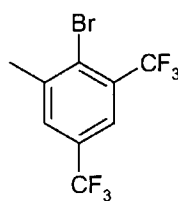


B.185

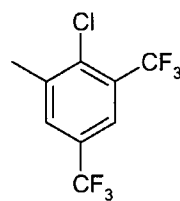
15



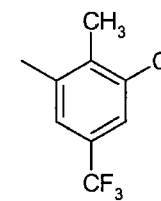
B.186



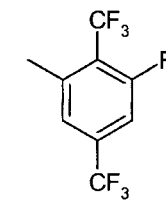
B.187



B.188



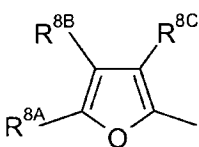
B.189



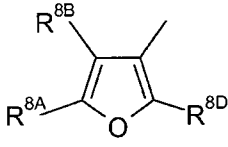
B.190

And wherein the free bond denotes the position of attachment in formula I

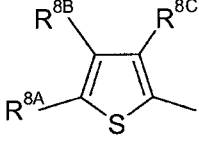
20 Preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of formula I wherein W is selected from:



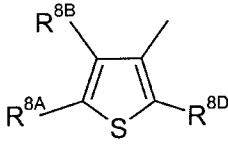
W.1



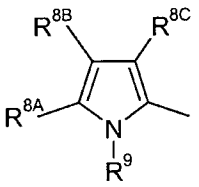
W.2



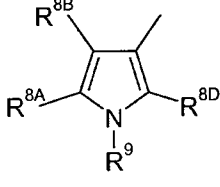
W.3



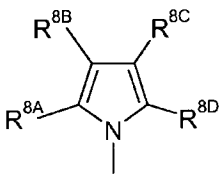
W.4



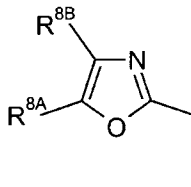
W.5



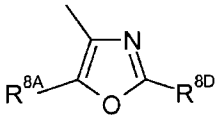
W.6



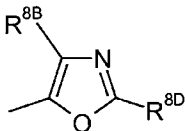
W.7



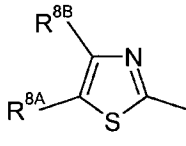
W.8



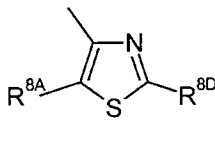
W.9



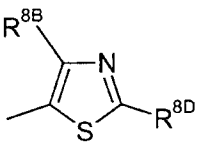
W.10



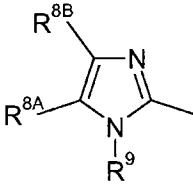
W.11



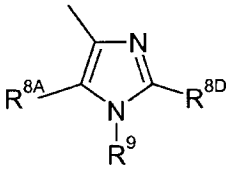
W.12



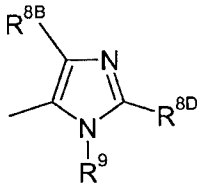
W.13



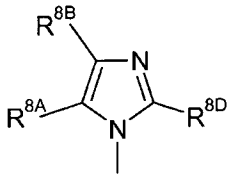
W.14



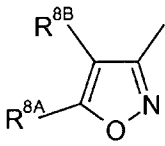
W.15



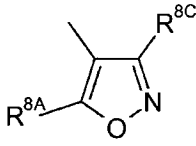
W.16



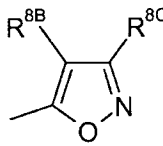
W.17



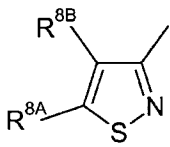
W.18



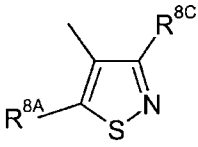
W.19



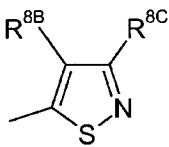
W.20



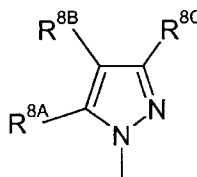
W.21



W.22



W.23

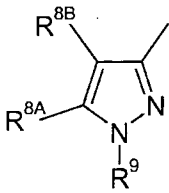


W.24

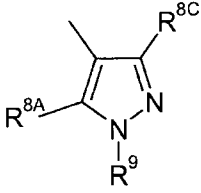
5

10

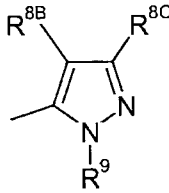
26



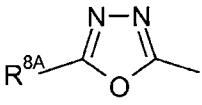
W.25



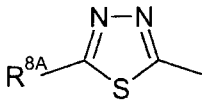
W.26



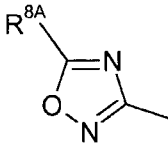
W.27



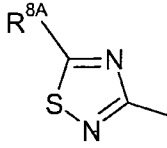
W.28



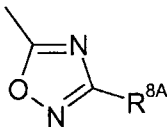
W.29



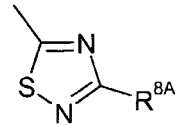
W.30



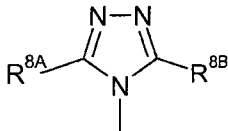
W.31



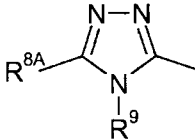
W.32



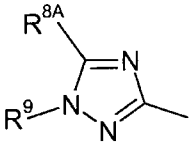
W.33



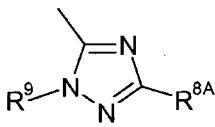
W.34



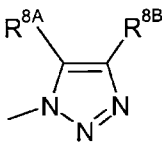
W.35



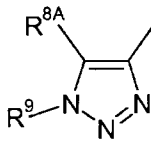
W.36



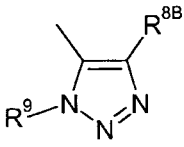
W.37



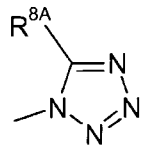
W.38



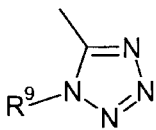
W.39



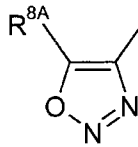
W.40



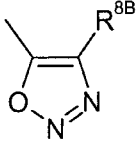
W.41



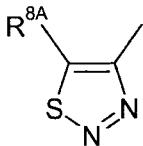
W.42



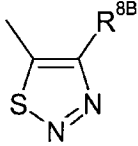
W.43



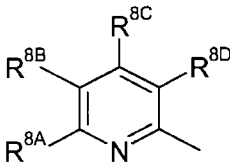
W.44



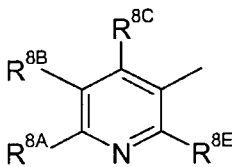
W.45



W.46



W.47



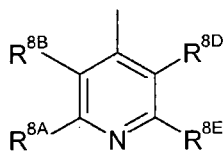
W.48

5

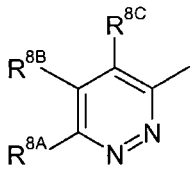
10

54

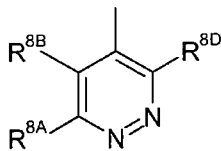
27



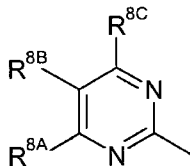
W.49



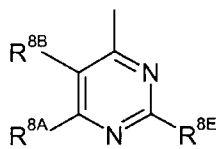
W.50



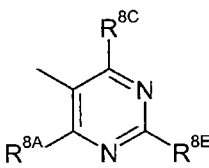
W.51



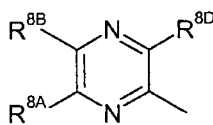
W.52



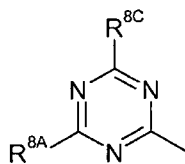
W.53



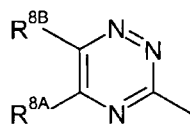
W.54



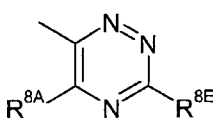
W.55



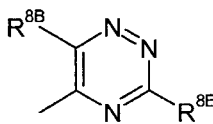
W.56



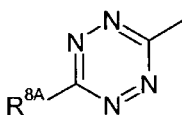
W.57



W.58



W.59



W.60

5

and wherein the free bond denotes the position of attachment in formula I.

- 10 More preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds, wherein W is selected from W.1, W.2, W.3, W.4, W.5, W.6, W.8, W.9, W.10, W.11, W.12, W.13, W.14, W.15, W.17, W.18, W.19, W.20, W.21, W.22, W.23, W.25, W.26, W.27, W.28, W.29, W.30, W.31, W.32, W.33, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 and W. 54.
- 15 Most preferred are 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds, wherein W is selected from W.1, W.3, W. 25, W.26, W.27, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 and W.54.
- 20 Preferred are also compounds of formula I, wherein W is selected from the following table H of monosubstituted heteroarylradicals (W-R.1 - W.R.512):

Table H:

Radical	W	R ^{8A}	R ^{8B}	R ^{8C}	R ^{8D}	R ^{8E}	R ⁹
W-R.1	W.1	H	H	H	/	/	/
W-R.2	W.1	CH ₃	H	H	/	/	/

55

W-R.3	W.1	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.4	W.1	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.5	W.1	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.6	W.1	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.7	W.1	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.8	W.1	Cl	H	H	/	/	/
W-R.9	W.1	H	Cl	H	/	/	/
W-R.10	W.1	H	H	Cl	/	/	/
W-R.11	W.2	H	H	/	H	/	/
W-R.12	W.2	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.13	W.2	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.14	W.2	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.15	W.2	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.16	W.2	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.17	W.2	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.18	W.2	Cl	H	/	H	/	/
W-R.19	W.2	H	Cl	/	H	/	/
W-R.20	W.2	H	H	/	Cl	/	/
W-R.21	W.3	H	H	H	/	/	/
W-R.22	W.3	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.23	W.3	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.24	W.3	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.25	W.3	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.26	W.3	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.27	W.3	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.28	W.3	Cl	H	H	/	/	/
W-R.29	W.3	H	Cl	H	/	/	/
W-R.30	W.3	H	H	Cl	/	/	/
W-R.31	W.4	H	H	/	H	/	/
W-R.32	W.4	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.33	W.4	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.34	W.4	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.35	W.4	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.36	W.4	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.37	W.4	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.38	W.4	Cl	H	/	H	/	/
W-R.39	W.4	H	Cl	/	H	/	/
W-R.40	W.4	H	H	/	Cl	/	/
W-R.41	W.5	H	H	H	/	/	H
W-R.42	W.5	CH ₃	H	H	/	/	H
W-R.43	W.5	H	CH ₃	H	/	/	H

56

W-R.44	W.5	H	H	CH ₃	/	/	H
W-R.45	W.5	CF ₃	H	H	/	/	H
W-R.46	W.5	H	CF ₃	H	/	/	H
W-R.47	W.5	H	H	CF ₃	/	/	H
W-R.48	W.5	Cl	H	H	/	/	H
W-R.49	W.5	H	Cl	H	/	/	H
W-R.50	W.5	H	H	Cl	/	/	H
W-R.51	W.5	H	H	H	/	/	CH ₃
W-R.52	W.5	CH ₃	H	H	/	/	CH ₃
W-R.53	W.5	H	CH ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.54	W.5	H	H	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.55	W.5	CF ₃	H	H	/	/	CH ₃
W-R.56	W.5	H	CF ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.57	W.5	H	H	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.58	W.5	Cl	H	H	/	/	CH ₃
W-R.59	W.5	H	Cl	H	/	/	CH ₃
W-R.60	W.5	H	H	Cl	/	/	CH ₃
W-R.61	W.6	H	H	/	H	/	H
W-R.62	W.6	CH ₃	H	/	H	/	H
W-R.63	W.6	H	CH ₃	/	H	/	H
W-R.64	W.6	H	H	/	CH ₃	/	H
W-R.65	W.6	CF ₃	H	/	H	/	H
W-R.66	W.6	H	CF ₃	/	H	/	H
W-R.67	W.6	H	H	/	CF ₃	/	H
W-R.68	W.6	Cl	H	/	H	/	H
W-R.69	W.6	H	Cl	/	H	/	H
W-R.70	W.6	H	H	/	Cl	/	H
W-R.71	W.6	H	H	/	H	/	CH ₃
W-R.72	W.6	CH ₃	H	/	H	/	CH ₃
W-R.73	W.6	H	CH ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.74	W.6	H	H	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.75	W.6	CF ₃	H	/	H	/	CH ₃
W-R.76	W.6	H	CF ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.77	W.6	H	H	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.78	W.6	Cl	H	/	H	/	CH ₃
W-R.79	W.6	H	Cl	/	H	/	CH ₃
W-R.80	W.6	H	H	/	Cl	/	CH ₃
W-R.81	W.7	H	H	H	H	/	/
W-R.82	W.7	CH ₃	H	H	H	/	/
W-R.83	W.7	H	CH ₃	H	H	/	/
W-R.84	W.7	H	H	CH ₃	H	/	/

57

W-R.85	W.7	H	H	H	CH ₃	/	/
W-R.86	W.7	CF ₃	H	H	H	/	/
W-R.87	W.7	H	CF ₃	H	H	/	/
W-R.88	W.7	H	H	CF ₃	H	/	/
W-R.89	W.7	H	H	H	CF ₃	/	/
W-R.90	W.7	Cl	H	H	H	/	/
W-R.91	W.7	H	Cl	H	H	/	/
W-R.92	W.7	H	H	Cl	H	/	/
W-R.93	W.7	H	H	H	Cl	/	/
W-R.94	W.8	H	H	/	/	/	/
W-R.95	W.8	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.96	W.8	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.97	W.8	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.98	W.8	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.99	W.8	H	Cl	/	/	/	/
W-R.100	W.8	Cl	H	/	/	/	/
W-R.101	W.9	H	/	/	H	/	/
W-R.102	W.9	CH ₃	/	/	H	/	/
W-R.103	W.9	H	/	/	CH ₃	/	/
W-R.104	W.9	CF ₃	/	/	H	/	/
W-R.105	W.9	H	/	/	CF ₃	/	/
W-R.106	W.9	Cl	/	/	H	/	/
W-R.107	W.9	H	/	/	Cl	/	/
W-R.108	W.10	/	H	/	H	/	/
W-R.109	W.10	/	H	/	CH ₃	/	/
W-R.110	W.10	/	CH ₃	/	H	/	/
W-R.111	W.10	/	H	/	CF ₃	/	/
W-R.112	W.10	/	CF ₃	/	H	/	/
W-R.113	W.10	/	H	/	Cl	/	/
W-R.114	W.10	/	Cl	/	H	/	/
W-R.115	W.11	H	H	/	/	/	/
W-R.116	W.11	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.117	W.11	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.118	W.11	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.119	W.11	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.120	W.11	H	Cl	/	/	/	/
W-R.121	W.11	Cl	H	/	/	/	/
W-R.122	W.12	H	/	/	H	/	/
W-R.123	W.12	CH ₃	/	/	H	/	/
W-R.124	W.12	H	/	/	CH ₃	/	/
W-R.125	W.12	CF ₃	/	/	H	/	/

W-R.126	W.12	H	/	/	CF ₃	/	/
W-R.127	W.12	Cl	/	/	H	/	/
W-R.128	W.12	H	/	/	Cl	/	/
W-R.129	W.13	/	H	/	H	/	/
W-R.130	W.13	/	H	/	CH ₃	/	/
W-R.131	W.13	/	CH ₃	/	H	/	/
W-R.132	W.13	/	H	/	CF ₃	/	/
W-R.133	W.13	/	CF ₃	/	H	/	/
W-R.134	W.13	/	H	/	Cl	/	/
W-R.135	W.13	/	Cl	/	H	/	/
W-R.136	W.14	H	H	/	/	/	H
W-R.137	W.14	H	CH ₃	/	/	/	H
W-R.138	W.14	CH ₃	H	/	/	/	H
W-R.139	W.14	H	CF ₃	/	/	/	H
W-R.140	W.14	CF ₃	H	/	/	/	H
W-R.141	W.14	H	Cl	/	/	/	H
W-R.142	W.14	Cl	H	/	/	/	H
W-R.143	W.14	H	H	/	/	/	CH ₃
W-R.144	W.14	H	CH ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.145	W.14	CH ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.146	W.14	H	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.147	W.14	CF ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.148	W.14	H	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.149	W.14	Cl	H	/	/	/	CH ₃
W-R.150	W.15	H	/	/	H	/	H
W-R.151	W.15	CH ₃	/	/	H	/	H
W-R.152	W.15	H	/	/	CH ₃	/	H
W-R.153	W.15	CF ₃	/	/	H	/	H
W-R.154	W.15	H	/	/	CF ₃	/	H
W-R.155	W.15	Cl	/	/	H	/	H
W-R.156	W.15	H	/	/	Cl	/	H
W-R.157	W.15	H	/	/	H	/	CH ₃
W-R.158	W.15	CH ₃	/	/	H	/	CH ₃
W-R.159	W.15	H	/	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.160	W.15	CF ₃	/	/	H	/	CH ₃
W-R.161	W.15	H	/	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.162	W.15	Cl	/	/	H	/	CH ₃
W-R.163	W.15	H	/	/	Cl	/	CH ₃
W-R.164	W.16	/	H	/	H	/	H
W-R.165	W.16	/	H	/	CH ₃	/	H
W-R.166	W.16	/	CH ₃	/	H	/	H

59

W-R.167	W.16	/	H	/	CF ₃	/	H
W-R.168	W.16	/	CF ₃	/	H	/	H
W-R.169	W.16	/	H	/	Cl	/	H
W-R.170	W.16	/	Cl	/	H	/	H
W-R.171	W.16	/	H	/	H	/	CH ₃
W-R.172	W.16	/	H	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.173	W.16	/	CH ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.174	W.16	/	H	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.175	W.16	/	CF ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.176	W.16	/	H	/	Cl	/	CH ₃
W-R.177	W.16	/	Cl	/	H	/	CH ₃
W-R.178	W.17	H	H	/	H	/	/
W-R.179	W.17	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.180	W.17	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.181	W.17	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.182	W.17	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.183	W.17	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.184	W.17	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.185	W.17	Cl	H	/	H	/	/
W-R.186	W.17	H	Cl	/	H	/	/
W-R.187	W.17	H	H	/	Cl	/	/
W-R.188	W.18	H	H	/	/	/	/
W-R.189	W.18	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.190	W.18	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.191	W.18	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.192	W.18	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.193	W.18	H	Cl	/	/	/	/
W-R.194	W.18	Cl	H	/	/	/	/
W-R.195	W.19	H	/	H	/	/	/
W-R.196	W.19	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.197	W.19	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.198	W.19	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.199	W.19	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.200	W.19	Cl	/	H	/	/	/
W-R.201	W.19	H	/	Cl	/	/	/
W-R.202	W.20	/	H	H	/	/	/
W-R.203	W.20	/	CH ₃	H	/	/	/
W-R.204	W.20	/	H	CH ₃	/	/	/
W-R.205	W.20	/	CF ₃	H	/	/	/
W-R.206	W.20	/	H	CF ₃	/	/	/
W-R.207	W.20	/	Cl	H	/	/	/

60

W-R.208	W.20	/	H	Cl	/	/	/
W-R.209	W.21	H	H	/	/	/	/
W-R.210	W.21	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.211	W.21	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.212	W.21	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.213	W.21	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.214	W.21	H	Cl	/	/	/	/
W-R.215	W.21	Cl	H	/	/	/	/
W-R.216	W.22	H	/	H	/	/	/
W-R.217	W.22	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.218	W.22	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.219	W.22	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.220	W.22	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.221	W.22	Cl	/	H	/	/	/
W-R.222	W.22	H	/	Cl	/	/	/
W-R.223	W.23	/	H	H	/	/	/
W-R.224	W.23	/	CH ₃	H	/	/	/
W-R.225	W.23	/	H	CH ₃	/	/	/
W-R.226	W.23	/	CF ₃	H	/	/	/
W-R.227	W.23	/	H	CF ₃	/	/	/
W-R.228	W.23	/	Cl	H	/	/	/
W-R.229	W.23	/	H	Cl	/	/	/
W-R.230	W.24	H	H	H	/	/	/
W-R.231	W.24	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.232	W.24	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.233	W.24	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.234	W.24	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.235	W.24	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.236	W.24	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.237	W.24	Cl	H	H	/	/	/
W-R.238	W.24	H	Cl	H	/	/	/
W-R.239	W.24	H	H	Cl	/	/	/
W-R.240	W.25	H	H	/	/	/	H
W-R.241	W.25	H	CH ₃	/	/	/	H
W-R.242	W.25	CH ₃	H	/	/	/	H
W-R.243	W.25	H	CF ₃	/	/	/	H
W-R.244	W.25	CF ₃	H	/	/	/	H
W-R.245	W.25	H	Cl	/	/	/	H
W-R.246	W.25	Cl	H	/	/	/	H
W-R.247	W.25	H	H	/	/	/	CH ₃
W-R.248	W.25	H	CH ₃	/	/	/	CH ₃

61

W-R.249	W.25	CH ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.250	W.25	H	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.251	W.25	CF ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.252	W.25	H	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.253	W.25	Cl	H	/	/	/	CH ₃
W-R.254	W.26	H	/	H	/	/	H
W-R.255	W.26	CH ₃	/	H	/	/	H
W-R.256	W.26	H	/	CH ₃	/	/	H
W-R.257	W.26	CF ₃	/	H	/	/	H
W-R.258	W.26	H	/	CF ₃	/	/	H
W-R.259	W.26	Cl	/	H	/	/	H
W-R.260	W.26	H	/	Cl	/	/	H
W-R.261	W.26	H	/	H	/	/	CH ₃
W-R.262	W.26	CH ₃	/	H	/	/	CH ₃
W-R.263	W.26	H	/	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.264	W.26	CF ₃	/	H	/	/	CH ₃
W-R.265	W.26	H	/	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.266	W.26	Cl	/	H	/	/	CH ₃
W-R.267	W.26	H	/	Cl	/	/	CH ₃
W-R.268	W.27	/	H	H	/	/	H
W-R.269	W.27	/	CH ₃	H	/	/	H
W-R.270	W.27	/	H	CH ₃	/	/	H
W-R.271	W.27	/	CF ₃	H	/	/	H
W-R.272	W.27	/	H	CF ₃	/	/	H
W-R.273	W.27	/	Cl	H	/	/	H
W-R.274	W.27	/	H	Cl	/	/	H
W-R.275	W.27	/	H	H	/	/	CH ₃
W-R.276	W.27	/	CH ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.277	W.27	/	H	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.278	W.27	/	CF ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.279	W.27	/	H	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.280	W.27	/	Cl	H	/	/	CH ₃
W-R.281	W.27	/	H	Cl	/	/	CH ₃
W-R.282	W.28	H	/	/	/	/	/
W-R.283	W.28	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.284	W.28	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.285	W.28	Cl	/	/	/	/	/
W-R.286	W.29	H	/	/	/	/	/
W-R.287	W.29	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.288	W.29	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.289	W.29	Cl	/	/	/	/	/

W-R.290	W.30	H	/	/	/	/	/
W-R.291	W.30	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.292	W.30	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.293	W.30	Cl	/	/	/	/	/
W-R.294	W.31	H	/	/	/	/	/
W-R.295	W.31	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.296	W.31	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.297	W.31	Cl	/	/	/	/	/
W-R.298	W.32	H	/	/	/	/	/
W-R.299	W.32	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.300	W.32	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.301	W.32	Cl	/	/	/	/	/
W-R.302	W.33	H	/	/	/	/	/
W-R.303	W.33	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.304	W.33	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.305	W.33	Cl	/	/	/	/	/
W-R.306	W.34	H	H	/	/	/	/
W-R.307	W.34	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.308	W.34	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.309	W.34	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.310	W.34	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.311	W.34	H	Cl	/	/	/	/
W-R.312	W.34	Cl	H	/	/	/	/
W-R.313	W.35	H	/	/	/	/	H
W-R.314	W.35	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.315	W.35	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.316	W.35	Cl	/	/	/	/	H
W-R.317	W.35	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.318	W.35	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.319	W.35	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.320	W.35	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.321	W.36	H	/	/	/	/	H
W-R.322	W.36	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.323	W.36	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.324	W.36	Cl	/	/	/	/	H
W-R.325	W.36	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.326	W.36	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.327	W.36	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.328	W.36	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.329	W.37	H	/	/	/	/	H
W-R.330	W.37	CH ₃	/	/	/	/	H

63

W-R.331	W.37	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.332	W.37	Cl	/	/	/	/	H
W-R.333	W.37	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.334	W.37	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.335	W.37	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.336	W.37	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.337	W.38	H	H	/	/	/	/
W-R.338	W.38	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.339	W.38	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.340	W.38	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.341	W.38	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.342	W.38	H	Cl	/	/	/	/
W-R.343	W.38	Cl	H	/	/	/	/
W-R.344	W.39	H	/	/	/	/	H
W-R.345	W.39	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.346	W.39	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.347	W.39	Cl	/	/	/	/	H
W-R.348	W.39	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.349	W.39	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.350	W.39	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.351	W.39	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.352	W.40	/	H	/	/	/	H
W-R.353	W.40	/	CH ₃	/	/	/	H
W-R.354	W.40	/	CF ₃	/	/	/	H
W-R.355	W.40	/	Cl	/	/	/	H
W-R.356	W.40	/	H	/	/	/	CH ₃
W-R.357	W.40	/	CH ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.358	W.40	/	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.359	W.40	/	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.360	W.41	H	/	/	/	/	/
W-R.361	W.41	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.362	W.41	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.363	W.41	Cl	/	/	/	/	/
W-R.364	W.42	/	/	/	/	/	H
W-R.365	W.42	/	/	/	/	/	CH ₃
W-R.366	W.43	H	/	/	/	/	/
W-R.367	W.43	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.368	W.43	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.369	W.43	Cl	/	/	/	/	/
W-R.370	W.44	/	H	/	/	/	/
W-R.371	W.44	/	CH ₃	/	/	/	/

W-R.372	W.44	/	CF ₃	/	/	/	/
W-R.373	W.44	/	Cl	/	/	/	/
W-R.374	W.45	H	/	/	/	/	/
W-R.375	W.45	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.376	W.45	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.377	W.45	Cl	/	/	/	/	/
W-R.378	W.46	/	H	/	/	/	/
W-R.379	W.46	/	CH ₃	/	/	/	/
W-R.380	W.46	/	CF ₃	/	/	/	/
W-R.381	W.46	/	Cl	/	/	/	/
W-R.382	W.47	H	H	H	H	/	/
W-R.383	W.47	CH ₃	H	H	H	/	/
W-R.384	W.47	H	CH ₃	H	H	/	/
W-R.385	W.47	H	H	CH ₃	H	/	/
W-R.386	W.47	H	H	H	CH ₃	/	/
W-R.387	W.47	CF ₃	H	H	H	/	/
W-R.388	W.47	H	CF ₃	H	H	/	/
W-R.389	W.47	H	H	CF ₃	H	/	/
W-R.390	W.47	H	H	H	CF ₃	/	/
W-R.391	W.47	Cl	H	H	H	/	/
W-R.392	W.47	H	Cl	H	H	/	/
W-R.393	W.47	H	H	Cl	H	/	/
W-R.394	W.47	H	H	H	Cl	/	/
W-R.395	W.48	H	H	H	/	H	/
W-R.396	W.48	CH ₃	H	H	/	H	/
W-R.397	W.48	H	CH ₃	H	/	H	/
W-R.398	W.48	H	H	CH ₃	/	H	/
W-R.399	W.48	H	H	H	/	CH ₃	/
W-R.400	W.48	CF ₃	H	H	/	H	/
W-R.401	W.48	H	CF ₃	H	/	H	/
W-R.402	W.48	H	H	CF ₃	/	H	/
W-R.403	W.48	H	H	H	/	CF ₃	/
W-R.404	W.48	Cl	H	H	/	H	/
W-R.405	W.48	H	Cl	H	/	H	/
W-R.406	W.48	H	H	Cl	/	H	/
W-R.407	W.48	H	H	H	/	Cl	/
W-R.408	W.49	H	H	/	H	H	/
W-R.409	W.49	CH ₃	H	/	H	H	/
W-R.410	W.49	H	CH ₃	/	H	H	/
W-R.411	W.49	H	H	/	CH ₃	H	/
W-R.412	W.49	H	H	/	H	CH ₃	/

W-R.413	W.49	CF ₃	H	/	H	H	/
W-R.414	W.49	H	CF ₃	/	H	H	/
W-R.415	W.49	H	H	/	CF ₃	H	/
W-R.416	W.49	H	H	/	H	CF ₃	/
W-R.417	W.49	Cl	H	/	H	H	/
W-R.418	W.49	H	Cl	/	H	H	/
W-R.419	W.49	H	H	/	Cl	H	/
W-R.420	W.49	H	H	/	H	Cl	/
W-R.421	W.50	H	H	H	/	/	/
W-R.422	W.50	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.423	W.50	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.424	W.50	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.425	W.50	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.426	W.50	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.427	W.50	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.428	W.50	Cl	H	H	/	/	/
W-R.429	W.50	H	Cl	H	/	/	/
W-R.430	W.50	H	H	Cl	/	/	/
W-R.431	W.51	H	H	/	H	/	/
W-R.432	W.51	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.433	W.51	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.434	W.51	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.435	W.51	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.436	W.51	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.437	W.51	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.438	W.51	Cl	H	/	H	/	/
W-R.439	W.51	H	Cl	/	H	/	/
W-R.440	W.51	H	H	/	Cl	/	/
W-R.441	W.52	H	H	H	/	/	/
W-R.442	W.52	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.443	W.52	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.444	W.52	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.445	W.52	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.446	W.52	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.447	W.52	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.448	W.52	Cl	H	H	/	/	/
W-R.449	W.52	H	Cl	H	/	/	/
W-R.450	W.52	H	H	Cl	/	/	/
W-R.451	W.53	H	H	/	/	H	/
W-R.452	W.53	CH ₃	H	/	/	H	/
W-R.453	W.53	H	CH ₃	/	/	H	/

66

W-R.454	W.53	H	H	/	/	CH ₃	/
W-R.455	W.53	CF ₃	H	/	/	H	/
W-R.456	W.53	H	CF ₃	/	/	H	/
W-R.457	W.53	H	H	/	/	CF ₃	/
W-R.458	W.53	Cl	H	/	/	H	/
W-R.459	W.53	H	Cl	/	/	H	/
W-R.460	W.53	H	H	/	/	Cl	/
W-R.461	W.54	H	/	H	/	H	/
W-R.462	W.54	CH ₃	/	H	/	H	/
W-R.463	W.54	H	/	CH ₃	/	H	/
W-R.464	W.54	H	/	H	/	CH ₃	/
W-R.465	W.54	CF ₃	/	H	/	H	/
W-R.466	W.54	H	/	CF ₃	/	H	/
W-R.467	W.54	H	/	H	/	CF ₃	/
W-R.468	W.54	Cl	/	H	/	H	/
W-R.469	W.54	H	/	Cl	/	H	/
W-R.470	W.54	H	/	H	/	Cl	/
W-R.471	W.55	H	H	/	H	/	/
W-R.472	W.55	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.473	W.55	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.474	W.55	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.475	W.55	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.476	W.55	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.477	W.55	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.478	W.55	Cl	H	/	H	/	/
W-R.479	W.55	H	Cl	/	H	/	/
W-R.480	W.55	H	H	/	Cl	/	/
W-R.481	W.56	H	/	H	/	/	/
W-R.482	W.56	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.483	W.56	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.484	W.56	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.485	W.56	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.486	W.56	Cl	/	H	/	/	/
W-R.487	W.56	H	/	Cl	/	/	/
W-R.488	W.57	H	H	/	/	/	/
W-R.489	W.57	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.490	W.57	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.491	W.57	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.492	W.57	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.493	W.57	H	Cl	/	/	/	/
W-R.494	W.57	Cl	H	/	/	/	/

W-R.495	W.58	H	/	/	/	H	/
W-R.496	W.58	CH ₃	/	/	/	H	/
W-R.497	W.58	H	/	/	/	CH ₃	/
W-R.498	W.58	CF ₃	/	/	/	H	/
W-R.499	W.58	H	/	/	/	CF ₃	/
W-R.500	W.58	Cl	/	/	/	H	/
W-R.501	W.58	H	/	/	/	Cl	/
W-R.502	W.59	/	H	/	/	H	/
W-R.503	W.59	/	CH ₃	/	/	H	/
W-R.504	W.59	/	H	/	/	CH ₃	/
W-R.505	W.59	/	CF ₃	/	/	H	/
W-R.506	W.59	/	H	/	/	CF ₃	/
W-R.507	W.59	/	Cl	/	/	H	/
W-R.508	W.59	/	H	/	/	Cl	/
W-R.509	W.60	H	/	/	/	/	/
W-R.510	W.60	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.511	W.60	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.512	W.60	Cl	/	/	/	/	/

Preferred 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds are described in the following tables:

5

1. Tables 1 - 1910:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.1 radical defined as W-R.1 to W-R.10 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

10

2. Tables 1911 - 3820:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.2 radical defined as W-R.11 to W-R.20 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

15

3. Tables 3821 - 5730:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.3 radical defined as W-R.21 to W-R.30 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

20

4. Tables 5731 - 7640:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.4 radical defined as W-R.31 to W-R.40 in table H and the phenyl radical

68

derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

5. Tables 7641 - 11460:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.5 radical defined as W-R.41 to W-R.60 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
5
6. Tables 11461 - 15280:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.6 radical defined as W-R.61 to W-R.80 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
10
7. Tables 15281 - 17763:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.7 radical defined as W-R.81 to W-R.93 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
15
8. Tables 17764 - 19100:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.8 radical defined as W-R.94 to W-R.100 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
20
9. Tables 19101 - 20437:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.9 radical defined as W-R.101 to W-R.107 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
25
10. Tables 20438 - 21774:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.10 radical defined as W-R.108 to W-R.114 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
30
11. Tables 21775 - 23111:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.11 radical defined as W-R.115 to W-R.121 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
35
12. Tables 23112 - 24448:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
40

69

any W.12 radical defined as W-R.122 to W-R.128 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 13. Tables 24449 - 25785:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.13 radical defined as W-R.129 to W-R.135 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 10 14. Tables 25786 - 28459:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.14 radical defined as W-R.136 to W-R.149 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
15 c) or d).
- 15 15. Tables 28460 - 31133:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.15 radical defined as W-R.150 to W-R.163 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
20 c) or d).
- 25 16. Tables 31134 - 33807:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.16 radical defined as W-R.164 to W-R.177 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 30 17. Tables 33808 - 35717:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.17 radical defined as W-R.178 to W-R.187 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 35 18. Tables 35718 - 37054:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.18 radical defined as W-R.188 to W-R.194 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 40 19. Tables 37055 - 38391:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to

any W.19 radical defined as W-R.195 to W-R.201 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 20. Tables 38392 - 39728:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.20 radical defined as W-R.202 to W-R.208 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 10 21. Tables 39729 - 41065:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.21 radical defined as W-R.209 to W-R.215 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 15 22. Tables 41066 - 42024:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.22 radical defined as W-R.216 to W-R.222 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 20 23. Tables 42403 - 43739:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.23 radical defined as W-R.223 to W-R.229 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 25 24. Tables 43740 - 45649:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.24 radical defined as W-R.230 to W-R.239 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 30 25. Tables 45650 - 48323:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.25 radical defined as W-R.240 to W-R.253 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 35 26. Tables 48324 - 50997:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
- 40

any W.26 radical defined as W-R.254 to W-R.267 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 27. Tables 50998 - 53671:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.27 radical defined as W-R.268 to W-R.281 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 10 28. Tables 53672 - 54435:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.28 radical defined as W-R.282 to W-R.285 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 15 29. Tables 54436 - 55199:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.29 radical defined as W-R.286 to W-R.289 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 20 30. Tables 55200 - 55963:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.30 radical defined as W-R.290 to W-R.293 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 25 31. Tables 55964 - 56727:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.31 radical defined as W-R.294 to W-R.297 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 30 32. Tables 56728 - 57491:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.32 radical defined as W-R.298 to W-R.301 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 35 33. Tables 57492 - 58255:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
- 40

72

any W.33 radical defined as W-R.302 to W-R.305 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 34. Tables 58256 - 59592:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.34 radical defined as W-R.306 to W-R.312 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 10 35. Tables 59593 - 61120:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.35 radical defined as W-R.313 to W-R.320 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
15 c) or d).
- 20 36. Tables 61121 - 62648:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.36 radical defined as W-R.321 to W-R.328 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 25 37. Tables 62649 - 64179:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.37 radical defined as W-R.329 to W-R.336 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 30 38. Tables 64177 - 65513:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.38 radical defined as W-R.337 to W-R.343 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 35 39. Tables 65514 - 67041:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
any W.39 radical defined as W-R.344 to W-R.351 in table H and the phenyl
radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b)
c) or d).
- 40 40. Tables 67042 - 68569:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to

any W.41 radical defined as W-R.352 to W-R.359 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 41. Tables 68570 - 69333:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.41 radical defined as W-R.360 to W-R.363 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 10 42. Tables 69334 - 69715:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.42 radical defined as W-R.364 and W-R.365 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 15 43. Tables 69716 - 70479:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.43 radical defined as W-R.366 to W-R.369 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 20 44. Tables 70480 - 71243:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.44 radical defined as W-R.370 to W-R.373 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 25 45. Tables 71243 - 72007:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.45 radical defined as W-R.374 to W-R.377 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 30 46. Tables 72008 - 72771:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.46 radical defined as W-R.378 to W-R.381 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 35 47. Tables 72772 - 75254:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
- 40

any W.47 radical defined as W-R.382 to W-R.394 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

- 5 48. Tables 75255 - 77737:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.48 radical defined as W-R.395 to W-R.407 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 10 49. Tables 77738 - 80220:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.49 radical defined as W-R.408 to W-R.420 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 15 50. Tables 80221 - 82130:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.50 radical defined as W-R.421 to W-R.430 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 20 51. Tables 82131 - 84040:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.51 radical defined as W-R.431 to W-R.440 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 25 52. Tables 84041 - 85950:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.52 radical defined as W-R.441 to W-R.450 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 30 53. Tables 85951 - 87860:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.53 radical defined as W-R.451 to W-R.460 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).
- 35 54. Tables 87861 - 89770:
Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to
- 40

any W.54 radical defined as W-R.461 to W-R.470 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

5 55. Tables 89771 - 91680:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.55 radical defined as W-R.471 to W-R.480 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

10

56. Tables 91681 - 93017:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.56 radical defined as W-R.481 to W-R.487 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

15

57. Tables 93018 - 94354:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.57 radical defined as W-R.488 to W-R.494 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

20

58. Tables 94355 - 95691:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.58 radical defined as W-R.495 to W-R.501 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

25

59. Tables 95692 - 97028:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.59 radical defined as W-R.502 to W-R.508 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

30

35 60. Tables 97029 - 97792:

Compounds of formula I, wherein the hetaryl radical derivative W corresponds to any W.60 radical defined as W-R.509 to W-R.512 in table H and the phenyl radical derivative B corresponds to any phenyl radical B.0 to B.190 in lists a), b) c) or d).

40

Especially preferred are compounds of formula I defined in the following table A, wherein R¹, R² and R³ are hydrogen;

78

A is A² and R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} and R^{4d} are hydrogen and X is sulfur;
and wherein R⁶ is hydrogen:

Table A:

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.1	B.0	W-R.1
formula I.2	B.1	W-R.1
formula I.3	B.2	W-R.1
formula I.4	B.3	W-R.1
formula I.5	B.4	W-R.1
formula I.6	B.5	W-R.1
formula I.7	B.6	W-R.1
formula I.8	B.7	W-R.1
formula I.9	B.8	W-R.1
formula I.10	B.9	W-R.1
formula I.11	B.10	W-R.1
formula I.12	B.11	W-R.1
formula I.13	B.12	W-R.1
formula I.14	B.13	W-R.1
formula I.15	B.14	W-R.1
formula I.16	B.15	W-R.1
formula I.17	B.16	W-R.1
formula I.18	B.17	W-R.1
formula I.19	B.18	W-R.1
formula I.20	B.19	W-R.1
formula I.21	B.20	W-R.1
formula I.22	B.21	W-R.1
formula I.23	B.22	W-R.1
formula I.24	B.23	W-R.1
formula I.25	B.24	W-R.1
formula I.26	B.25	W-R.1
formula I.27	B.26	W-R.1
formula I.28	B.27	W-R.1
formula I.29	B.28	W-R.1
formula I.30	B.29	W-R.1
formula I.31	B.30	W-R.1
formula I.32	B.31	W-R.1
formula I.33	B.32	W-R.1
formula I.34	B.33	W-R.1
formula I.35	B.34	W-R.1
formula I.36	B.35	W-R.1

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.37	B.36	W-R.1
formula I.38	B.37	W-R.1
formula I.39	B.38	W-R.1
formula I.40	B.39	W-R.1
formula I.41	B.40	W-R.1
formula I.42	B.41	W-R.1
formula I.43	B.42	W-R.1
formula I.44	B.43	W-R.1
formula I.45	B.44	W-R.1
formula I.46	B.45	W-R.1
formula I.47	B.46	W-R.1
formula I.48	B.47	W-R.1
formula I.49	B.48	W-R.1
formula I.50	B.49	W-R.1
formula I.51	B.50	W-R.1
formula I.52	B.51	W-R.1
formula I.53	B.52	W-R.1
formula I.54	B.53	W-R.1
formula I.55	B.54	W-R.1
formula I.56	B.55	W-R.1
formula I.57	B.56	W-R.1
formula I.58	B.57	W-R.1
formula I.59	B.58	W-R.1
formula I.60	B.59	W-R.1
formula I.61	B.60	W-R.1
formula I.62	B.61	W-R.1
formula I.63	B.62	W-R.1
formula I.64	B.63	W-R.1
formula I.65	B.64	W-R.1
formula I.66	B.65	W-R.1
formula I.67	B.66	W-R.1
formula I.68	B.67	W-R.1
formula I.69	B.68	W-R.1
formula I.70	B.69	W-R.1
formula I.71	B.70	W-R.1
formula I.72	B.71	W-R.1
formula I.73	B.72	W-R.1
formula I.74	B.73	W-R.1
formula I.75	B.74	W-R.1
formula I.76	B.75	W-R.1

78

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.77	B.76	W-R.1
formula I.78	B.77	W-R.1
formula I.79	B.78	W-R.1
formula I.80	B.79	W-R.1
formula I.81	B.80	W-R.1
formula I.82	B.81	W-R.1
formula I.83	B.82	W-R.1
formula I.84	B.83	W-R.1
formula I.85	B.84	W-R.1
formula I.86	B.85	W-R.1
formula I.87	B.86	W-R.1
formula I.88	B.87	W-R.1
formula I.89	B.88	W-R.1
formula I.90	B.89	W-R.1
formula I.91	B.90	W-R.1
formula I.92	B.91	W-R.1
formula I.93	B.92	W-R.1
formula I.94	B.93	W-R.1
formula I.95	B.94	W-R.1
formula I.96	B.95	W-R.1
formula I.97	B.96	W-R.1
formula I.98	B.97	W-R.1
formula I.99	B.98	W-R.1
formula I.100	B.99	W-R.1
formula I.101	B.100	W-R.1
formula I.102	B.101	W-R.1
formula I.103	B.102	W-R.1
formula I.104	B.103	W-R.1
formula I.105	B.104	W-R.1
formula I.106	B.105	W-R.1
formula I.107	B.106	W-R.1
formula I.108	B.107	W-R.1
formula I.109	B.108	W-R.1
formula I.110	B.109	W-R.1
formula I.111	B.110	W-R.1
formula I.112	B.111	W-R.1
formula I.113	B.112	W-R.1
formula I.114	B.113	W-R.1
formula I.115	B.114	W-R.1
formula I.116	B.115	W-R.1

79

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.117	B.116	W-R.1
formula I.118	B.117	W-R.1
formula I.119	B.118	W-R.1
formula I.120	B.119	W-R.1
formula I.121	B.120	W-R.1
formula I.122	B.121	W-R.1
formula I.123	B.122	W-R.1
formula I.124	B.123	W-R.1
formula I.125	B.124	W-R.1
formula I.126	B.125	W-R.1
formula I.127	B.126	W-R.1
formula I.128	B.127	W-R.1
formula I.129	B.128	W-R.1
formula I.130	B.129	W-R.1
formula I.131	B.130	W-R.1
formula I.132	B.131	W-R.1
formula I.133	B.132	W-R.1
formula I.134	B.133	W-R.1
formula I.135	B.134	W-R.1
formula I.136	B.135	W-R.1
formula I.137	B.136	W-R.1
formula I.138	B.137	W-R.1
formula I.139	B.138	W-R.1
formula I.140	B.139	W-R.1
formula I.141	B.140	W-R.1
formula I.142	B.141	W-R.1
formula I.143	B.142	W-R.1
formula I.144	B.143	W-R.1
formula I.145	B.144	W-R.1
formula I.146	B.145	W-R.1
formula I.147	B.146	W-R.1
formula I.148	B.147	W-R.1
formula I.149	B.148	W-R.1
formula I.150	B.149	W-R.1
formula I.151	B.150	W-R.1
formula I.152	B.151	W-R.1
formula I.153	B.152	W-R.1
formula I.154	B.153	W-R.1
formula I.155	B.154	W-R.1
formula I.156	B.155	W-R.1

80

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.157	B.156	W-R.1
formula I.158	B.157	W-R.1
formula I.159	B.158	W-R.1
formula I.160	B.159	W-R.1
formula I.161	B.160	W-R.1
formula I.162	B.161	W-R.1
formula I.163	B.162	W-R.1
formula I.164	B.163	W-R.1
formula I.165	B.164	W-R.1
formula I.166	B.165	W-R.1
formula I.167	B.166	W-R.1
formula I.168	B.167	W-R.1
formula I.169	B.168	W-R.1
formula I.170	B.169	W-R.1
formula I.171	B.170	W-R.1
formula I.172	B.171	W-R.1
formula I.173	B.172	W-R.1
formula I.174	B.173	W-R.1
formula I.175	B.174	W-R.1
formula I.176	B.175	W-R.1
formula I.177	B.176	W-R.1
formula I.178	B.177	W-R.1
formula I.179	B.178	W-R.1
formula I.180	B.179	W-R.1
formula I.181	B.180	W-R.1
formula I.182	B.181	W-R.1
formula I.183	B.182	W-R.1
formula I.184	B.183	W-R.1
formula I.185	B.184	W-R.1
formula I.186	B.185	W-R.1
formula I.187	B.186	W-R.1
formula I.188	B.187	W-R.1
formula I.189	B.188	W-R.1
formula I.190	B.189	W-R.1
formula I.191	B.190	W-R.1
formula I.192	B.0	W-R.21
formula I.193	B.1	W-R.21
formula I.194	B.2	W-R.21
formula I.195	B.3	W-R.21
formula I.196	B.4	W-R.21

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.197	B.5	W-R.21
formula I.198	B.6	W-R.21
formula I.199	B.7	W-R.21
formula I.200	B.8	W-R.21
formula I.201	B.9	W-R.21
formula I.202	B.10	W-R.21
formula I.203	B.11	W-R.21
formula I.204	B.12	W-R.21
formula I.205	B.13	W-R.21
formula I.206	B.14	W-R.21
formula I.207	B.15	W-R.21
formula I.208	B.16	W-R.21
formula I.209	B.17	W-R.21
formula I.210	B.18	W-R.21
formula I.211	B.19	W-R.21
formula I.212	B.20	W-R.21
formula I.213	B.21	W-R.21
formula I.214	B.22	W-R.21
formula I.215	B.23	W-R.21
formula I.216	B.24	W-R.21
formula I.217	B.25	W-R.21
formula I.218	B.26	W-R.21
formula I.219	B.27	W-R.21
formula I.220	B.28	W-R.21
formula I.221	B.29	W-R.21
formula I.222	B.30	W-R.21
formula I.223	B.31	W-R.21
formula I.224	B.32	W-R.21
formula I.225	B.33	W-R.21
formula I.226	B.34	W-R.21
formula I.227	B.35	W-R.21
formula I.228	B.36	W-R.21
formula I.229	B.37	W-R.21
formula I.230	B.38	W-R.21
formula I.231	B.39	W-R.21
formula I.232	B.40	W-R.21
formula I.233	B.41	W-R.21
formula I.234	B.42	W-R.21
formula I.235	B.43	W-R.21
formula I.236	B.44	W-R.21

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.237	B.45	W-R.21
formula I.238	B.46	W-R.21
formula I.239	B.47	W-R.21
formula I.240	B.48	W-R.21
formula I.241	B.49	W-R.21
formula I.242	B.50	W-R.21
formula I.243	B.51	W-R.21
formula I.244	B.52	W-R.21
formula I.245	B.53	W-R.21
formula I.246	B.54	W-R.21
formula I.247	B.55	W-R.21
formula I.248	B.56	W-R.21
formula I.249	B.57	W-R.21
formula I.250	B.58	W-R.21
formula I.251	B.59	W-R.21
formula I.252	B.60	W-R.21
formula I.253	B.61	W-R.21
formula I.254	B.62	W-R.21
formula I.255	B.63	W-R.21
formula I.256	B.64	W-R.21
formula I.257	B.65	W-R.21
formula I.258	B.66	W-R.21
formula I.259	B.67	W-R.21
formula I.260	B.68	W-R.21
formula I.261	B.69	W-R.21
formula I.262	B.70	W-R.21
formula I.263	B.71	W-R.21
formula I.264	B.72	W-R.21
formula I.265	B.73	W-R.21
formula I.266	B.74	W-R.21
formula I.267	B.75	W-R.21
formula I.268	B.76	W-R.21
formula I.269	B.77	W-R.21
formula I.270	B.78	W-R.21
formula I.271	B.79	W-R.21
formula I.272	B.80	W-R.21
formula I.273	B.81	W-R.21
formula I.274	B.82	W-R.21
formula I.275	B.83	W-R.21
formula I.276	B.84	W-R.21

83

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.277	B.85	W-R.21
formula I.278	B.86	W-R.21
formula I.279	B.87	W-R.21
formula I.280	B.88	W-R.21
formula I.281	B.89	W-R.21
formula I.282	B.90	W-R.21
formula I.283	B.91	W-R.21
formula I.284	B.92	W-R.21
formula I.285	B.93	W-R.21
formula I.286	B.94	W-R.21
formula I.287	B.95	W-R.21
formula I.288	B.96	W-R.21
formula I.289	B.97	W-R.21
formula I.290	B.98	W-R.21
formula I.291	B.99	W-R.21
formula I.292	B.100	W-R.21
formula I.293	B.101	W-R.21
formula I.294	B.102	W-R.21
formula I.295	B.103	W-R.21
formula I.296	B.104	W-R.21
formula I.297	B.105	W-R.21
formula I.298	B.106	W-R.21
formula I.299	B.107	W-R.21
formula I.300	B.108	W-R.21
formula I.301	B.109	W-R.21
formula I.302	B.110	W-R.21
formula I.303	B.111	W-R.21
formula I.304	B.112	W-R.21
formula I.305	B.113	W-R.21
formula I.306	B.114	W-R.21
formula I.307	B.115	W-R.21
formula I.308	B.116	W-R.21
formula I.309	B.117	W-R.21
formula I.310	B.118	W-R.21
formula I.311	B.119	W-R.21
formula I.312	B.120	W-R.21
formula I.313	B.121	W-R.21
formula I.314	B.122	W-R.21
formula I.315	B.123	W-R.21
formula I.316	B.124	W-R.21

24

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.317	B.125	W-R.21
formula I.318	B.126	W-R.21
formula I.319	B.127	W-R.21
formula I.320	B.128	W-R.21
formula I.321	B.129	W-R.21
formula I.322	B.130	W-R.21
formula I.323	B.131	W-R.21
formula I.324	B.132	W-R.21
formula I.325	B.133	W-R.21
formula I.326	B.134	W-R.21
formula I.327	B.135	W-R.21
formula I.328	B.136	W-R.21
formula I.329	B.137	W-R.21
formula I.330	B.138	W-R.21
formula I.331	B.139	W-R.21
formula I.332	B.140	W-R.21
formula I.333	B.141	W-R.21
formula I.334	B.142	W-R.21
formula I.335	B.143	W-R.21
formula I.336	B.144	W-R.21
formula I.337	B.145	W-R.21
formula I.338	B.146	W-R.21
formula I.339	B.147	W-R.21
formula I.340	B.148	W-R.21
formula I.341	B.149	W-R.21
formula I.342	B.150	W-R.21
formula I.343	B.151	W-R.21
formula I.344	B.152	W-R.21
formula I.345	B.153	W-R.21
formula I.346	B.154	W-R.21
formula I.347	B.155	W-R.21
formula I.348	B.156	W-R.21
formula I.349	B.157	W-R.21
formula I.350	B.158	W-R.21
formula I.351	B.159	W-R.21
formula I.352	B.160	W-R.21
formula I.353	B.161	W-R.21
formula I.354	B.162	W-R.21
formula I.355	B.163	W-R.21
formula I.356	B.164	W-R.21

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.357	B.165	W-R.21
formula I.358	B.166	W-R.21
formula I.359	B.167	W-R.21
formula I.360	B.168	W-R.21
formula I.361	B.169	W-R.21
formula I.362	B.170	W-R.21
formula I.363	B.171	W-R.21
formula I.364	B.172	W-R.21
formula I.365	B.173	W-R.21
formula I.366	B.174	W-R.21
formula I.367	B.175	W-R.21
formula I.368	B.176	W-R.21
formula I.369	B.177	W-R.21
formula I.370	B.178	W-R.21
formula I.371	B.179	W-R.21
formula I.372	B.180	W-R.21
formula I.373	B.181	W-R.21
formula I.374	B.182	W-R.21
formula I.375	B.183	W-R.21
formula I.376	B.184	W-R.21
formula I.377	B.185	W-R.21
formula I.378	B.186	W-R.21
formula I.379	B.187	W-R.21
formula I.380	B.188	W-R.21
formula I.381	B.189	W-R.21
formula I.382	B.190	W-R.21
formula I.383	B.0	W-R.392
formula I.384	B.1	W-R.392
formula I.385	B.2	W-R.392
formula I.386	B.3	W-R.392
formula I.387	B.4	W-R.392
formula I.388	B.5	W-R.392
formula I.389	B.6	W-R.392
formula I.390	B.7	W-R.392
formula I.391	B.8	W-R.392
formula I.392	B.9	W-R.392
formula I.393	B.10	W-R.392
formula I.394	B.11	W-R.392
formula I.395	B.12	W-R.392
formula I.396	B.13	W-R.392

86

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.397	B.14	W-R.392
formula I.398	B.15	W-R.392
formula I.399	B.16	W-R.392
formula I.400	B.17	W-R.392
formula I.401	B.18	W-R.392
formula I.402	B.19	W-R.392
formula I.403	B.20	W-R.392
formula I.404	B.21	W-R.392
formula I.405	B.22	W-R.392
formula I.406	B.23	W-R.392
formula I.407	B.24	W-R.392
formula I.408	B.25	W-R.392
formula I.409	B.26	W-R.392
formula I.410	B.27	W-R.392
formula I.411	B.28	W-R.392
formula I.412	B.29	W-R.392
formula I.413	B.30	W-R.392
formula I.414	B.31	W-R.392
formula I.415	B.32	W-R.392
formula I.416	B.33	W-R.392
formula I.417	B.34	W-R.392
formula I.418	B.35	W-R.392
formula I.419	B.36	W-R.392
formula I.420	B.37	W-R.392
formula I.421	B.38	W-R.392
formula I.422	B.39	W-R.392
formula I.423	B.40	W-R.392
formula I.424	B.41	W-R.392
formula I.425	B.42	W-R.392
formula I.426	B.43	W-R.392
formula I.427	B.44	W-R.392
formula I.428	B.45	W-R.392
formula I.429	B.46	W-R.392
formula I.430	B.47	W-R.392
formula I.431	B.48	W-R.392
formula I.432	B.49	W-R.392
formula I.433	B.50	W-R.392
formula I.434	B.51	W-R.392
formula I.435	B.52	W-R.392
formula I.436	B.53	W-R.392

87

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.437	B.54	W-R.392
formula I.438	B.55	W-R.392
formula I.439	B.56	W-R.392
formula I.440	B.57	W-R.392
formula I.441	B.58	W-R.392
formula I.442	B.59	W-R.392
formula I.443	B.60	W-R.392
formula I.444	B.61	W-R.392
formula I.445	B.62	W-R.392
formula I.446	B.63	W-R.392
formula I.447	B.64	W-R.392
formula I.448	B.65	W-R.392
formula I.449	B.66	W-R.392
formula I.450	B.67	W-R.392
formula I.451	B.68	W-R.392
formula I.452	B.69	W-R.392
formula I.453	B.70	W-R.392
formula I.454	B.71	W-R.392
formula I.455	B.72	W-R.392
formula I.456	B.73	W-R.392
formula I.457	B.74	W-R.392
formula I.458	B.75	W-R.392
formula I.459	B.76	W-R.392
formula I.460	B.77	W-R.392
formula I.461	B.78	W-R.392
formula I.462	B.79	W-R.392
formula I.463	B.80	W-R.392
formula I.464	B.81	W-R.392
formula I.465	B.82	W-R.392
formula I.466	B.83	W-R.392
formula I.467	B.84	W-R.392
formula I.468	B.85	W-R.392
formula I.469	B.86	W-R.392
formula I.470	B.87	W-R.392
formula I.471	B.88	W-R.392
formula I.472	B.89	W-R.392
formula I.473	B.90	W-R.392
formula I.474	B.91	W-R.392
formula I.475	B.92	W-R.392
formula I.476	B.93	W-R.392

88

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.477	B.94	W-R.392
formula I.478	B.95	W-R.392
formula I.479	B.96	W-R.392
formula I.480	B.97	W-R.392
formula I.481	B.98	W-R.392
formula I.482	B.99	W-R.392
formula I.483	B.100	W-R.392
formula I.484	B.101	W-R.392
formula I.485	B.102	W-R.392
formula I.486	B.103	W-R.392
formula I.487	B.104	W-R.392
formula I.488	B.105	W-R.392
formula I.489	B.106	W-R.392
formula I.490	B.107	W-R.392
formula I.491	B.108	W-R.392
formula I.492	B.109	W-R.392
formula I.493	B.110	W-R.392
formula I.494	B.111	W-R.392
formula I.495	B.112	W-R.392
formula I.496	B.113	W-R.392
formula I.497	B.114	W-R.392
formula I.498	B.115	W-R.392
formula I.499	B.116	W-R.392
formula I.500	B.117	W-R.392
formula I.501	B.118	W-R.392
formula I.502	B.119	W-R.392
formula I.503	B.120	W-R.392
formula I.504	B.121	W-R.392
formula I.505	B.122	W-R.392
formula I.506	B.123	W-R.392
formula I.507	B.124	W-R.392
formula I.508	B.125	W-R.392
formula I.509	B.126	W-R.392
formula I.510	B.127	W-R.392
formula I.511	B.128	W-R.392
formula I.512	B.129	W-R.392
formula I.513	B.130	W-R.392
formula I.514	B.131	W-R.392
formula I.515	B.132	W-R.392
formula I.516	B.133	W-R.392

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.517	B.134	W-R.392
formula I.518	B.135	W-R.392
formula I.519	B.136	W-R.392
formula I.520	B.137	W-R.392
formula I.521	B.138	W-R.392
formula I.522	B.139	W-R.392
formula I.523	B.140	W-R.392
formula I.524	B.141	W-R.392
formula I.525	B.142	W-R.392
formula I.526	B.143	W-R.392
formula I.527	B.144	W-R.392
formula I.528	B.145	W-R.392
formula I.529	B.146	W-R.392
formula I.530	B.147	W-R.392
formula I.531	B.148	W-R.392
formula I.532	B.149	W-R.392
formula I.533	B.150	W-R.392
formula I.534	B.151	W-R.392
formula I.535	B.152	W-R.392
formula I.536	B.153	W-R.392
formula I.537	B.154	W-R.392
formula I.538	B.155	W-R.392
formula I.539	B.156	W-R.392
formula I.540	B.157	W-R.392
formula I.541	B.158	W-R.392
formula I.542	B.159	W-R.392
formula I.543	B.160	W-R.392
formula I.544	B.161	W-R.392
formula I.545	B.162	W-R.392
formula I.546	B.163	W-R.392
formula I.547	B.164	W-R.392
formula I.548	B.165	W-R.392
formula I.549	B.166	W-R.392
formula I.550	B.167	W-R.392
formula I.551	B.168	W-R.392
formula I.552	B.169	W-R.392
formula I.553	B.170	W-R.392
formula I.554	B.171	W-R.392
formula I.555	B.172	W-R.392
formula I.556	B.173	W-R.392

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.557	B.174	W-R.392
formula I.558	B.175	W-R.392
formula I.559	B.176	W-R.392
formula I.560	B.177	W-R.392
formula I.561	B.178	W-R.392
formula I.562	B.179	W-R.392
formula I.563	B.180	W-R.392
formula I.564	B.181	W-R.392
formula I.565	B.182	W-R.392
formula I.566	B.183	W-R.392
formula I.567	B.184	W-R.392
formula I.568	B.185	W-R.392
formula I.569	B.186	W-R.392
formula I.570	B.187	W-R.392
formula I.571	B.188	W-R.392
formula I.572	B.189	W-R.392
formula I.573	B.190	W-R.392
formula I.574	B.0	W-R.405
formula I.575	B.1	W-R.405
formula I.576	B.2	W-R.405
formula I.577	B.3	W-R.405
formula I.578	B.4	W-R.405
formula I.579	B.5	W-R.405
formula I.580	B.6	W-R.405
formula I.581	B.7	W-R.405
formula I.582	B.8	W-R.405
formula I.583	B.9	W-R.405
formula I.584	B.10	W-R.405
formula I.585	B.11	W-R.405
formula I.586	B.12	W-R.405
formula I.587	B.13	W-R.405
formula I.588	B.14	W-R.405
formula I.589	B.15	W-R.405
formula I.590	B.16	W-R.405
formula I.591	B.17	W-R.405
formula I.592	B.18	W-R.405
formula I.593	B.19	W-R.405
formula I.594	B.20	W-R.405
formula I.595	B.21	W-R.405
formula I.596	B.22	W-R.405

91

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.597	B.23	W-R.405
formula I.598	B.24	W-R.405
formula I.599	B.25	W-R.405
formula I.600	B.26	W-R.405
formula I.601	B.27	W-R.405
formula I.602	B.28	W-R.405
formula I.603	B.29	W-R.405
formula I.604	B.30	W-R.405
formula I.605	B.31	W-R.405
formula I.606	B.32	W-R.405
formula I.607	B.33	W-R.405
formula I.608	B.34	W-R.405
formula I.609	B.35	W-R.405
formula I.610	B.36	W-R.405
formula I.611	B.37	W-R.405
formula I.612	B.38	W-R.405
formula I.613	B.39	W-R.405
formula I.614	B.40	W-R.405
formula I.615	B.41	W-R.405
formula I.616	B.42	W-R.405
formula I.617	B.43	W-R.405
formula I.618	B.44	W-R.405
formula I.619	B.45	W-R.405
formula I.620	B.46	W-R.405
formula I.621	B.47	W-R.405
formula I.622	B.48	W-R.405
formula I.623	B.49	W-R.405
formula I.624	B.50	W-R.405
formula I.625	B.51	W-R.405
formula I.626	B.52	W-R.405
formula I.627	B.53	W-R.405
formula I.628	B.54	W-R.405
formula I.629	B.55	W-R.405
formula I.630	B.56	W-R.405
formula I.631	B.57	W-R.405
formula I.632	B.58	W-R.405
formula I.633	B.59	W-R.405
formula I.634	B.60	W-R.405
formula I.635	B.61	W-R.405
formula I.636	B.62	W-R.405

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.637	B.63	W-R.405
formula I.638	B.64	W-R.405
formula I.639	B.65	W-R.405
formula I.640	B.66	W-R.405
formula I.641	B.67	W-R.405
formula I.642	B.68	W-R.405
formula I.643	B.69	W-R.405
formula I.644	B.70	W-R.405
formula I.645	B.71	W-R.405
formula I.646	B.72	W-R.405
formula I.647	B.73	W-R.405
formula I.648	B.74	W-R.405
formula I.649	B.75	W-R.405
formula I.650	B.76	W-R.405
formula I.651	B.77	W-R.405
formula I.652	B.78	W-R.405
formula I.653	B.79	W-R.405
formula I.654	B.80	W-R.405
formula I.655	B.81	W-R.405
formula I.656	B.82	W-R.405
formula I.657	B.83	W-R.405
formula I.658	B.84	W-R.405
formula I.659	B.85	W-R.405
formula I.660	B.86	W-R.405
formula I.661	B.87	W-R.405
formula I.662	B.88	W-R.405
formula I.663	B.89	W-R.405
formula I.664	B.90	W-R.405
formula I.665	B.91	W-R.405
formula I.666	B.92	W-R.405
formula I.667	B.93	W-R.405
formula I.668	B.94	W-R.405
formula I.669	B.95	W-R.405
formula I.670	B.96	W-R.405
formula I.671	B.97	W-R.405
formula I.672	B.98	W-R.405
formula I.673	B.99	W-R.405
formula I.674	B.100	W-R.405
formula I.675	B.101	W-R.405
formula I.676	B.102	W-R.405

93

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.677	B.103	W-R.405
formula I.678	B.104	W-R.405
formula I.679	B.105	W-R.405
formula I.680	B.106	W-R.405
formula I.681	B.107	W-R.405
formula I.682	B.108	W-R.405
formula I.683	B.109	W-R.405
formula I.684	B.110	W-R.405
formula I.685	B.111	W-R.405
formula I.686	B.112	W-R.405
formula I.687	B.113	W-R.405
formula I.688	B.114	W-R.405
formula I.689	B.115	W-R.405
formula I.690	B.116	W-R.405
formula I.691	B.117	W-R.405
formula I.692	B.118	W-R.405
formula I.693	B.119	W-R.405
formula I.694	B.120	W-R.405
formula I.695	B.121	W-R.405
formula I.696	B.122	W-R.405
formula I.697	B.123	W-R.405
formula I.698	B.124	W-R.405
formula I.699	B.125	W-R.405
formula I.700	B.126	W-R.405
formula I.701	B.127	W-R.405
formula I.702	B.128	W-R.405
formula I.703	B.129	W-R.405
formula I.704	B.130	W-R.405
formula I.705	B.131	W-R.405
formula I.706	B.132	W-R.405
formula I.707	B.133	W-R.405
formula I.708	B.134	W-R.405
formula I.709	B.135	W-R.405
formula I.710	B.136	W-R.405
formula I.711	B.137	W-R.405
formula I.712	B.138	W-R.405
formula I.713	B.139	W-R.405
formula I.714	B.140	W-R.405
formula I.715	B.141	W-R.405
formula I.716	B.142	W-R.405

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.717	B.143	W-R.405
formula I.718	B.144	W-R.405
formula I.719	B.145	W-R.405
formula I.720	B.146	W-R.405
formula I.721	B.147	W-R.405
formula I.722	B.148	W-R.405
formula I.723	B.149	W-R.405
formula I.724	B.150	W-R.405
formula I.725	B.151	W-R.405
formula I.726	B.152	W-R.405
formula I.727	B.153	W-R.405
formula I.728	B.154	W-R.405
formula I.729	B.155	W-R.405
formula I.730	B.156	W-R.405
formula I.731	B.157	W-R.405
formula I.732	B.158	W-R.405
formula I.733	B.159	W-R.405
formula I.734	B.160	W-R.405
formula I.735	B.161	W-R.405
formula I.736	B.162	W-R.405
formula I.737	B.163	W-R.405
formula I.738	B.164	W-R.405
formula I.739	B.165	W-R.405
formula I.740	B.166	W-R.405
formula I.741	B.167	W-R.405
formula I.742	B.168	W-R.405
formula I.743	B.169	W-R.405
formula I.744	B.170	W-R.405
formula I.745	B.171	W-R.405
formula I.746	B.172	W-R.405
formula I.747	B.173	W-R.405
formula I.748	B.174	W-R.405
formula I.749	B.175	W-R.405
formula I.750	B.176	W-R.405
formula I.751	B.177	W-R.405
formula I.752	B.178	W-R.405
formula I.753	B.179	W-R.405
formula I.754	B.180	W-R.405
formula I.755	B.181	W-R.405
formula I.756	B.182	W-R.405

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.757	B.183	W-R.405
formula I.758	B.184	W-R.405
formula I.759	B.185	W-R.405
formula I.760	B.186	W-R.405
formula I.761	B.187	W-R.405
formula I.762	B.188	W-R.405
formula I.763	B.189	W-R.405
formula I.764	B.190	W-R.405
formula I.765	B.0	W-R.418
formula I.766	B.1	W-R.418
formula I.767	B.2	W-R.418
formula I.768	B.3	W-R.418
formula I.769	B.4	W-R.418
formula I.770	B.5	W-R.418
formula I.771	B.6	W-R.418
formula I.772	B.7	W-R.418
formula I.773	B.8	W-R.418
formula I.774	B.9	W-R.418
formula I.775	B.10	W-R.418
formula I.776	B.11	W-R.418
formula I.777	B.12	W-R.418
formula I.778	B.13	W-R.418
formula I.779	B.14	W-R.418
formula I.780	B.15	W-R.418
formula I.781	B.16	W-R.418
formula I.782	B.17	W-R.418
formula I.783	B.18	W-R.418
formula I.784	B.19	W-R.418
formula I.785	B.20	W-R.418
formula I.786	B.21	W-R.418
formula I.787	B.22	W-R.418
formula I.788	B.23	W-R.418
formula I.789	B.24	W-R.418
formula I.790	B.25	W-R.418
formula I.791	B.26	W-R.418
formula I.792	B.27	W-R.418
formula I.793	B.28	W-R.418
formula I.794	B.29	W-R.418
formula I.795	B.30	W-R.418
formula I.796	B.31	W-R.418

96

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.797	B.32	W-R.418
formula I.798	B.33	W-R.418
formula I.799	B.34	W-R.418
formula I.800	B.35	W-R.418
formula I.801	B.36	W-R.418
formula I.802	B.37	W-R.418
formula I.803	B.38	W-R.418
formula I.804	B.39	W-R.418
formula I.805	B.40	W-R.418
formula I.806	B.41	W-R.418
formula I.807	B.42	W-R.418
formula I.808	B.43	W-R.418
formula I.809	B.44	W-R.418
formula I.810	B.45	W-R.418
formula I.811	B.46	W-R.418
formula I.812	B.47	W-R.418
formula I.813	B.48	W-R.418
formula I.814	B.49	W-R.418
formula I.815	B.50	W-R.418
formula I.816	B.51	W-R.418
formula I.817	B.52	W-R.418
formula I.818	B.53	W-R.418
formula I.819	B.54	W-R.418
formula I.820	B.55	W-R.418
formula I.821	B.56	W-R.418
formula I.822	B.57	W-R.418
formula I.823	B.58	W-R.418
formula I.824	B.59	W-R.418
formula I.825	B.60	W-R.418
formula I.826	B.61	W-R.418
formula I.827	B.62	W-R.418
formula I.828	B.63	W-R.418
formula I.829	B.64	W-R.418
formula I.830	B.65	W-R.418
formula I.831	B.66	W-R.418
formula I.832	B.67	W-R.418
formula I.833	B.68	W-R.418
formula I.834	B.69	W-R.418
formula I.835	B.70	W-R.418
formula I.836	B.71	W-R.418

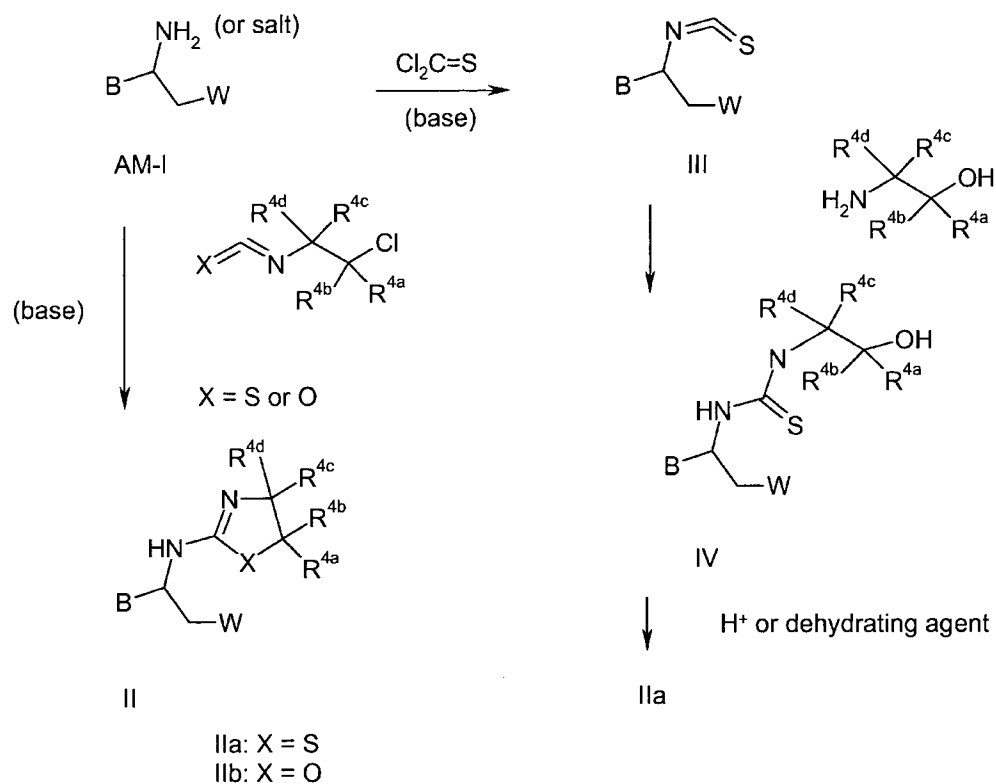
97

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.837	B.72	W-R.418
formula I.838	B.73	W-R.418
formula I.839	B.74	W-R.418
formula I.840	B.75	W-R.418
formula I.841	B.76	W-R.418
formula I.842	B.77	W-R.418
formula I.843	B.78	W-R.418
formula I.844	B.79	W-R.418
formula I.845	B.80	W-R.418
formula I.846	B.81	W-R.418
formula I.847	B.82	W-R.418
formula I.848	B.83	W-R.418
formula I.849	B.84	W-R.418
formula I.850	B.85	W-R.418
formula I.851	B.86	W-R.418
formula I.852	B.87	W-R.418
formula I.853	B.88	W-R.418
formula I.854	B.89	W-R.418
formula I.855	B.90	W-R.418
formula I.856	B.91	W-R.418
formula I.857	B.92	W-R.418
formula I.858	B.93	W-R.418
formula I.859	B.94	W-R.418
formula I.860	B.95	W-R.418
formula I.861	B.96	W-R.418
formula I.862	B.97	W-R.418
formula I.863	B.98	W-R.418
formula I.864	B.99	W-R.418
formula I.865	B.100	W-R.418
formula I.866	B.101	W-R.418
formula I.867	B.102	W-R.418
formula I.868	B.103	W-R.418
formula I.869	B.104	W-R.418
formula I.870	B.105	W-R.418
formula I.871	B.106	W-R.418
formula I.872	B.107	W-R.418
formula I.873	B.108	W-R.418
formula I.874	B.109	W-R.418
formula I.875	B.110	W-R.418
formula I.876	B.111	W-R.418

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.877	B.112	W-R.418
formula I.878	B.113	W-R.418
formula I.879	B.114	W-R.418
formula I.880	B.115	W-R.418
formula I.881	B.116	W-R.418
formula I.882	B.117	W-R.418
formula I.883	B.118	W-R.418
formula I.884	B.119	W-R.418
formula I.885	B.120	W-R.418
formula I.886	B.121	W-R.418
formula I.887	B.122	W-R.418
formula I.888	B.123	W-R.418
formula I.889	B.124	W-R.418
formula I.890	B.125	W-R.418
formula I.891	B.126	W-R.418
formula I.892	B.127	W-R.418
formula I.893	B.128	W-R.418
formula I.894	B.129	W-R.418
formula I.895	B.130	W-R.418
formula I.896	B.131	W-R.418
formula I.897	B.132	W-R.418
formula I.898	B.133	W-R.418
formula I.899	B.134	W-R.418
formula I.900	B.135	W-R.418
formula I.901	B.136	W-R.418
formula I.902	B.137	W-R.418
formula I.903	B.138	W-R.418
formula I.904	B.139	W-R.418
formula I.905	B.140	W-R.418
formula I.906	B.141	W-R.418
formula I.907	B.142	W-R.418
formula I.908	B.143	W-R.418
formula I.909	B.144	W-R.418
formula I.910	B.145	W-R.418
formula I.911	B.146	W-R.418
formula I.912	B.147	W-R.418
formula I.913	B.148	W-R.418
formula I.914	B.149	W-R.418
formula I.915	B.150	W-R.418
formula I.916	B.151	W-R.418

Formula I	Phenyl radical B	Hetaryl radical W
formula I.917	B.152	W-R.418
formula I.918	B.153	W-R.418
formula I.919	B.154	W-R.418
formula I.920	B.155	W-R.418
formula I.921	B.156	W-R.418
formula I.922	B.157	W-R.418
formula I.923	B.158	W-R.418
formula I.924	B.159	W-R.418
formula I.925	B.160	W-R.418
formula I.926	B.161	W-R.418
formula I.927	B.162	W-R.418
formula I.928	B.163	W-R.418
formula I.929	B.164	W-R.418
formula I.930	B.165	W-R.418
formula I.931	B.166	W-R.418
formula I.932	B.167	W-R.418
formula I.933	B.168	W-R.418
formula I.934	B.169	W-R.418
formula I.935	B.170	W-R.418
formula I.936	B.171	W-R.418
formula I.937	B.172	W-R.418
formula I.938	B.173	W-R.418
formula I.939	B.174	W-R.418
formula I.940	B.175	W-R.418
formula I.941	B.176	W-R.418
formula I.942	B.177	W-R.418
formula I.943	B.178	W-R.418
formula I.944	B.179	W-R.418
formula I.945	B.180	W-R.418
formula I.946	B.181	W-R.418
formula I.947	B.182	W-R.418
formula I.948	B.183	W-R.418
formula I.949	B.184	W-R.418
formula I.950	B.185	W-R.418
formula I.951	B.186	W-R.418
formula I.952	B.187	W-R.418
formula I.953	B.188	W-R.418
formula I.954	B.189	W-R.418
formula I.955	B.190	W-R.418

The compounds of the present invention can be e.g. prepared from the corresponding amines AM-I by the synthetic route outlined in the following scheme:



5

According to the method outlined in the scheme, an amine AM-I is converted to the corresponding isothiocyanate III by conventional means, e.g. by reacting AM-I with thiophosgene (see e.g. Houben-Weyl, E4, "Methoden der Organischen Chemie", chapter IIc, pp. 837-842, Georg Thieme Verlag 1983). The isothiocyanate III is then reacted with aminoethanol, thereby obtaining the thiourea IV.

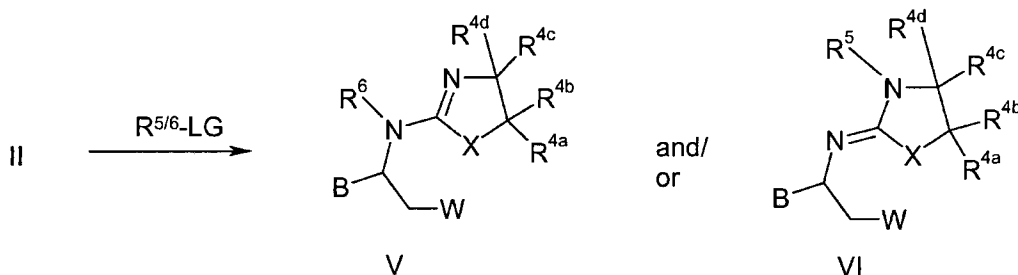
The reaction of the aminoethanol with isothiocyanate III can be performed in accordance with standard methods of organic chemistry, see e.g. Biosci. Biotech. Biochem. 56 (7), 1062-65 (1992).

The thus obtained thioureas IV can be cyclized by conventional means thereby obtaining the desired thiazoline compound of the formula IIa. Cyclization of compound IV can be achieved e.g. under acid catalysis or under dehydrating conditions e.g. by Mitsunobu's reaction (see Tetrahedron Letters 1999, 40, 3125-3128).

According to the method outlined in the scheme, an amine AM-I can also be converted to azolines of formula IIa or IIb by reaction with 2-chloroethylisothiocyanate

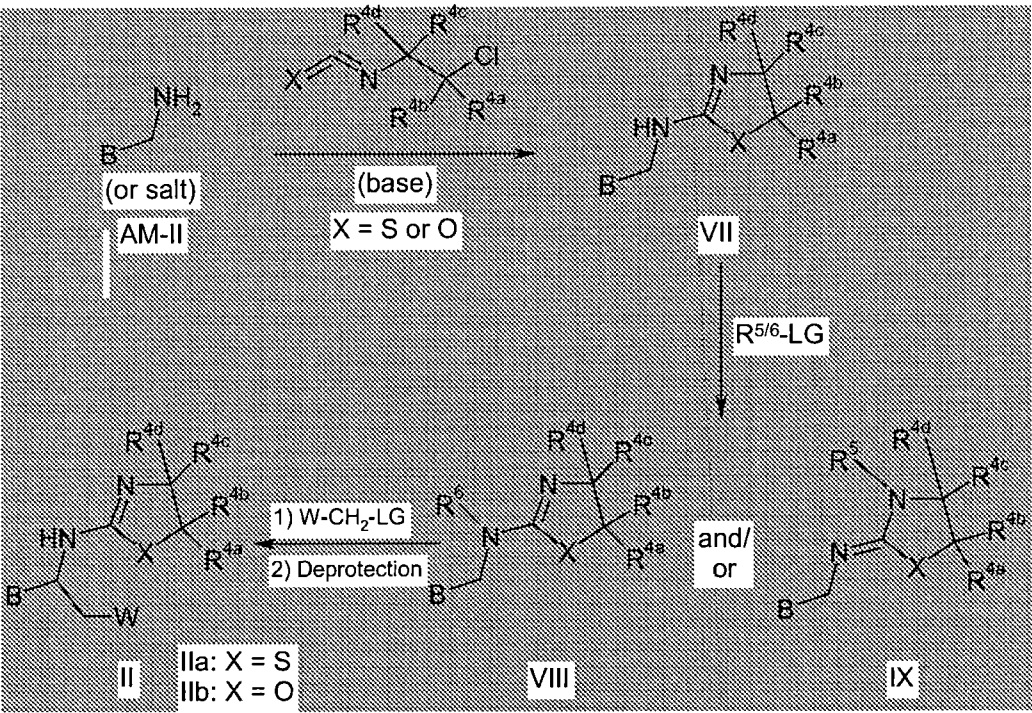
- or 2-chloroethylisocyanate e.g. as described in Bioorg. Med. Chem. Lett. 1994, 4, 2317-22 and subsequent cyclization in the presence or absence of base or under the conditions described below.
- 5 Amines as AM-I are known in the art or can in general be prepared by methods familiar to an organic chemist and well known in the art e.g. J. Chinese Chem. Soc. 2003, 50, 109-114, Synthesis 1976, 593-595, J. Med. Chem. 1995, 38, 10, 1600-1607, J. Org. Chem. 1962, 1970-1972, or for example by reduction of appropriate precursors derived by condensation of appropriate nitro methane compounds with
 - 10 aldehydes as demonstrated below (preparation examples) according to similar methods described e.g. in J. Am. Chem. Soc. 1934, 1556-1558 or J. Org. Chem. 1956, 1118-1119. Additionally, amines AM-I can be prepared by alkylation of appropriate imines and subsequent hydrolysis as described below (preparation examples) according to similar methods described e.g. in Tet. Asymm. 1995, 6, 1225-1228.
 - 15 Alternatively, amines AM-I can also be obtained by addition of appropriate methylenic lithio or magnesium halide reagents in the presence or not of copper or zinc additives to appropriate imines as described below (Preparation examples) according to similar methods described e.g. in Org. Lett. 2001, 3, 1841-1844.
 - 20 2-Chloroethyl isothiocyanate (CAS-reg.-no.: 6099-88-3) and 2-chloroethylisocyanate (CAS-reg.-no.: 1943-83-5) are commercially available.

- Compounds of the general formula V or VI can be obtained by reaction with a suitable electrophile as outlined in the following scheme e.g. an alkylating or acylating reagent
- 25 $R^{5/6}$ -LG (LG = leaving group; e.g. Cl, Br, I, OSO_2R , OCO_2R , wherein R is C_1 - C_4 -alkyl), e. g. as described in WO 2005063724.



- 30 As a further alternative, the compounds of the present invention can also be prepared starting from amines AM-II via aminothiazolines or aminooxazolines VII. A further conversion with an alkylating or acylating reagent $R^{5/6}$ -LG provides derivatised aminothiazolines or aminooxazolines VIII and/or IX. Those are subsequently converted with appropriate halomethyl heteroaromatic reagents, as outlined in the
- 35 following scheme and below (preparation examples):

102



5 The meaning of the substituents B, W, R^{4a-d}, R⁵ and R⁶ in the schemes correspond to the definition given above.

Pests

Due to their excellent activity, the compounds of the formula I may be used for controlling animal pests, in particular selected harmful insects, arachnids and
5 nematodes.

The compounds of the formula I and the pesticidal compositions comprising them are therefore effective agents for controlling animal pests, selected from insects, arachnids and nematodes. Animal pests controlled by the compounds of formula I
10 include for example:

Insects from the order of the lepidopterans (Lepidoptera), for example *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatilis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*,
15 *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*,
20 *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*,
25 *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* and *Zeiraphera canadensis*;

beetles (Coleoptera), for example *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*,
35 *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*,
40 *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*,

Ortiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyllopertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Sitona lineatus and Sitophilus granaria;

- 5 dipterans (Diptera), for example Aedes aegypti, Aedes vexans, Anastrepha ludens, Anopheles maculipennis, Ceratitis capitata, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria, Contarinia sorghicola, Cordylobia anthropophaga, Culex pipiens, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Fannia canicularis, Gasterophilus intestinalis, Glossina morsitans, Haematobia
 - 10 irritans, Haplodiplosis equestris, Hylemyia platura, Hypoderma lineata, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria pectoralis, Mayetiola destructor, Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Oscinella frit, Pegomya hysocyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula oleracea
 - 15 and Tipula paludosa;
- thrips (Thysanoptera), e.g. Dichromothrips corbetti, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi and Thrips tabaci;
- 20 hymenopterans (Hymenoptera), e.g. Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata and Solenopsis invicta;
- 25 heteropterans (Heteroptera), e.g. Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis and Thyanta perditor;
- 30 homopterans (Homoptera), e.g. Acyrthosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Bemisia argentifolii, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae,
 - 35 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, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pyraeius, Metopolophium dirhodum,
 - 40 Myzodes persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus persicae, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus,

105

- Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Sogatella furcifera Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantiiand, and Viteus vitifolii;
- 5 termites (Isoptera), e.g. Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes lucifugus und Termes natalensis;
- 10 orthopterans (Orthoptera), e.g. Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Periplaneta americana, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus and Tachycines asynamorus;
- 15 Arachnoidea, such as arachnids (Acarina), e.g. of the families Argasidae, Ixodidae and Sarcoptidae, such as Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Dermacentor silvarum, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus,
- 20 Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Dermanyssus gallinae, Psoroptes ovis, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi, Sarcoptes scabiei, and Eriophyidae spp. such as Aculus schlechtendali, Phyllocoptrata oleivora and Eriophyes sheldoni; Tarsonemidae spp. such as Phytionemus pallidus and Polyphagotarsonemus latus; Tenuipalpidae spp. such as Brevipalpus phoenicis;
- 25 Tetranychidae spp. such as Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius and Tetranychus urticae, Panonychus ulmi, Panonychus citri, and oligonychus pratensis;
- Siphonatera, e.g. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp ;
- 30 The compositions and compounds of formula I are useful for the control of nematodes, especially plant parasitic nematodes such as root knot nematodes, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, and other Meloidogyne species;
- 35 cyst-forming nematodes, Globodera rostochiensis and other Globodera species; Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii, and other Heterodera species; Seed gall nematodes, Anguina species; Stem and foliar nematodes, Aphelenchoides species; Sting nematodes, Belonolaimus longicaudatus and other Belonolaimus species; Pine nematodes, Bursaphelenchus xylophilus and
- 40 other Bursaphelenchus species; Ring nematodes, Criconema species, Criconemella species, Criconemoides species, Mesocriconema species; Stem and bulb nematodes, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci and other Ditylenchus species; Awl

106

nematodes, Dolichodorus species; Spiral nematodes, Heliocotylenchus multicinctus and other Helicotylenchus species; Sheath and sheathoid nematodes, Hemicycliophora species and Hemicriconemoides species; Hirshmanniella species; Lance nematodes, Hoploaimus species; false rootknot nematodes, Nacobbus species; Needle nematodes, Longidorus elongatus and other Longidorus species; Pin nematodes, Paratylenchus species; Lesion nematodes, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvatus, Pratylenchus goodeyi and other Pratylenchus species; Burrowing nematodes, Radopholus similis and other Radopholus species; Reniform nematodes, Rotylenchus robustus and other Rotylenchus species; Scutellonema species; Stubby root nematodes, Trichodorus primitivus and other Trichodorus species, Paratrichodorus species; Stunt nematodes, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius and other Tylenchorhynchus species; Citrus nematodes, Tylenchulus species; Dagger nematodes, Xiphinema species; and other plant parasitic nematode species.

15 In a preferred embodiment of the invention the compounds of formula I are used for controlling insects or arachnids, in particular insects of the orders Lepidoptera, Coleoptera and Homoptera and arachnids of the order Acarina. The compounds of the formula I according to the present invention are particularly useful for controlling insects of the order Lepidoptera and Homoptera.

Formulations

25 For use in a method according to the present invention, the compounds of formula I can be converted into the customary formulations, e.g. solutions, emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes, granules and directly sprayable solutions. The use form depends on the particular purpose and application method. Formulations and application methods are chosen to ensure in each case a fine and uniform distribution of the compound of the formula I according to the present invention.

30 Accordingly, the invention further provides e.g. an agriculturally composition for combating such animal pests, which comprises such an amount of at least one compound of the formula I or at least an agriculturally useful salt of I and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that it has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant.

40 Such a composition may contain a single active compound of the formula I, or the enantiomers thereof or a mixture of several active compounds of formula I according to the present invention. The composition according to the present invention may comprise an individual isomer or mixtures of isomers as well as individual tautomers or mixtures of tautomers.

107

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, 5 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, 10 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 15 formulation also optionally colorants and/or binders and/or gelling agents.

Solvents/carriers, which are suitable, are e.g.:

- 20 - solvents such as water, aromatic solvents (for example Solvesso products, xylene and the like), paraffins (for example mineral fractions), alcohols (for example methanol, butanol, pentanol, benzyl alcohol), ketones (for example cyclohexanone, gamma-butyrolactone), pyrrolidones (N-methyl-pyrrolidone (NMP), N-octylpyrrolidone NOP), acetates (glycol diacetate), alkyl lactates, lactones such as g-butyrolactone, glycols, fatty acid dimethylamides, fatty acids and fatty acid esters, triglycerides, oils of 25 vegetable or animal origin and modified oils such as alkylated plant oils. In principle, solvent mixtures may also be used.
- carriers such as ground natural minerals and ground synthetic minerals, such as silica gels, finely divided silicic acid, silicates, talc, kaolin, attaclay, limestone, lime, chalk, bole, loess, clay, dolomite, diatomaceous earth, calcium sulfate and 30 magnesium sulfate, magnesium oxide, ground synthetic materials, fertilizers, such as, 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.
- 35 Suitable emulsifiers are nonionic and anionic emulsifiers (for example polyoxyethylene fatty alcohol ethers, alkylsulfonates and arylsulfonates).

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

- 40 Suitable surfactants are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutynaphthalenesulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates,

108

- fatty 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 octylphenyl ether, ethoxylated
- 5 isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenyl polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, 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,
- 10
- Also anti-freezing agents such as glycerin, ethylene glycol, propylene glycol and bactericides such as can be added to the formulation.
- Suitable antifoaming agents are for example antifoaming agents based on silicon or
- 15 magnesium stearate.
- Suitable preservatives are for example dichlorophen und benzyl alcohol hemiformal
- Suitable thickeners are compounds, which confer a pseudoplastic flow behavior to the
- 20 formulation, i.e. high viscosity at rest and low viscosity in the agitated stage. Mention may be made, in this context, for example, of commercial thickeners based on polysaccharides, such as Xanthan Gum® (Kelzan® from Kelco), Rhodopol® 23 (Rhone Poulenc) or Veegum® (from R.T. Vanderbilt), or organic phyllosilicates, such as Attaclay® (from Engelhardt). Antifoam agents suitable for the dispersions
- 25 according to the invention are, for example, silicone emulsions (such as, for example, Silikon® SRE, Wacker or Rhodorsil® from Rhodia), long-chain alcohols, fatty acids, organofluorine compounds and mixtures thereof. Biocides can be added to stabilize the compositions according to the invention against attack by microorganisms.
- Suitable biocides are, for example, based on isothiazolones such as the compounds
- 30 marketed under the trademarks Proxel® from Avecia (or Arch) or Acticide® RS from Thor Chemie and Kathon® MK from Rohm & Haas. Suitable antifreeze agents are organic polyols, for example ethylene glycol, propylene glycol or glycerol. These are usually employed in amounts of not more than 10% by weight, based on the total weight of the active compound composition. If appropriate, the active compound
- 35 compositions according to the invention may comprise 1 to 5% by weight of buffer, based on the total amount of the formulation prepared, to regulate the pH, the amount and type of the buffer used depending on the chemical properties of the active compound or the active compounds. Examples of buffers are alkali metal salts of weak inorganic or organic acids, such as, for example, phosphoric acid, boronic acid,
- 40 acetic acid, propionic acid, citric acid, fumaric acid, tartaric acid, oxalic acid and succinic acid.

109

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

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

Granules, for example coated granules, impregnated granules and homogeneous granules, can be prepared by binding the active ingredients to solid carriers.

15 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, 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 ingredient. The active ingredients are employed in a purity of from 90% to 100%, preferably 95% to 100% (according to NMR spectrum).

25 For seed treatment purposes, respective formulations can be diluted 2-10 fold leading to concentrations in the ready to use preparations of 0.01 to 60% by weight active compound by weight, preferably 0.1 to 40% by weight.

30 The compound 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 distribution of the active compounds according to the invention.

35

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

40

Alternatively, it is possible to prepare concentrates composed of active substance,

wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

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

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

The following are examples of formulations:

15 1. Products for dilution with water. For seed treatment purposes, such products may be applied to the seed diluted or undiluted.

A) Water-soluble concentrates (SL, LS)

20 10 parts by weight of the active compound is 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 dissolves upon dilution with water, whereby a formulation with 10 % (w/w) of active compound is obtained.

25 B) Dispersible concentrates (DC)

20 parts by weight of the active compound is dissolved in 70 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 compounds is obtained.

30 C) Emulsifiable concentrates (EC)

35 15 parts by weight of the active compounds is dissolved in 7 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 compounds is obtained.

D) Emulsions (EW, EO, ES)

40 25 parts by weight of the active compound is 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 is obtained.

5 E) Suspensions (SC, OD, FS)

In an agitated ball mill, 20 parts by weight of the active compound is 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 suspension. Dilution with
10 water gives a stable suspension of the active compound, whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound is obtained.

F) Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG, SG)

15 50 parts by weight of the active compound is 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, whereby a formulation with 50% (w/w) of active compound is obtained.

20

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

75 parts by weight of the active compound are ground in a rotor-stator mill with addition of 25 parts by weight of dispersants, wetters and silica gel. Dilution with water
25 gives a stable dispersion or solution of the active compound, whereby a formulation with 75% (w/w) of active compound is obtained.

H) Gel-Formulation (GF)

30 In an agitated ball mill, 20 parts by weight of the active compound is comminuted with addition of 10 parts by weight of dispersants, 1 part by weight of a gelling agent wetters and 70 parts by weight of water or of an organic solvent to give a fine active compound suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound, whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound is obtained.

35

2. Products to be applied undiluted for foliar applications. For seed treatment purposes, such products may be applied to the seed diluted or undiluted.

I) Dustable powders (DP, DS)

40

112

5 parts by weight of the active compound 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.

5 J) Granules (GR, FG, GG, MG)

0.5 part by weight of the active compound is ground finely and associated with 95.5 parts by weight of carriers, whereby a formulation with 0.5% (w/w) of active compound is obtained. Current methods are extrusion, spray-drying or the fluidized bed. This gives granules to be applied undiluted for foliar use.

K) ULV solutions (UL)

10 parts by weight of the active compound is dissolved in 90 parts by weight of an organic solvent, for example xylene. This gives a product having 10% (w/w) of active compound, 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 and compositions of the present invention compounds I may be applied with other active ingredients, for example with other pesticides, insecticides, herbicides, fertilizers such as ammonium nitrate, urea, potash, and superphosphate, phytotoxicants and plant growth regulators, safeners and nematicides. These additional ingredients may be used sequentially or in combination 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.

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

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

40

M.1. Organo(thio)phosphates: acephate, azamethiphos, azinphos-methyl, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorfenvinphos, diazinon, dichlorvos, dicrotophos,

113

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;

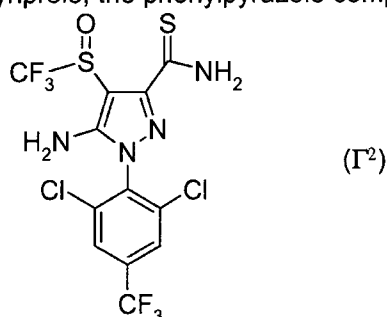
M.2. Carbamates: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, fenoxycarb, furathiocarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, triazamate;

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

M.4. Growth regulators: a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas: chlorfluazuron, 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: spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat;

M.5. Nicotinic receptor agonists/antagonists compounds: clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, thiamethoxam, nitenpyram, acetamiprid, thiocloprid and AKD-1022;

M.6. GABA antagonist compounds: acetoprole, endosulfan, ethiprole, fipronil, vaniliprole, pyrafluprole, pyriprole, the phenylpyrazole compound of formula I²

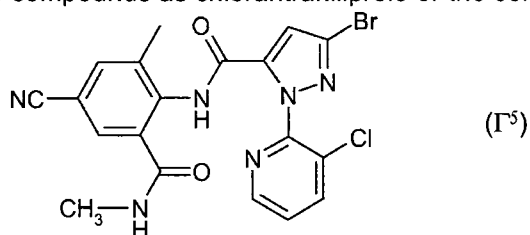


M.7. Macrocyclic lactone insecticides: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad

M.8. METI I compounds: fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenimer;

114

- M.9. METI II and III compounds: acequinocyl, fluacyprim, hydramethylnon;
- M.10. Uncoupler compounds: chlorfenapyr;
- 5 M.11. Oxidative phosphorylation inhibitor compounds: cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxide, propargite;
- M.12. Moulting disruptor compounds: cyromazine;
- 10 M.13. Mixed Function Oxidase inhibitor compounds: piperonyl butoxide;
- M.14. Sodium channel blocker compounds: indoxacarb, metaflumizone,
- 15 M.15. Various: amitraz, benclothiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, flubendiamide, cyenopyrafen, flupyrzofos, cyflumetofen, amidoflumet, pyrifluquinazon, 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
- 20 methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl, anthranilamide compounds as chlorantraniliprole or the compound of formula Γ^5



- and malononitrile compounds as described in JP 2002 284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, JP 2004 99597, WO
- 25 05/68423, WO 05/68432, or WO 05/63694, especially the malononitrile compounds $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, and $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$.
- 30 The commercially available compounds of the group M may be found in The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003) among other publications. Thioamides of formula Γ^2 and their preparation have been described in WO 98/28279. Lepimectin is known from Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004.
- 35 Benclothiaz and its preparation have been described in EP-A1 454621. Methidathion and Paraoxon and their preparation have been described in Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoprole and its

- preparation have been described in WO 98/28277. Metaflumizone and its preparation have been described in EP-A1 462 456. Flupyrzofos has been described in Pesticide Science 54, 1988, p.237-243 and in US 4822779. Pyrafluprole and its preparation have been described in JP 2002193709 and in WO 01/00614. Pyriprole and its preparation have been described in WO 98/45274 and in US 6335357. Amidoflumet and its preparation have been described in US 6221890 and in JP 21010907. Flufenerim and its preparation have been described in WO 03/007717 and in WO 03/007718. Cyflumetofen and its preparation have been described in WO 04/080180. The aminoquinazolinone compound of formula I⁴ has been described in EP A 109 7932.
- Anthranilamides as the one of formula I⁵ or as chloranthraniliprole and their preparations have been described in WO 01/70671; WO 02/48137; WO 03/24222, WO 03/15518, WO 04/67528; WO 04/33468; and WO 05/118552. The malononitrile compounds CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃, CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₃, CF₃(CF₂)₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H, and CF₃CF₂CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H have been described in WO 05/63694.
- Fungicidal mixing partners are those selected from the group F consisting of
- F.1 acylalanines such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace, oxadixyl;
- F.2 amine derivatives such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph;
- F.3 anilinopyrimidines such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyrodinyl;
- F.4 antibiotics such as cycloheximid, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin or streptomycin;
- F.5 azoles such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazole, flutriafol;
- F.6 dicarboximides such as iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin;
- F.7 dithiocarbamates such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb;
- F.8 heterocyclic compounds such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamid, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole, triforine;

- F.9 copper fungicides such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride, basic copper sulfate;
- F.10 nitrophenyl derivatives such as binapacryl, dinocap, dinobuton, nitrophthalisopropyl;
- 5 F.11 phenylpyrroles such as fenpiclonil or fludioxonil;
- F.12 strobilurins such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin or trifloxystrobin;
- F.13 sulfenic acid derivatives such as captafol, captan, dichlofluanid, folpet, tolylfluanid;
- 10 F.14 cinnemamides and analogs such as dimethomorph, flumetover or flumorph;
- F.15 sulfur, and other fungicides such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezin, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb,
- 15 hexachlorobenzene, metrafenon, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-methyl, quintozone, zoxamid.

Applications

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

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

- Moreover, animal pests may be controlled by contacting the target pest, its food
- 35 supply, habitat, breeding ground or its locus with a pesticidally effective amount of compounds of formula I. As such, the application may be carried out before or after the infection of the locus, growing crops, or harvested crops by the pest.

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

5 The compounds of formula I may be also 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, stem or roots of the plant) and indirect contact (applying the compounds/compositions to the locus of the pest and/or plant).

10

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

15 In general, "pesticidally effective amount" means 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 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
20 conditions such as desired pesticidal effect and duration, weather, target species, locus, mode of application, and the like.

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).

25

For use against ants, termites, wasps, flies, mosquitos, crickets, or cockroaches, compounds of formula I are preferably used in a bait composition.

30 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 stickyness, moisture retention or aging
35 characteristics.

40 The bait employed in the composition is a product, which is sufficiently attractive to incite insects such as ants, termites, wasps, flies, mosquitos, crickets etc. or cockroaches to eat it. The attractiveness can be manipulated by using feeding stimulants or sex pheromones. Food stimulants are chosen, for example, but not exclusively, from animal and/or plant proteins (meat-, fish- or blood meal, insect parts,

- 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. Fresh or decaying parts of fruits, crops, plants, animals, insects or specific parts thereof can also serve as a feeding stimulant.
- 5 Sex pheromones are known to be more insect specific. Specific pheromones are described in the literature and are known to those skilled in the art.

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

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

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

- 30 Methods to control infectious diseases transmitted by insects (e.g. malaria, dengue and yellow fever, lymphatic filariasis, and leishmaniasis) with compounds of formula I and its respective compositions also comprise treating surfaces of huts and houses, air spraying and impregnation of curtains, tents, clothing items, bed nets, tsetse-fly trap or the like. Insecticidal compositions for application to fibers, fabric, knitgoods, nonwovens, netting material or foils and tarpaulins preferably comprise a mixture including the insecticide, optionally a repellent and at least one binder. Suitable repellents for example are N,N-Diethyl-meta-toluamide (DEET), N,N-diethylphenylacetamide (DEPA), 1-(3-cyclohexan-1-yl-carbonyl)-2-methylpiperine, (2-hydroxymethylcyclohexyl) acetic acid lactone, 2-ethyl-1,3-hexandiol, indalone,
- 35 40 Methylneodecanamide (MNDA), a pyrethroid not used for insect control such as {(+/-)-3-allyl-2-methyl-4-oxocyclopent-2-(+)-enyl-(+)-trans-chrysantemate (Esbiothrin), a

repellent derived from or identical with plant extracts like limonene, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol or crude plant extracts from plants like *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (lemon grass), *Cymbopogon nardus* (citronella). Suitable binders are selected for example from polymers and copolymers of vinyl esters of aliphatic acids (such as vinyl acetate and vinyl versatate), acrylic and methacrylic esters of alcohols, such as butyl acrylate, 2-ethylhexylacrylate, and methyl acrylate, mono- and di-ethylenically unsaturated hydrocarbons, such as styrene, and aliphatic diens, such as butadiene.

10 The impregnation of curtains and bednets is done in general by dipping the textile material into emulsions or dispersions of the insecticide or spraying them onto the nets.

15 The compounds of formula I and its compositions can be used for protecting wooden materials such as trees, board fences, sleepers, etc. and buildings such as houses, outhouses, factories, but also construction materials, furniture, leathers, fibers, vinyl articles, electric wires and cables etc. from ants and/or termites, and for controlling ants and termites from doing harm to crops or human being (e.g. when the pests invade into houses and public facilities). The compounds of formula I are applied not only to the surrounding soil surface or into the under-floor soil in order to protect 20 wooden materials but it can also be applied to lumbered articles such as surfaces of the under-floor concrete, alcove posts, beams, plywoods, furniture, etc., wooden articles such as particle boards, half boards, etc. and vinyl articles such as coated electric wires, vinyl sheets, heat insulating material such as styrene foams, etc. In 25 case of application against ants doing harm to crops or human beings, the ant controller of the present invention is applied to the crops or the surrounding soil, or is directly applied to the nest of ants or the like.

30 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.

35 Customary application rates in the protection of materials are, for example, from 0.01 g to 1000 g of active compound per m² treated material, desirably from 0.1 g to 50 g per m².

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

40

For use in bait compositions, the typical content of active ingredient is from 0.001 weight % to 15 weight %, desirably from 0.001 weight % to 5% weight % of active compound.

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

- 10 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.

Seed treatment

- 15 The compounds of formula I are also suitable for the treatment of seeds in order to protect the seed from insect pest, in particular from soil-living insect pests and the resulting plant's roots and shoots against soil pests and foliar insects.

- 20 The compounds of formula I are particularly useful for the protection of the seed from soil pests and the resulting plant's roots and shoots against soil pests and foliar insects. The protection of the resulting plant's roots and shoots is preferred. More preferred is the protection of resulting plant's shoots from piercing and sucking insects, wherein the protection from aphids is most preferred.

- 25 The present invention therefore comprises a method for the protection of seeds from insects, in particular from soil insects and of the seedlings' roots and shoots from insects, in particular from soil and foliar insects, said method comprising contacting the seeds before sowing and/or after pregermination with a compound of the general formula I or a salt thereof. Particularly preferred is a method, wherein the plant's roots
30 and shoots are protected, more preferably a method, wherein the plants shoots are protected from piercing and sucking insects, most preferably aa method, wherein the plants shoots are protected from aphids.

- 35 The term seed embraces seeds and plant propagules of all kinds including but not limited to true seeds, seed pieces, suckers, corms, bulbs, fruit, tubers, grains, cuttings, cut shoots and the like and means in a preferred embodiment true seeds.

- 40 The term seed treatment comprises all suitable seed treatment techniques known in the art, such as seed dressing, seed coating, seed dusting, seed soaking and seed pelleting.

The present invention also comprises seeds coated with or containing the active compound.

121

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

5 propagation product is (re)planted, it may absorb the active ingredient.

Suitable seed is seed of cereals, root crops, oil crops, vegetables, spices, ornamentals, for example seed of durum and other wheat, barley, oats, rye, maize

10 (fodder maize and sugar maize / sweet and field corn), soybeans, oil crops, crucifers, cotton, sunflowers, bananas, rice, oilseed rape, turnip rape, sugarbeet, fodder beet, eggplants, potatoes, grass, lawn, turf, fodder grass, tomatoes, leeks, pumpkin/squash, cabbage, iceberg lettuce, pepper, cucumbers, melons, Brassica species, melons, beans, peas, garlic, onions, carrots, tuberous plants such as

15 potatoes, sugar cane, tobacco, grapes, petunias, geranium/pelargoniums, pansies and impatiens.

In addition, the active compound may also be used for the treatment seeds from plants, which tolerate the action of herbicides or fungicides or insecticides owing to

20 breeding, including genetic engineering methods.

For example, the active compound can be employed in treatment of seeds from plants, which are resistant to herbicides from the group consisting of the sulfonylureas, imidazolinones, glufosinate-ammonium or glyphosate-

25 isopropylammonium and analogous active substances (see for example, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EP-A-0257993, U.S. Pat. No. 5,013,659) or in transgenic crop plants, for example cotton, with the capability of producing *Bacillus thuringiensis* toxins (Bt toxins) which make the plants resistant to certain pests (EP-A-0142924, EP-A-0193259),

30 Furthermore, the active compound can be used also for the treatment of seeds from plants, which have modified characteristics in comparison with existing plants consist, which can be generated for example by traditional breeding methods and/or the generation of mutants, or by recombinant procedures). For example, a number of

35 cases have been described of recombinant modifications of crop plants for the purpose of modifying the starch synthesized in the plants (e.g. WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) or of transgenic crop plants having a modified fatty acid composition (WO 91/13972).

40 The seed treatment application of the active compound is carried out by spraying or by dusting the seeds before sowing of the plants and before emergence of the plants.

122

Compositions which are especially useful for seed treatment are e.g.:

- A Soluble concentrates (SL, LS)
- D Emulsions (EW, EO, ES)
- 5 E Suspensions (SC, OD, FS)
- F Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG, SG)
- G Water-dispersible powders and water-soluble powders (WP, SP, WS)
- H Gel-Formulations (GF)
- I Dustable powders (DP, DS)

10

Conventional seed treatment formulations include for example flowable concentrates FS, solutions LS, powders for dry treatment DS, water dispersible powders for slurry treatment WS, water-soluble powders SS and emulsion ES and EC and gel formulation GF. These formulations can be applied to the seed diluted or undiluted.

- 15 Application to the seeds is carried out before sowing, either directly on the seeds or after having pregerminated the latter

In a preferred embodiment a FS formulation is used for seed treatment. Typically, a FS formulation may comprise 1-800 g/l of active ingredient, 1-200 g/l Surfactant, 0 to 200 g/l antifreezing agent, 0 to 400 g/l of binder, 0 to 200 g/l of a pigment and up to 1 liter of a solvent, preferably water.

20

- Especially preferred FS formulations of compounds of formula I for seed treatment usually comprise from 0.1 to 80% by weight (1 to 800 g/l) of the active ingredient, from 25 0.1 to 20 % by weight (1 to 200 g/l) of at least one surfactant, e.g. 0.05 to 5 % by weight of a wetter and from 0.5 to 15 % by weight of a dispersing agent, up to 20 % by weight, e.g. from 5 to 20 % of an anti-freeze agent, from 0 to 15 % by weight, e.g. 1 to 15 % by weight of a pigment and/or a dye, from 0 to 40 % by weight, e.g. 1 to 40 % by weight of a binder (sticker /adhesion agent), optionally up to 5 % by weight, e.g. 30 from 0.1 to 5 % by weight of a thickener, optionally from 0.1 to 2 % of an anti-foam agent, and optionally a preservative such as a biocide, antioxidant or the like, e.g. in an amount from 0.01 to 1 % by weight and a filler/vehicle up to 100 % by weight.

30

- Seed Treatment formulations may additionally also comprise binders and optionally 35 colorants.

35

Binders can be added to improve the adhesion of the active materials on the seeds after treatment. Suitable binders are block copolymers EO/PO surfactants but also polyvinylalcohols, polyvinylpyrrolidones, polyacrylates, polymethacrylates, 40 polybutenes, polyisobutylenes, polystyrene, polyethyleneamines, polyethyleneamides, polyethyleneimines (Lupasol®, Polymine®), polyethers, polyurethans, polyvinylacetate, tylose and copolymers derived from these polymers.

40

Optionally, also colorants can be included in the formulation. Suitable colorants or dyes for seed treatment formulations are Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112, C.I. Solvent Red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

10

Examples of a gelling agent is carrageen (Satiagel®)

In the treatment of seed, the application rates of the compounds I are generally from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seed, preferably from 1 g to 5 kg per 100 kg of seed, more preferably from 1 g to 1000 g per 100 kg of seed and in particular from 1 g to 200 g per 100 kg of seed.

15

The invention therefore also relates to seed comprising a compound of the formula I, or an agriculturally useful salt of I, as defined herein. The amount of the compound I or the agriculturally useful salt thereof will in general vary from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seed, preferably from 1 g to 5 kg per 100 kg of seed, in particular from 1 g to 1000 g per 100 kg of seed. For specific crops such as lettuce the rate can be higher.

20

Animal health

The compounds of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof are in particular also suitable for being used for combating parasites in and on animals.

25

An object of the present invention is therefore also to provide new methods to control parasites in and on animals. Another object of the invention is to provide safer pesticides for animals. Another object of the invention is further to provide pesticides for animals that may be used in lower doses than existing pesticides. And another object of the invention is to provide pesticides for animals, which provide a long residual control of the parasites.

30

35

The invention also relates to compositions containing a parasitically effective amount of compounds of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof and an acceptable carrier, for combating parasites in and on animals.

The present invention also provides a method for treating, controlling, preventing and protecting animals against infestation and infection by parasites, which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasitically

40

effective amount of a compound of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof or a composition comprising it.

5 The invention also provides 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 a compound of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof or a composition comprising it.

10 Activity of compounds against agricultural pests does not suggest their suitability for control of endo- and ectoparasites in and on animals which requires, for example, low, non-emetic dosages in the case of oral application, metabolic compatibility with the animal, low toxicity, and a safe handling.

15 Surprisingly it has now been found that compounds of formula I are suitable for combating endo- and ectoparasites in and on animals.

20 Compounds of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof and compositions comprising them are preferably used for controlling and preventing infestations and infections 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
25 raccoon, birds such as hens, geese, turkeys and ducks and fish such as fresh- and salt-water fish such as trout, carp and eels.

30 Compounds of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof and compositions comprising them are preferably used for controlling and preventing infestations and infections in domestic animals, such as dogs or cats.

35 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.

40 The compounds of formula I or the enantiomers or veterinarily acceptable salts thereof 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.

The compounds of formula I are especially useful for combating ectoparasites.

125

The compounds of formula I are especially useful for combating parasites of the following orders and species, respectively:

- 5 fleas (Siphonaptera), e.g. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, and *Nosopsyllus fasciatus*,
- 10 cockroaches (Blattaria - Blattodea), e.g. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, and *Blatta orientalis*,
- 15 flies, mosquitoes (Diptera), e.g. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*,
- 20 *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga*
- 25 sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, and *Tabanus similis*,
- 30 lice (Phthiraptera), e.g. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurytetrus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* and *Solenopotes capillatus*.
- 35 ticks and parasitic mites (Parasitiformes): ticks (Ixodida), e.g. *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* and parasitic mites (Mesostigmata), e.g. *Ornithonyssus bacoti* and *Dermanyssus gallinae*,
- 40 Actiniedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) e.g. *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp.,

- Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., and Laminosioptes spp,
- Bugs (Heteroptera): Cimex lectularius, Cimex hemipterus, Reduvius senilis,
- 5 Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp. and Arilus critatus,
- Anoplurida, e.g. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., and Solenopotes spp,
- 10 Mallophagida (suborders Amblycera and Ischnocera), e.g. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Trichodectes spp., and Felicola spp,
- Roundworms Nematoda:
- 15 Wipeworms and Trichinosis (Trichosyringida), e.g. Trichinellidae (Trichinella spp.), (Trichuridae) Trichuris spp., Capillaria spp,
- Rhabditida, e.g. Rhabditis spp, Strongyloides spp., Helicephalobus spp,
- 20 Strongylida, e.g. Strongylus spp., Ancylostoma spp., Necator americanus, Bunostomum spp. (Hookworm), Trichostrongylus spp., Haemonchus contortus., Ostertagia spp. , Cooperia spp., Nematodirus spp., Dictyocaulus spp., Cyathostoma spp., Oesophagostomum spp., Stephanurus dentatus, Ollulanus spp., Chabertia spp.,
- 25 Stephanurus dentatus , Syngamus trachea, Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Globocephalus spp., Necator spp., Metastrongylus spp., Muellerius capillaris, Protostrongylus spp., Angiostrongylus spp., Parelaphostrongylus spp. Aleurostrongylus abstrusus, and Dioctophyma renale,
- 30 Intestinal roundworms (Ascaridida), e.g. Ascaris lumbricoides, Ascaris suum, Ascaridia galli, Parascaris equorum, Enterobius vermicularis (Threadworm), Toxocara canis, Toxascaris leonine, Skrjabinema spp., and Oxyuris equi,
- Camallanida, e.g. Dracunculus medinensis (guinea worm)
- 35 Spirurida, e.g. Thelazia spp. Wuchereria spp., Brugia spp., Onchocerca spp., Dirofilaria immitis, Dipetalonema spp., Setaria spp., Elaeophora spp., Spirocerca lupi, and Habronema spp.,
- 40 Thorny headed worms (Acanthocephala), e.g. Acanthocephalus spp., Macracanthorhynchus hirudinaceus and Oncicola spp,

127

Planarians (Plathelminthes):

- Flukes (Trematoda), e.g. *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp.,
Dicrocoelium spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp.,
5 *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., and *Nanocyetes* spp,

- Cercomeromorpha, in particular Cestoda (Tapeworms), e.g. *Diphylobothrium* spp.,
Tenia spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis*
spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp.,
10 *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., and *Hymenolepis* spp.

The compounds of formula I and compositions containing them are particularly useful
for the control of pests from the orders Diptera, Siphonaptera and Ixodida.

- 15 Moreover, the use of the compounds of formula I and compositions containing them
for combating mosquitoes is especially preferred.

The use of the compounds of formula I and compositions containing them for
combating flies is a further preferred embodiment of the present invention.

- 20 Furthermore, the use of the compounds of formula I and compositions containing
them for combating fleas is especially preferred.

- The use of the compounds of formula I and compositions containing them for
25 combating ticks is a further preferred embodiment of the present invention.

The compounds of formula I also are especially useful for combating endoparasites
(roundworms nematoda, thorny headed worms and planarians).

- 30 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.

- 35 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
40 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.

- 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
- 5 may be formulated into an implant for subcutaneous administration. In addition the formula I 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.
- 10 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
- 15 may be formulated as ear tags for animals, particularly quadrupeds such as cattle and sheep.

Suitable preparations are:

- 20 - 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;
- 25 - Formulations in which the active compound is processed in an ointment base or in an oil-in-water or water-in-oil emulsion base;
- Solid preparations such as powders, premixes or concentrates, granules, pellets,
- 30 tablets, boluses, capsules; aerosols and inhalants, and active compound-containing shaped articles.

- Compositions suitable for injection are prepared by dissolving the active ingredient in a suitable solvent and optionally adding further ingredients such as acids, bases,
- 35 buffer salts, preservatives, and solubilizers. The solutions are filtered and filled sterile.

- Suitable solvents are physiologically tolerable solvents such as water, alkanols such as ethanol, butanol, benzyl alcohol, glycerol, propylene glycol, polyethylene glycols, N-methyl-pyrrolidone, 2-pyrrolidone, and mixtures thereof.

- 40 The active compounds can optionally be dissolved in physiologically tolerable vegetable or synthetic oils which are suitable for injection.

- Suitable solubilizers are solvents which promote the dissolution of the active compound in the main solvent or prevent its precipitation. Examples are polyvinylpyrrolidone, polyvinyl alcohol, polyoxyethylated castor oil, and polyoxyethylated sorbitan ester.
- 5
- Suitable preservatives are benzyl alcohol, trichlorobutanol, p-hydroxybenzoic acid esters, and n-butanol.
- 10
- Oral solutions are administered directly. Concentrates are administered orally after prior dilution to the use concentration. Oral solutions and concentrates are prepared according to the state of the art and as described above for injection solutions, sterile procedures not being necessary.
- 15
- Solutions for use on the skin are trickled on, spread on, rubbed in, sprinkled on or sprayed on.
- Solutions for use on the skin are prepared according to the state of the art and according to what is described above for injection solutions, sterile procedures not
- 20
- being necessary.
- Further suitable solvents are polypropylene glycol, phenyl ethanol, phenoxy ethanol, ester such as ethyl or butyl acetate, benzyl benzoate, ethers such as alkylene glycol alkylether, e.g. dipropylenglycol monomethylether, ketons such as acetone,
- 25
- methylethylketone, aromatic hydrocarbons, vegetable and synthetic oils, dimethylformamide, dimethylacetamide, transcutol, solketal, propylencarbonate, and mixtures thereof.
- It may be advantageous to add thickeners during preparation. Suitable thickeners are
- 30
- inorganic thickeners such as bentonites, colloidal silicic acid, aluminium monostearate, organic thickeners such as cellulose derivatives, polyvinyl alcohols and their copolymers, acrylates and methacrylates.
- Gels are applied to or spread on the skin or introduced into body cavities. Gels are
- 35
- prepared by treating solutions which have been prepared as described in the case of the injection solutions with sufficient thickener that a clear material having an ointment-like consistency results. The thickeners employed are the thickeners given above.
- 40
- Pour-on formulations are poured or sprayed onto limited areas of the skin, the active compound penetrating the skin and acting systemically.

Pour-on formulations are prepared by dissolving, suspending or emulsifying the active compound in suitable skin-compatible solvents or solvent mixtures. If appropriate, other auxiliaries such as colorants, bioabsorption-promoting substances, antioxidants, light stabilizers, adhesives are added.

Suitable solvents which are: water, alkanols, glycols, polyethylene glycols, polypropylene glycols, glycerol, aromatic alcohols such as benzyl alcohol, phenylethanol, phenoxyethanol, esters such as ethyl acetate, butyl acetate, benzyl benzoate, ethers such as alkylene glycol alkyl ethers such as dipropylene glycol monomethyl ether, diethylene glycol mono-butyl ether, ketones such as acetone, methyl ethyl ketone, cyclic carbonates such as propylene carbonate, ethylene carbonate, aromatic and/or aliphatic hydrocarbons, vegetable or synthetic oils, DMF, dimethylacetamide, n-alkylpyrrolidones such as methylpyrrolidone, n-butylpyrrolidone or n-octylpyrrolidone, N-methylpyrrolidone, 2-pyrrolidone, 2,2-dimethyl-4-oxymethylene-1,3-dioxolane and glycerol formal.

Suitable colorants are all colorants permitted for use on animals and which can be dissolved or suspended.

Suitable absorption-promoting substances are, for example, DMSO, spreading oils such as isopropyl myristate, dipropylene glycol pelargonate, silicone oils and copolymers thereof with polyethers, fatty acid esters, triglycerides, fatty alcohols.

Suitable antioxidants are sulfites or metabisulfites such as potassium metabisulfite, ascorbic acid, butylhydroxytoluene, butylhydroxyanisole, tocopherol.

Suitable light stabilizers are, for example, novantisolic acid.

Suitable adhesives are, for example, cellulose derivatives, starch derivatives, polyacrylates, natural polymers such as alginates, gelatin.

Emulsions can be administered orally, dermally or as injections.

Emulsions are either of the water-in-oil type or of the oil-in-water type.

They are prepared by dissolving the active compound either in the hydrophobic or in the hydrophilic phase and homogenizing this with the solvent of the other phase with the aid of suitable emulsifiers and, if appropriate, other auxiliaries such as colorants, absorption-promoting substances, preservatives, antioxidants, light stabilizers, viscosity-enhancing substances.

Suitable hydrophobic phases (oils) are:

- liquid paraffins, silicone oils, natural vegetable oils such as sesame oil, almond oil, castor oil, synthetic triglycerides such as caprylic/capric biglyceride, triglyceride
- 5 mixture with vegetable fatty acids of the chain length C₈-C₁₂ or other specially selected natural fatty acids, partial glyceride mixtures of saturated or unsaturated fatty acids possibly also containing hydroxyl groups, mono- and diglycerides of the C₈-C₁₀ fatty acids,
- fatty acid esters such as ethyl stearate, di-n-butyl adipate, hexyl laurate, dipropylene
- 10 glycol perlargonate, esters of a branched fatty acid of medium chain length with saturated fatty alcohols of chain length C₁₆-C₁₈, isopropyl myristate, isopropyl palmitate, caprylic/capric acid esters of saturated fatty alcohols of chain length C₁₂-C₁₈, isopropyl stearate, oleyl oleate, decyl oleate, ethyl oleate, ethyl lactate, waxy fatty acid esters such as synthetic duck coccygeal gland fat, dibutyl phthalate, diisopropyl
- 15 adipate, and ester mixtures related to the latter, fatty alcohols such as isotridecyl alcohol, 2-octyldodecanol, cetylstearyl alcohol, oleyl alcohol, and fatty acids such as oleic acid and mixtures thereof.

- Suitable hydrophilic phases are: water, alcohols such as propylene glycol, glycerol,
- 20 sorbitol and mixtures thereof.

Suitable emulsifiers are:

- non-ionic surfactants, e.g. polyethoxylated castor oil, polyethoxylated sorbitan monooleate, sorbitan monostearate, glycerol monostearate, polyoxyethyl stearate,
- 25 alkylphenol polyglycol ether;
- ampholytic surfactants such as di-sodium N-lauryl-p-iminodipropionate or lecithin;
- anionic surfactants, such as sodium lauryl sulfate, fatty alcohol ether sulfates, mono/dialkyl polyglycol ether orthophosphoric acid ester monoethanolamine salt;
- cation-active surfactants, such as cetyltrimethylammonium chloride.

- 30 Suitable further auxiliaries are: substances which enhance the viscosity and stabilize the emulsion, such as carboxymethylcellulose, methylcellulose and other cellulose and starch derivatives, polyacrylates, alginates, gelatin, gum arabic, polyvinylpyrrolidone, polyvinyl alcohol, copolymers of methyl vinyl ether and maleic anhydride, polyethylene glycols, waxes, colloidal silicic acid or mixtures of the
- 35 substances mentioned.

- Suspensions can be administered orally or topically/dermally. They are prepared by suspending the active compound in a suspending agent, if appropriate with addition of
- 40 other auxiliaries such as wetting agents, colorants, bioabsorption-promoting substances, preservatives, antioxidants, light stabilizers.

Liquid suspending agents are all homogeneous solvents and solvent mixtures.

Suitable wetting agents (dispersants) are the emulsifiers given above.

5

Other auxiliaries which may be mentioned are those given above.

Semi-solid preparations can be administered orally or topically/dermally. They differ from the suspensions and emulsions described above only by their higher viscosity.

10

For the production of solid preparations, the active compound is mixed with suitable excipients, if appropriate with addition of auxiliaries, and brought into the desired form.

Suitable excipients are all physiologically tolerable solid inert substances. Those used are inorganic and organic substances. Inorganic substances are, for example, sodium chloride, carbonates such as calcium carbonate, hydrogencarbonates, aluminium oxides, titanium oxide, silicic acids, argillaceous earths, precipitated or colloidal silica, or phosphates. Organic substances are, for example, sugar, cellulose, foodstuffs and feeds such as milk powder, animal meal, grain meals and shreds, starches.

20

Suitable auxiliaries are preservatives, antioxidants, and/or colorants which have been mentioned above.

Other suitable auxiliaries are lubricants and glidants such as magnesium stearate, stearic acid, talc, bentonites, disintegration-promoting substances such as starch or crosslinked polyvinylpyrrolidone, binders such as starch, gelatin or linear polyvinylpyrrolidone, and dry binders such as microcrystalline cellulose.

25

In general, "parasitically effective amount" means 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.

30

35

The compositions which can be used in the invention can comprise generally from about 0.001 to 95% of the compound of formula I.

40

Generally it is favorable to apply the compounds of formula I in total amounts of 0.5 mg/kg to 100 mg/kg per day, preferably 1 mg/kg to 50 mg/kg per day.

133

Ready-to-use preparations contain the compounds acting against parasites, preferably ectoparasites, in concentrations of 10 ppm to 80 per cent by weight, preferably from 0.1 to 65 per cent by weight, more preferably from 1 to 50 per cent by weight, most preferably from 5 to 40 per cent by weight.

Preparations which are diluted before use contain the compounds acting against ectoparasites in concentrations of 0.5 to 90 per cent by weight, preferably of 1 to 50 per cent by weight.

Furthermore, the preparations comprise the compounds of formula I against endoparasites in concentrations of 10 ppm to 2 per cent by weight, preferably of 0.05 to 0.9 per cent by weight, very particularly preferably of 0.005 to 0.25 per cent by weight.

In a preferred embodiment of the present invention, the compositions comprising the compounds of formula I them are applied dermally / topically.

In a further preferred embodiment, the topical application is conducted in the form of compound-containing shaped articles such as collars, medallions, ear tags, bands for fixing at body parts, and adhesive strips and foils.

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, most preferably 25 mg/kg to 160 mg/kg body weight of the treated animal in the course of three weeks.

For the preparation of the shaped articles, thermoplastic and flexible plastics as well as elastomers and thermoplastic elastomers are used. Suitable plastics and elastomers are polyvinyl resins, polyurethane, polyacrylate, epoxy resins, cellulose, cellulose derivatives, polyamides and polyester which are sufficiently compatible with the compounds of formula I. A detailed list of plastics and elastomers as well as preparation procedures for the shaped articles is given e.g. in WO 03/086075.

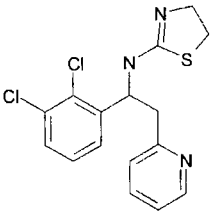
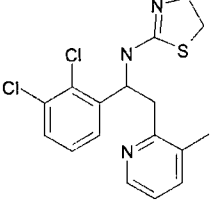
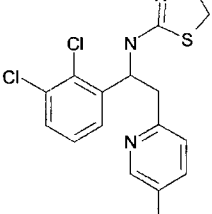
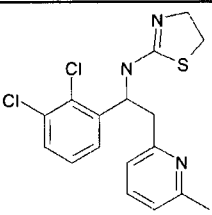
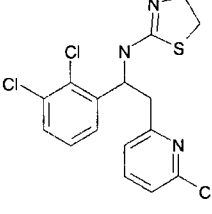
The present invention is now illustrated in further detail by the following examples.

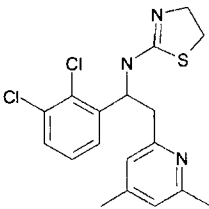
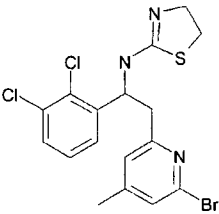
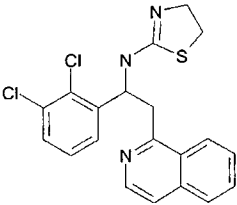
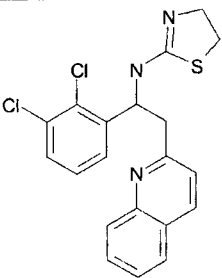
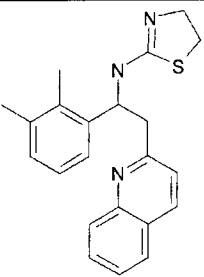
Compound examples

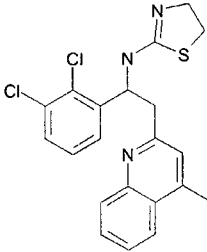
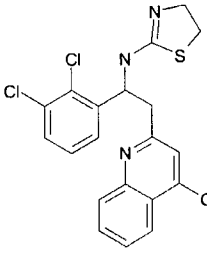
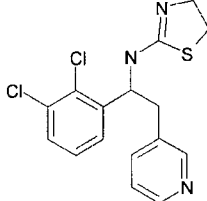
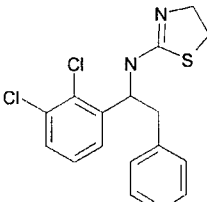
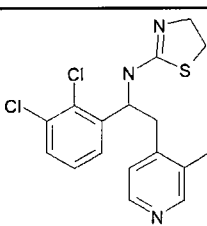
The compounds of formula I according to the invention as well as intermediates were characterized by coupled High Performance Liquid Chromatography / mass spectroscopy (HPLC/MS), by NMR or by their melting points. HPLC column: RP-18 column (Chromolith Speed ROD from Merck KGaA, Germany). Elution: acetonitrile +

0.1% trifluoroacetic acid (TFA) / water + 0.1 % TFA in a ratio of from 5:95 to 95:5 in 5 minutes at 40 °C. MS Quadrupol electrospray ionisation, 80 V (positive modus).

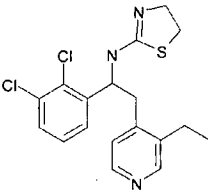
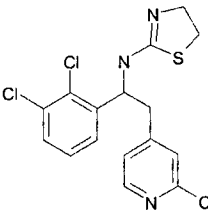
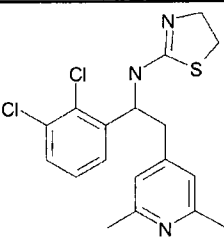
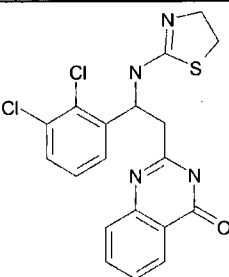
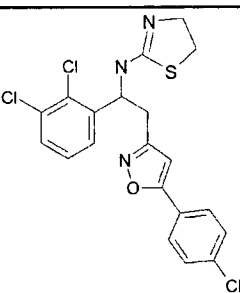
Table C:

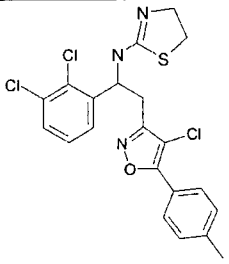
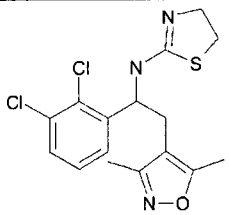
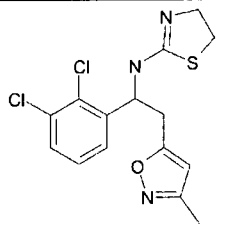
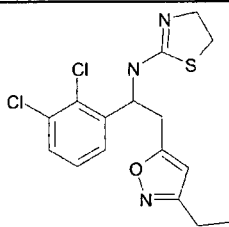
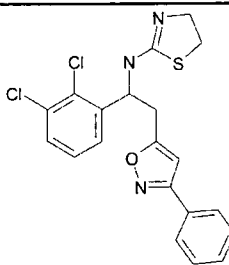
n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
1.		m.p. = 160 - 162°C
2.		$^1\text{H-NMR}$: 2.16 (s, 3H), 3.12-3.34 (m, 4H), 3.67-3.80 (m, 2H), 5.44-5.47 (m, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 8.40 (d, 1H)
3.		$^1\text{H-NMR}$: 2.30 (s, 3H), 3.02 (dd, 1H), 3.06-3.22 (m, 2H), 3.30 (dd, 1H), 3.79-3.92 (m, 2H), 5.40-5.44 (m, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.02-7.07 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 2H), 8.36 (s, 1H)
4.		$^1\text{H-NMR}$: 2.58 (s, 3H), 3.00 (dd, 1H), 3.19-3.31 (m, 3H), 3.79-3.92 (m, 2H), 5.37-5.40 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.98-7.10 (m, 3H), 7.31 (dd, 1H), 7.40 (t, 1H)
5.		t_r = 2.72 min m/z = 386 (M+1)

n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
6.		m.p. = 111 - 113°C
7.		$^1\text{H-NMR}$: 2.48 (s, 3H), 2.83 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 3.21-3.24 (m, 2H), 3.72-3.75 (m, 2H), 5.11-5.16 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.17-7.30 (m, 2H), 7.40 (d, 1H)
8.		m.p. = 117 - 121°C
9.		m.p. = 129 - 131°C
10.		m.p. = 139 - 141°C

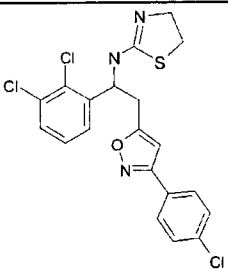
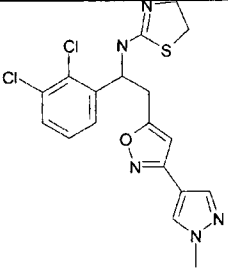
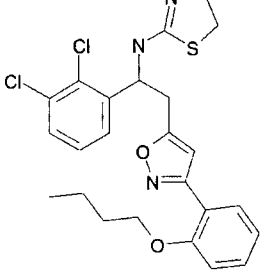
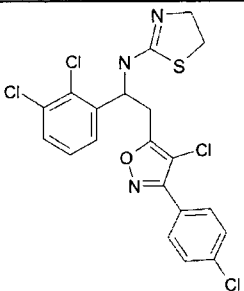
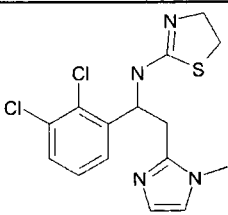
n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t _r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift (¹ H-NMR [CDCl ₃ , δ ppm])
11.		m.p. = 126 - 128°C
12.		m.p. = 71 - 73°C
13.		m.p. = 190 - 193°C
14.		m.p. = 224 - 225°C
15.		m.p. = 157 - 159°C

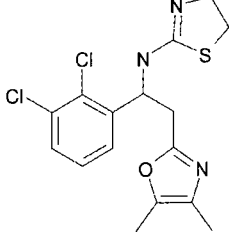
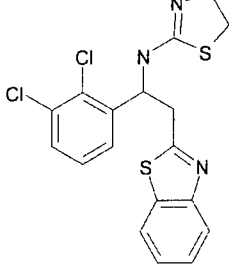
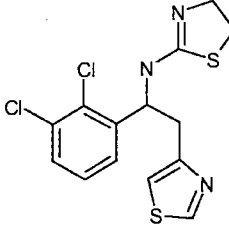
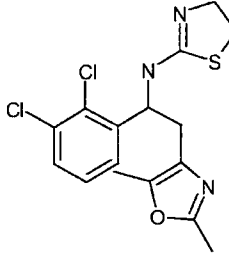
137

n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
16.		m.p. = 132 - 134°C
17.		t_r = 2.80 min m/z = 386 (M+1)
18.		$^1\text{H-NMR}$: 2.47 (s, 6H), 2.79 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 3.20-3.25 (m, 2H), 3.77-3.87 (m, 2H), 5.21-5.24 (m, 1H), 6.78 (s, 2H), 7.17-7.29 (m, 2H), 7.40 (d, 1H)
19.		m.p. = 293 - 294°C
20.		t_r = 3.26 min m/z = 452 (M+1)

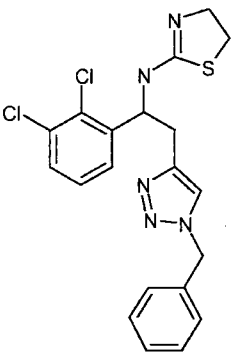
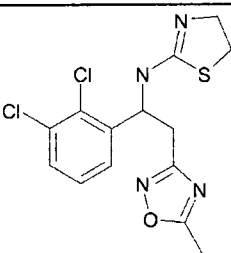
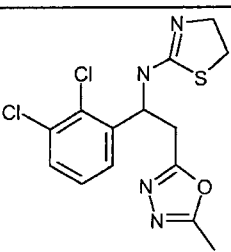
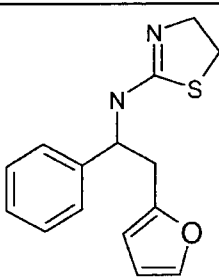
n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
21.		t_r = 3.46 min m/z = 466 (M+1)
22.		m.p. = 188 -194°C
23.		m.p. = 128 - 130°C
24.		$^1\text{H-NMR}$: 1.22 (t, 3H), 2.63 (q, 2H), 3.17 (dd, 1H), 3.21-3.32 (m, 3H), 3.77-3.82 (m, 2H), 5.32-5.37 (m, 1H), 5.81 (s, 1H), 7.11-7.24 (m, 2H), 7.37 (dd, 1H)
25.		t_r = 2.98 min m/z = 418 (M+1)

139

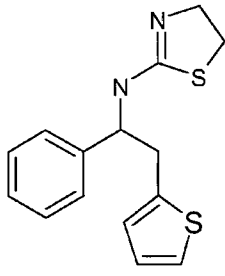
n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
26.		$t_r = 3.24$ min $m/z = 452$ (M+1)
27.		$t_r = 2.43$ min $m/z = 422$ (M+1)
28.		$t_r = 3.49$ min $m/z = 490$ (M+1)
29.		$t_r = 3.46$ min $m/z = 486$ (M+1)
30.		m.p. = 195 - 196°C

n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
31.		m.p. = 146 - 149°C
32.		m.p. = 165 - 166°C
33.		m.p. = 154 - 156°C
34.		t_r = 2.56 min m/z = 370 ($M+1$)

A4

n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t_r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
35.		m.p. = 74 - 89°C
36.		m.p. = 137 - 141°C
37.		t_r = 2.342 min m/z = 357 (M+1)
38.		$^1\text{H-NMR}$ = 3.2-3.4 (m), 3.85 (mc), 4.95 (mc), 5.95 (d), 6.20 (d), 7.05- 7.4 (m).

142

n° of compound	Formula	Physical property (m.p. [°C], retention time t _r [min], mass spectrum m/z (HPLC/MS) or chemical shift (¹ H-NMR [CDCl ₃ , δ ppm])
39.		¹ H-NMR = 3.25 (t), 3.35 (mc), 3.9 (t), 4.85 (mc), 6.7-7.4 (m)

P. Preparation examples

- 5 The compounds of formula I according to the present invention can be prepared by different methods and via different intermediate products as described in the following:

P.I Method A

- 10 P.I.1. Preparation level 1: Ethylamine derivatives as intermediate compounds

P.I.1.a) Step 1: Preparation of 2-(2-nitro-2-phenyl-vinyl)-thiophene

- 15 To a solution of nitromethyl benzene (1.00 g; cf. J. Org. Chem. 2004, 6907-6908) and thiophene-2-carbaldehyde (0.42 g) in toluene (10 ml) was added potassium fluoride (42 mg) and dimethylamine hydrochloride (0.60 g) and the solution was heated under reflux in a Dean Stark trap for 4 h. The solvent was evaporated and the residue dissolved in dichloromethane, washed with water and dried over sodium sulphate. Evaporation of the solvent yielded a crude product (1.35 g), which was further purified
- 20 by titration in a 1:1 mixture of hexane and ethyl acetate giving 0.96 g of the product.

P.I.1.a) Step 2: Preparation of 1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethylamine

- 25 To a slurry of lithium aluminium hydride (0.75 g) in anhydrous tetrahydrofuran (15 ml) was added at 0 °C conc. sulphuric acid (0.49 g) portionwise (exothermic reaction) within 30 min and stirring continued for an additional 30 min at the same temperature. A solution of 2-(2-nitro-2-phenyl-vinyl)-thiophene (0.96 g) in tetrahydrofuran (17 ml) was added within 30 min and stirring continued for 1 h at 0 °C and then for 3 h at room temperature. The reaction mixture was quenched with a diluted sodium

hydroxide solution and the precipitates removed by filtration. The filtrate was dried over sodium sulphate and concentrated in vacuo to yield 1.02 g of crude 1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethylamine that was used without further purification for the next step.

5 P.I.1.b) Step 1: Preparation of benzhydrylidene-(2,3-dichloro-benzyl)-amine

A mixture of 2,3-dichlorobenzylamine (23.5 g) and benzophenone imine (26.6 g) in dichloromethane (100 mL) was stirred overnight at room temperature and subsequently refluxed for 4 h. The mixture was concentrated in vacuo, the residue
10 triturated in methanol and filtered to deliver the title compound (39.1 g, 82 wt.%).

P.I.1.b) Step 2: Preparation of benzhydrylidene-[1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(3-ethylisoxazol-5-yl)-ethyl]-amine

15 A mixture of benzhydrylidene-(2,3-dichloro-benzyl)-amine (1.50 g), 5-chloromethyl-3-ethylisoxazole (1.28 g), benzyltriethylammonium chloride (100 mg), sodium hydroxide (1.06 g), potassium carbonate (2.44 g) and sodium iodide (66 mg) in acetonitrile (50 mL) was refluxed for 3 h. The mixture was then diluted with diethyl ether, washed with water, dried over sodium sulfate and concentrated in vacuo. The residue was
20 chromatographed to deliver the title compound (1.58 g, 76 wt.%).

P.I.1.b) Step 3: Preparation of 1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(3-ethyl-isoxazol-5-yl)-ethylamine

25 A 10% aqueous solution of HCl (12 mL) was added to a solution of benzhydrylidene-[1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(3-ethylisoxazol-5-yl)-ethyl]-amine (500 mg) in diethyl ether (10 mL) and the mixture stirred overnight. The phases were then separated, the aqueous layer was washed with ethyl acetate, basified to pH 8 with saturated aqueous sodium bicarbonate and extracted with dichloromethane. The extracts were
30 dried over sodium sulfate and concentrated to deliver the title compound (270 mg, 81 wt.%).

P.I.1.c) Preparation of 1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(4-methyl-quinolin-2-yl) ethylamine

35 A 1 M solution of lithium bis(trimethylsilyl)amide in tetrahydrofuran (11 mL) was added dropwise to a solution of 2,3-dichlorobenzaldehyde (1.75 g) in tetrahydrofuran (25 mL) at 0 °C. The mixture was stirred for 15 min at 0 °C and then 1 h at room temperature. In the meantime, a 1.5 M solution of n-butyllithium in n-hexane (7 mL) was added dropwise to a solution of 2,4-dimethylquinoline (1.57 g) in tetrahydrofuran (12 mL) at -
40 78 °C. After stirring for 30 min at -78 °C, 30 min at 0 °C and 15 min at room temperature, the solution of trimethylsilylimine was added dropwise at -78 °C, the resulting mixture stirred for 2.5 h, poured into ice-water and extracted with ethyl

acetate. The combined organic extracts were washed with water, dried over sodium sulphate, concentrated in vacuo and the residue chromatographed to deliver the title compound (2.54 g, 77 wt.%).

5 P.I.2. Preparation level 2: Thiourea derivative as intermediate compound

P.I.2.a) Preparation of 1-(2-hydroxy-ethyl)-3-(1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethyl) thiourea

10 To a solution of thiophosgene (0.70 g) in dichloromethane was added a solution of potassium carbonate (1.70 g) in water (6 ml). To this mixture was added a solution of 1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethylamine (1.00 g) in dichloromethane dropwise at room temperature. After stirring for 5 h the mixture was washed with water and the organic phase dried over sodium sulphate and concentrated in vacuo to yield the crude isothiocyanate, which was dissolved in dichloromethane (70 ml) and treated with
15 ethanolamine (0.24 g). This reaction mixture was stirred for 3 h, then concentrated in vacuo and the remainder purified by column chromatography to yield 0.92 g of 1-(2-hydroxy-ethyl)-3-(1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethyl)-thiourea, mp. 109-112 °C.

20 P.I.3. Preparation level 3: Compound of formula I according to the invention

P.I.3.a)-1 Preparation of (4,5-dihydro-thiazol-2-yl)-(1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethyl)-amine (compound example 39 of table C)

25 To a solution of 1-(2-hydroxy-ethyl)-3-(1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethyl)-thiourea (0.71 g) and triphenylphosphine (0.91 g) in tetrahydrofuran (24 ml) was added dropwise at room temperature a solution of diisopropylazodicarboxylate (0.60 g) in tetrahydrofuran (7 ml). After stirring for 1 h the reaction mixture was concentrated in vacuo and the remainder purified by column chromatography to yield 0.45 g of the product.

30 P.I.3.a)-2 Preparation of (4,5-dihydro-thiazol-2-yl)-(1-phenyl-2-furan-2-yl-ethyl)-amine (compound example 38 of table C)

35 To a solution of 1-(2-hydroxy-ethyl)-3-(1-phenyl-2-furan-2-yl-ethyl)-thiourea (0.72 g) (prepared in a similar way as described above for 1-(2-hydroxy-ethyl)-3-(1-phenyl-2-thiophen-2-yl-ethyl)-thiourea) and diisopropylethylamine (0.45 g) in propionitrile (7 ml) was added cyanomethyl-trimethyl-phosphonium iodide (J. Med. Chem. 2004, 6055-6069). The reaction mixture was heated up to 90 °C for 6 h and stirred at room temperature overnight. Ethyl acetate was added and washed with diluted potassium carbonate solution (5 wt.% in water), water and dried over sodium sulphate. The
40 remainder was purified by column chromatography to yield the product in 0.37 g.

P.II. Method B

145

P.II.1. Preparation level 1: Thiazolidine-3-carboxylic acid tert-butyl ester as intermediate compound

5 P.II.1. Step 1: Preparation of (2,3-dichloro-benzyl)-(4,5-dihydro-thiazol-2-yl)-amine

A solution of 2-chloroethyl isothiocyanate (3.45 g) in diethyl ether (20 mL) was added dropwise to a solution of 2,3-dichlorobenzylamine (5.00 g) in diethyl ether (80 mL) at 0 °C and the mixture was allowed to warm up to room temperature over 3 h. 1 M aqueous NaOH (100 mL) was then added and the mixture stirred for 1 h. The layers were then separated, the organic phase washed with water, dried over sodium sulfate and concentrated in vacuo. The residue was chromatographed to deliver the title compound (7.79 g, 94 wt.%).

15 P.II.1. Step 2: Preparation of 2-(2,3-dichloro-benzylimino)-thiazolidine-3-carboxylic acid tert-butyl ester

Di-tert-butyl dicarbonate (9.77 g) was added to a solution of (2,3-dichloro-benzyl)-(4,5-dihydro-thiazol-2-yl)-amine (7.79 g) in dichloromethane (100 mL) at 0 °C and the mixture was allowed to warm to room temperature overnight. The solution was washed with water, dried over sodium sulfate, concentrated in vacuo and the residue chromatographed to deliver the title compound (6.84 g, 67 wt.%).

25 P.II.1. Step 3: Preparation of 2-[1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-pyridin-3-yl-ethylimino]-thiazolidine-3-carboxylic acid tert-butyl ester

A solution of 1.3 M sec-butyllithium in cyclohexane (1.7 mL) was added dropwise to a mixture of potassium tert-butoxide (247 mg) in tetrahydrofuran (6 mL) at -78 °C and the mixture stirred for 15 min. A solution of 2-(2,3-dichloro-benzylimino)-thiazolidine-3-carboxylic acid tert-butyl ester (361 mg) in tetrahydrofuran (4 mL) was then added dropwise and the mixture stirred for 2 h. A solution of 3-chloromethyl-pyridine (281 mg) in tetrahydrofuran (2 mL) was then added dropwise and the mixture stirred for 30 min at -78 °C and then 30 min at -30 °C. Saturated aqueous ammonium chloride was then added at 0 °C and the mixture extracted with ethyl acetate. The combined organic extracts were dried over sodium sulfate, concentrated and the residue chromatographed to deliver the title compound (380 mg, 75 wt.%).

40 P.II.2. Preparation level 2: Compound of formula I according to the invention

P.II.2. Preparation of [1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(2,5-dimethyl-oxazol-4-yl)-ethyl] 4,5-dihydro-thiazol-2-yl)-amine (compound example 34 of table C)

Trifluoroacetic acid (10 μ L) was added dropwise to a solution of 2-[1-(2,3-dichloro-phenyl)-2-(2,5-dimethyl-oxazol-4-yl)-ethylimino]-thiazolidine-3-carboxylic acid tert-butyl ester (65 mg) (prepared analogously as described above) in tetrahydrofuran (1 mL) at 0 °C and the mixture allowed to warm to room temperature over 1 h. The title compound was obtained in > 80% purity according to HPLC-MS [t_r = 2.56 min, m/z = 370 (M+1)].

B. Biological examples

Examples of action against pests

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

B.1 Cotton Aphid (*Aphis gossypii*)

The active compounds were formulated in 50:50 acetone : water and 100 ppm Kinetica™ surfactant.

Cotton plants in the cotyledon stage (variety 'Delta Pine') are infested with approximately 100 laboratory-reared aphids by placing infested leaf sections on top of the test plants. The leaf sections are removed after 24 hr. The cotyledons of the intact plants are dipped into gradient solutions of the test compound. Aphid mortality on the treated plants, relative to mortality on check plants, is determined after 5 days.

In this test, the compound examples 1,3,4,6,8,9,24,38 and 39 of table C showed at 300 ppm over 80% mortality in comparison with untreated controls.

B.2 Green Peach Aphid (*Myzus persicae*)

The active compounds were formulated in 50:50 acetone : water and 100 ppm Kinetica™ surfactant.

Pepper plants in the 2nd leaf-pair stage (variety 'California Wonder') are infested with approximately 40 laboratory-reared aphids by placing infested leaf sections on top of the test plants. The leaf sections are removed after 24 hr. The leaves of the intact plants are dipped into gradient solutions of the test compound. Aphid mortality on the treated plants, relative to mortality on check plants, is determined after 5 days.

147

In this test, the compound examples 1,3,4,6,8,9,13,24,38 and 39 of table C showed at 300 ppm over 80% mortality in comparison with untreated controls.

B.3 Cowpea aphid (*aphis craccivora*)

5

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water. Potted cowpea plants colonized with 100 - 150 aphids of various stages were sprayed after the pest population has been recorded. Population reduction was recorded after 24, 72, and 120 hours.

10

In this test, compounds examples 1,3,4,6,8,9,23 and 31 of table C showed at 300 ppm over 80% mortality in comparison with untreated controls.

B.4 Vetch aphid (*Megoura viciae*)

15

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 twice.

20

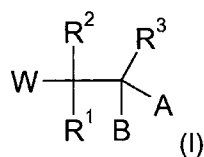
In this test, compound examples 1-4,6,8 and 9 of table C showed at 2500 ppm over 80% mortality in comparison with untreated controls.

148

Claims:

1. 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of the general formula (I):

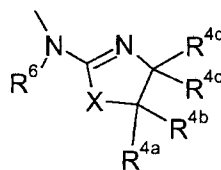
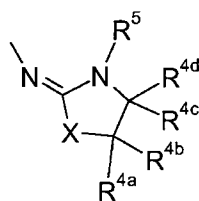
5



wherein

- 10 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3$ are selected from hydrogen, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-cycloalkyl}$, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyloxy}$, $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkynyloxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$ and $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylthio}$; phenyl or benzyl, each unsubstituted or substituted with any combination of one to five halogen, one to three $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$ or $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkoxy}$ groups;
- 15
- 20

A is a radical of the formulae A^1 or A^2 :



25

 A^1 A^2

wherein

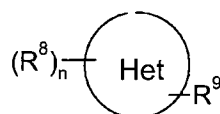
X is sulfur or oxygen;

- 30 $\text{R}^{4a}, \text{R}^{4b}, \text{R}^{4c}, \text{R}^{4d}$ are each independently selected from one another from hydrogen, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-haloalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylamino}$, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy}$, $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-cycloalkyl}$, wherein the

149

- carbon atoms in the aliphatic radicals of the
aforementioned groups may carry any combination of
one, two or three radicals, independently of one another
selected from the group consisting of halogen, cyano,
5 nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl,
C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-
alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-
haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;
- 10 R⁵, R⁶, R⁹ are each independently selected from one another from hydrogen,
cyano, nitro, formyl, C(=O)R^{5c} or C(=O)R^{6c} or C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-alkyl,
C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-
alkoxy)methylen, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfenyl or C₁-C₆-
alkylsulfonyl wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the
15 aforementioned groups may carry any combination of 1, 2 or 3
radicals, independently of one another selected from the group
consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino,
carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-
alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;
20 C(O)NR^{5a}R^{5b} or C(O)NR^{6a}R^{6b} or C(O)NR^{9a}R^{9b}, (SO₂)NR^{5a}R^{5b} or
(SO₂)NR^{6a}R^{6b} or (SO₂)NR^{9a}R^{9b},
phenyl, phenyloxy or benzyl, each of the last three mentioned
radicals may be unsubstituted or substituted with 1 to 5 radicals,
independently of one another selected from the group consisting of
25 one to five halogen radicals, one to three C₁-C₆-alkyl, one to three
C₁-C₆-haloalkyl, one to three C₁-C₆-alkylthio, one to three C₁-C₆-
haloalkylthio, one to three C₁-C₆-alkoxy and one to three C₁-C₆-
haloalkoxy radicals;
and wherein R^{5a}, R^{6a}, R^{9a}, R^{5b}, R^{6b}, R^{9b}, R^{5c}, R^{6c} and R^{9c} are defined
30 as below
- B is an optionally substituted phenyl ring system
- W is a 5- to 6-membered heteroaromatic ring which may contain 1 to 4
35 heteroatoms selected from oxygen, nitrogen and sulfur,
wherein the heteroaromatic ring may optionally 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,

and wherein the 5- to 6-membered heteroaromatic ring or the respective fused ring systems may be unsubstituted or optionally substituted by R^9 and/or any combination of 1 to 4 groups R^8 :



5

wherein n is 0, 1, 2, 3, or 4;

and R^8 is defined as below;

and R^9 is defined as above

10

and wherein

15

R^8 is selected from halogen, OH, SH, NH_2 , SO_3H , COOH, cyano, azido, nitro, formyl, $CONH_2$, $CSNH_2$, $CH=N-OH$, $CH=N-O-(C_1-C_6)$ -alkyl, $C(=O)R^{8c}$, $C(=S)R^{8c}$, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_3-C_8 -cycloalkyl, C_1-C_6 -alkylamino, C_2-C_6 -alkenylamino, C_2-C_6 -alkynylamino, di(C_1-C_6 -alkyl)amino, di(C_2-C_6 -alkenyl)amino, di(C_2-C_6 -alkynyl)amino, C_1-C_6 -alkylthio, C_2-C_6 -alkenylthio, C_2-C_6 -alkynylthio, C_1-C_6 -alkylsulfonyl, C_2-C_6 -alkenylsulfonyl, C_2-C_6 -alkynylsulfonyl, (C_1-C_6 -alkyl)carbonyl, (C_2-C_6 -alkenyl)-carbonyl, (C_2-C_6 -alkynyl)-carbonyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyloxy, C_2-C_6 -alkynyloxy, (C_1-C_6 -alkoxy)carbonyl, (C_2-C_6 -alkenyloxy)carbonyl, (C_2-C_6 -alkynyloxy)-carbonyl, (C_1-C_6 -alkyl)carbonyloxy, (C_2-C_6 -alkenyl)-carbonyl-oxy, (C_2-C_6 -alkynyl)carbonyloxy, (C_1-C_6 -alkyl)carbonyl-amino, (C_2-C_6 -alkenyl)carbonyl-amino, (C_2-C_6 -alkynyl)carbonyl-amino, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C_1-C_6 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_2-C_6 -alkynyl, C_1-C_6 -alkoxy, C_2-C_6 -alkenyloxy, C_2-C_6 -alkynyloxy, C_1-C_6 -haloalkoxy, C_1-C_6 -haloalkyl and C_1-C_6 -alkylthio; $C(O)NR^{8a}R^{8b}$, $(SO_2)NR^{8a}R^{8b}$; wherein R^{8a} , R^{8b} and R^{8c} are defined as below,

30

a radical Y-Ar or a radical Y-Cy, wherein

Y is a single bond, O, S, NH, C₁-C₆-alkandiyyl or C₁-C₆-alkandiyloxy;

Ar is phenyl, naphthyl or a mono- or bicyclic 5- to 10-membered heteroaromatic ring, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, wherein Ar is unsubstituted or may carry any combination of one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

Cy is C₃-C₁₂-cycloalkyl, which is unsubstituted or substituted with one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

and wherein

R^{5a}, R^{6a}, R^{8a} and R^{5b}, R^{6b}, R^{8b}

are each independently selected from one another from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, or C₂-C₆-alkynyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;

and R^{5c}, R^{6c}, R^{8c} and R^{9c}

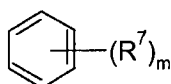
are selected each independently from one another from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, hydrazino, (C₁-C₆-

152

alkyl)hydrazino, di(C₁-C₆-alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N

5 or the enantiomers, diastereomers or salts thereof.

2. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein B is selected from:



10

wherein

m is 0, 1, 2, 3, 4 or 5;

- 15 R⁷ is selected from halogen, OH, SH, NH₂, SO₃H, COOH, cyano, azido, nitro, formyl, CONH₂, CSNH₂, CH=N-OH, CH=N-O-(C₁-C₆)-alkyl, C(=O)R^{7c}, C(=S)R^{7c}, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-alkenylamino, C₂-C₆-alkynylamino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₂-C₆-alkenyl)amino, di(C₂-C₆-alkynyl)amino, di(C₁-C₆-alkylthio), C₂-C₆-alkenylthio, C₂-C₆-alkynylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₂-C₆-alkenylsulfonyl, C₂-C₆-alkynylsulfonyl, (C₁-C₆-alkyl)carbonyl, (C₂-C₆-alkenyl)carbonyl, (C₂-C₆-alkynyl)carbonyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenylalkoxy, C₂-C₆-alkynylalkoxy, (C₁-C₆-alkoxy)carbonyl, (C₂-C₆-alkenylalkoxy)carbonyl, (C₂-C₆-alkynylalkoxy)carbonyl, (C₁-C₆-alkyl)carbonyloxy, (C₂-C₆-alkenyl)carbonyloxy, (C₂-C₆-alkynyl)carbonyloxy, (C₁-C₆-alkyl)carbonylamino, (C₂-C₆-alkenyl)carbonylamino, (C₂-C₆-alkynyl)carbonylamino, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenylalkoxy, C₂-C₆-alkynylalkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio; C(O)NR^{7a}R^{7b} or (SO₂)NR^{7a}R^{7b}; wherein R^{7a}, R^{7b} and R^{7c} are defined as below,
- 35

a radical Y-Ar or a radical Y-Cy, wherein

Y is a single bond, O, S, NH, C₁-C₆-alkandiyl or C₁-C₆-alkandioxy;

5 Ar is phenyl, naphthyl or a mono- or bicyclic 5- to 10-membered heteroaromatic ring, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, wherein Ar is unsubstituted or may carry any combination of one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, 10 nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

15 Cy is C₃-C₁₂-cycloalkyl, which is unsubstituted or substituted with one to five radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

20 and wherein the radical R⁷ that is bound to adjacent carbon atoms of the phenyl rings may optionally form, together with said carbon atoms, a fused benzene ring, a fused saturated or partially unsaturated 5-, 6-, or 7-membered carbocycle or a fused 5-, 6- or 7-membered 25 heterocycle, which contains 1, 2, 3 or 4 heteroatoms selected from 1 or 2 oxygen, 1 or 2 sulfur and 1 to 3 nitrogen atoms as ring members, and wherein the fused ring is unsubstituted or may carry 1, 2, 3 or 4 radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy and C₁-C₆-alkylthio;

and wherein

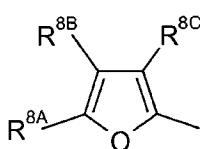
35 R^{7a} and R^{7b} are each independently selected from one another from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, or C₂-C₆-alkynyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any

combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;

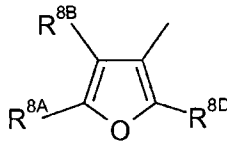
R^{7c}

are selected each independently from one another from hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₃-C₈-cycloalkyl, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkoxy, (C₁-C₆-alkyl)amino, di(C₁-C₆-alkyl)amino, hydrazino, (C₁-C₆-alkyl)hydrazino, di(C₁-C₆-alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O, S and N

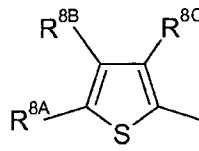
3. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein W is selected from:



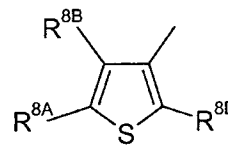
W.1



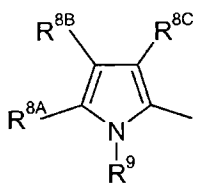
W.2



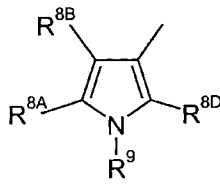
W.3



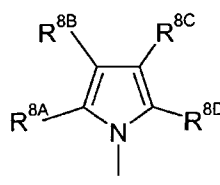
W.4



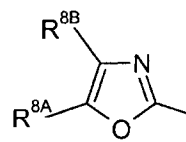
W.5



W.6

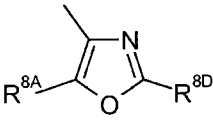


W.7

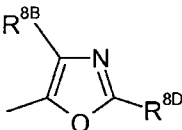


W.8

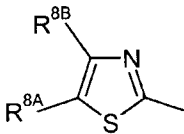
153



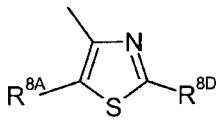
W.9



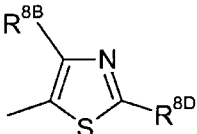
W.10



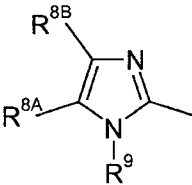
W.11



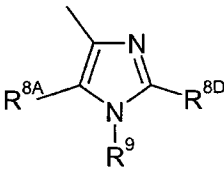
W.12



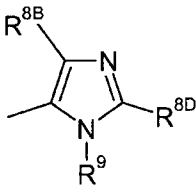
W.13



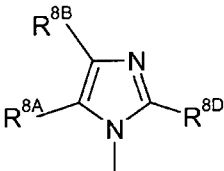
W.14



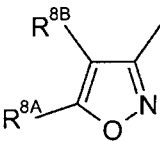
W.15



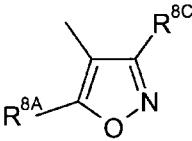
W.16



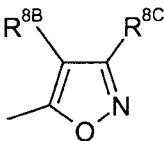
W.17



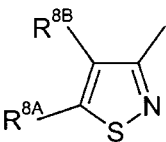
W.18



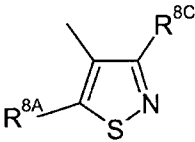
W.19



W.20



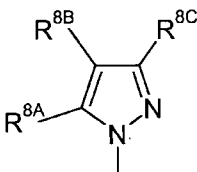
W.21



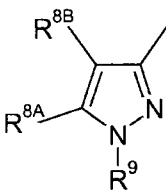
W.22



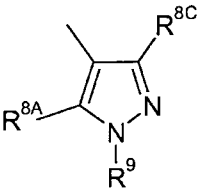
W.23



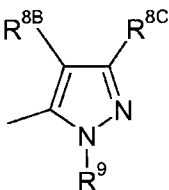
W.24



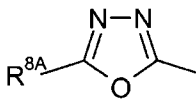
W.25



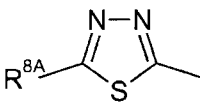
W.26



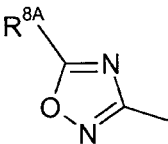
W.27



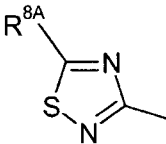
W.28



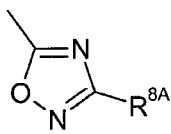
W.29



W.30



W.31



W.32

5

10

DELEGATURA

PROPIEDAD

DVN
NON

Organización y
Digitalización CSA Ltda

INDUSTRIAL

PATENTE DE

CONVENCIÓN

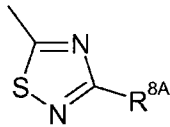
08-75128

2 / 2

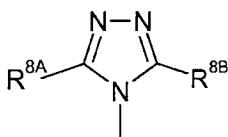
1. The first part of the document is a list of names and addresses, which are arranged in a columnar format. The names are written in a cursive script, and the addresses are written in a more formal, printed style. The list is organized into four distinct groups, each separated by a horizontal line. The first group contains names and addresses, the second group contains names and addresses, the third group contains names and addresses, and the fourth group contains names and addresses. The list is organized into four distinct groups, each separated by a horizontal line. The first group contains names and addresses, the second group contains names and addresses, the third group contains names and addresses, and the fourth group contains names and addresses.

75128-08
2/2

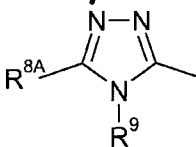
156



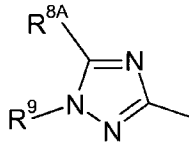
W.33



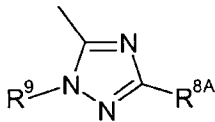
W.34



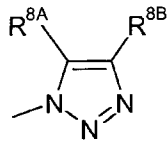
W.35



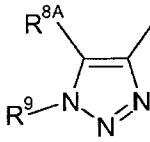
W.36



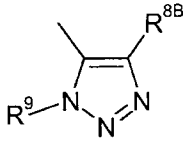
W.37



W.38

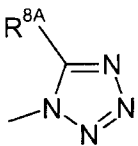


W.39

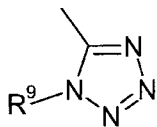


W.40

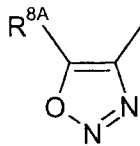
5



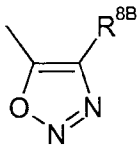
W.41



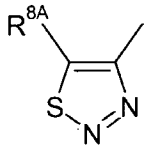
W.42



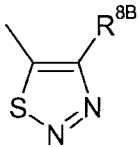
W.43



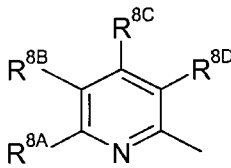
W.44



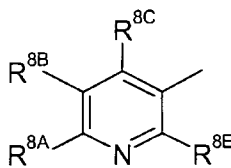
W.45



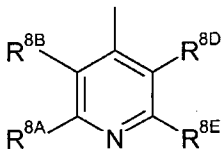
W.46



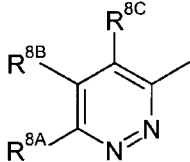
W.47



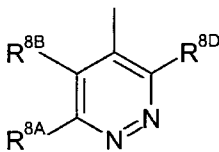
W.48



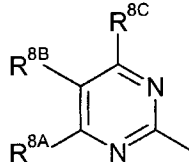
W.49



W.50



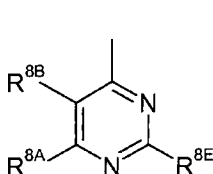
W.51



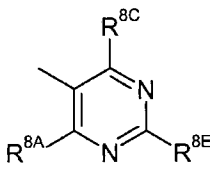
W.52

10

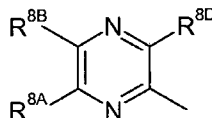
15A



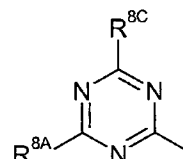
W.53



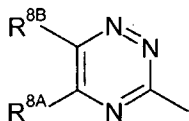
W.54



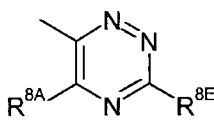
W.55



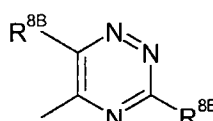
W.56



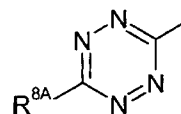
W.57



W.58



W.59



W.60

- 5 wherein the free bond denotes the position of attachment in formula I, wherein the capital letters A, B, C, D and E joined to R⁸ indicate the position of R⁸ at the heteroaromatic ring system and R⁸ is defined as in claim 1.
- 10 4. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein W is selected from formulas W.1, W.2, W.3, W.4, W.5, W.6, W.8, W.9, W.10, W.11, W.12, W.13, W.14, W.15, W.17, W.18, W.19, W.20, W.21, W.22, W.23, W.25, W.26, W.27, W.28, W.29, W.30, W.31, W.32, W.33, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 and W. 54 as defined in claim 3.
- 15 5. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein W is selected from formulas W.1, W.3, W. 25, W.26, W.27, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 and W.54 as defined in claim 3.
- 20 6. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein
R¹, R², R³ are selected from hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₃-C₆-cycloalkyl, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected
25 from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkylthio;

158

7. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^1 , R^2 and R^3 are selected from hydrogen and C_1 - C_6 -alkyl;
8. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^1 , R^2 and R^3 are from hydrogen.
9. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} , R^{4d} are each independently selected from one another from hydrogen, halogen, C_1 - C_6 -alkyl and C_1 - C_6 -haloalkyl
10. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} and R^{4d} are from hydrogen.
11. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^5 , R^6 , R^9 are each independently selected from one another from hydrogen, cyano, nitro, formyl, $C(=O)R^{5c}$, $C(=O)R^{6c}$, $C(=O)R^{9c}$, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkinyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, $(C_1$ - C_6 -alkoxy)methylen, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfenyl or C_1 - C_6 -alkylsulfonyl wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of 1, 2 or 3 radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy and C_1 - C_6 -alkylthio and wherein R^{5c} , R^{6c} and R^{9c} are selected each independently from one another from hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkinyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkoxy, $(C_1$ - C_6 -alkyl)amino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, hydrazino, $(C_1$ - C_6 -alkyl)hydrazino, di(C_1 - C_6 -alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N

159

12. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^5 , R^6 , R^9 are each independently selected from one another from hydrogen, cyano, nitro, formyl, $C(=O)R^{5c}$ or $C(=O)R^{6c}$ or $C(=O)R^{9c}$ and C_1 - C_6 -alkyl and wherein R^{5c} , R^{6c} and R^{9c} are selected each independently from one another from hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_2 - C_6 -aleny, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -alkoxy, (C_1 - C_6 -alkyl)amino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, hydrazino, (C_1 - C_6 -alkyl)hydrazino, di(C_1 - C_6 -alkyl)hydrazino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N
13. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^5 , R^6 and R^9 are selected from hydrogen.
14. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein R^7 , R^8 are both independently from one another selected from halogen, OH, SH, NH_2 , SO_3H , $COOH$, cyano, $CONH_2$, $C(=O)R^{7c}$ or $C(=O)R^{8c}$, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylamino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, wherein the carbon atoms in the aliphatic radicals of the aforementioned groups may carry any combination of one, two or three radicals, independently of one another selected from the group consisting of halogen, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, carboxyl, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_6 -haloalkoxy and C_1 - C_6 -haloalkyl; and wherein R^{7c} , R^{8c} are both selected each independently from one another from hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_8 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, (C_1 - C_6 -alkyl)amino, di(C_1 - C_6 -alkyl)amino, phenyl and heteroaryl, which can be a mono- or bicyclic 5 to 10 membered heteroaromatic ring, which contains 1,2,3 or 4 heteroatoms selected from O,S and N.
15. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein

R^7 , R^8 are both selected each independently from one another from halogen, cyano, C_1 - C_6 -alkyl and C_1 - C_6 -alkoxy, and wherein the radicals may be unsubstituted, partially or fully halogenated.

- 5 16. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein X is sulfur.
17. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein m is 0, 1, 2 or 3.
- 10 18. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein m is 0, 1 or 2.
- 15 19. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein n is 0, 1, 2 or 3.
- 20 20. An 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound according to claim 1, wherein n is 0, 1 or 2.
21. A composition comprising at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or salt thereof and at least one inert liquid and/or solid carrier.
- 25 22. An agricultural or veterinary composition comprising at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or agriculturally or veterinary useful salt thereof and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier and, if desired, at least one surfactant.
- 30 23. A method of using an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer or an agricultural or veterinary acceptable salt thereof for combating animal pests by treating the pests with a pesticidal active amount thereof.
- 35 24. A method of combating animal pests which comprises contacting the animal pests or the environment in which the animal pests live or growing or may live or grow or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from animal attack or infestation with a pesticidal effective amount of at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of
- 40

181

formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer or an agriculturally or veterinary acceptable salt thereof.

- 5 25. A method of combating animal pests according claim 24 which comprises contacting the animal pests, their habit, breeding ground, food supply, plant, seed, soil, area, material or environment in which the animal pests live or grow or may live or grow or the materials, plants, seeds, soils, surfaces or spaces to be protected from animal attack or infestation with a pesticidal effective amount of at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of
- 10 formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer or an agricultural or veterinary acceptable salt thereof.
26. The method as defined in claim 24, wherein the animal pests are insects, arachnids or nematodes.
- 15 27. The method as defined in claim 24, wherein the animal pest are insects like Homoptera, Lepidoptera or Coleoptera or arachnids of the order of Acarina.
- 20 28. A method for protecting crops from attack or infestation by animal pests, which comprises contacting a crop with a pesticidal effective amount of at least one 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer or an agricultural acceptable salt thereof.
- 25 29. A method for the protection of seeds from soil insects and of the seedlings' roots and shoots from insects comprising contacting the seeds before sowing and/or after pregermination with an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an agriculturally acceptable salt thereof, in
- 30 pesticidal effective amounts.
30. The method according claim to 29, wherein the 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound is applied in an amount of from 0,1 g to 10 kg per 100 kg of seeds.
- 35 31. A method according to claim 29 or 30, wherein of the resulting plant's roots and shoots are protected.
- 40 32. A method according to any of claims 29 to 31, wherein the resulting plant's shoots are protected from aphids.

162

33. Seed comprising an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of the formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an agriculturally acceptable salt thereof.
- 5 34. Seed comprising an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of the formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an agriculturally acceptable salt thereof in an amount of from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seed.
- 10 35. A method of using an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compounds of formula I as defined in any one of claim 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer or veterinary acceptable salts thereof, for combating parasites in and on animals by treating the parasites with an parasitical active amount thereof.
- 15 36. A method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites by administering to the animals a parasitically effective amount of an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an veterinary acceptable salt thereof.
- 20 37. A method according to claim 36 which comprises orally, topically or parenterally administering or applying to the animals a parasitically effective amount of an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claims 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an veterinary acceptable salt thereof.
- 25 38. 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 an 1-(Azolin-2-yl)-amino-1-phenyl-2-hetaryl-ethane compound of formula I as defined in any one of claim 1 to 20 or an enantiomer, diastereomer and/or an veterinary acceptable salt thereof.
- 30

Composiciones pesticidas

La presente invención se refiere compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, que son útiles para combatir insectos, arácnidos y nemátodos. La presente
5 invención también se refiere a un método para combatir pestes animales seleccionados entre insectos, arácnidos y nemátodos, y una composición agrícola para combatir pestes animales.

Pestes animales y, especialmente, insectos, arácnidos y nemátodos destruyen plantas
10 de cultivo durante su crecimiento y cosecha y atacan casas residenciales y estructuras comerciales de madera, causando de este modo mayores pérdidas económicas en el campo del suministro de alimentos y a la propiedad. Si bien se conoce un amplio número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de los pestes a desarrollar resistencias a dichos agentes, hay una continua demanda de hallar nuevos agentes
15 para combatir insectos, arácnidos y nemátodos.

Compuestos de azolina se han mencionado para diferentes usos en el estado de la técnica convencional:

20 La JP 63203672 divulga tiazoles como agentes anti-úlceras y sustancias terapéuticas contra enfermedades del hígado.

En la US 2002/0010199 se describen derivados de amidina cíclicas sustituidas como inhibidores de la adhesión celular.

164

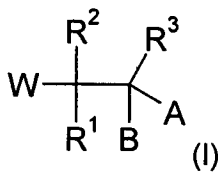
En la GB 2121414 se usan aminas heterocíclicas para fines fungicidas.

Los derivados heterocíclicos de imino divulgados en la WO 95/33717 se usan para el control de pestes.

Y en la WO 2005/063724 se usan compuestos de azolina con diferentes esquemas de
5 sustitución para el control de pestes.

Por tanto, el objeto de la presente invención es proveer compuestos, que presentan una buena actividad pesticida y un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes pestes animales, especialmente, contra insectos, arácnidos y
10 nemátodos difíciles de controlar.

Se ha encontrado, que estos objetivos se pueden alcanzar con los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula general I:



15

en donde

R¹, R², R³ son seleccionados entre hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo,
20 C₃-C₆ cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-

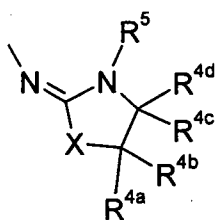
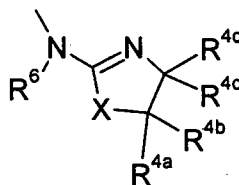
165

alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

fenilo o bencilo, cada uno sustituido o no sustituido con cualquier combinación de uno a cinco grupos de halógeno, uno a tres grupos C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi;

5 si A corresponde a A² y R³ es hidrógeno, entonces R¹ y R² son seleccionados, preferentemente dependientemente entre si, en forma no idéntica a la combinación de R³ y B.

10 A es un radical de las fórmulas A¹ o A²:

A¹A²

en donde

15 X es azufre o oxígeno;

R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d}son seleccionados, independientemente entre si, de:

hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquilamino,

C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los

20 radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier

combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados,

independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano,

166

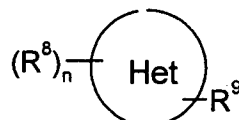
nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

- 5 R⁵, R⁶, R⁹ son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{5c} o C(=O)R^{6c} o C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alcoxi)metileno, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos
- 10 de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de 1, 2 ó 3 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;
- 15 C(O)NR^{5a}R^{5b} o C(O)NR^{6a}R^{6b} o C(O)NR^{9a}R^{9b}, (SO₂)NR^{5a}R^{5b} o (SO₂)NR^{6a}R^{6b} o (SO₂)NR^{9a}R^{9b}, fenilo, feniloxi o bencilo, pudiendo cada uno de los tres últimos radicales mencionados ser no sustituidos o sustituidos con 1 a 5 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende:
- 20 uno a cinco radicales halógeno, uno a tres C₁-C₆-alquilo, uno a tres C₁-C₆-haloalquilo, uno a tres radicales C₁-C₆-alquiltio, uno a tres C₁-C₆-haloalquiltio, uno a tres radicales C₁-C₆-alcoxi y uno a tres radicales C₁-C₆-haloalcoxi;
- 25 y en donde R^{5a}, R^{6a}, R^{9a}, R^{5b}, R^{6b}, R^{9b}, R^{5c}, R^{6c} y R^{9c} tienen las definiciones abajo indicadas

167

B es un sistema de anillo fenilo opcionalmente sustituido

W es un anillo heteroaromático de cinco a seis miembros, que puede
contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados entre oxígeno, nitrógeno y
azufre,
en donde el anillo heteroaromático puede estar condensado,
opcionalmente, con un anillo seleccionado entre fenilo y un anillo
heterocíclico aromático saturado, parcialmente insaturado de 5 a 6
miembros que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre
oxígeno, nitrógeno y azufre,
y en donde el anillo heteroaromático de cinco a seis miembros o los
respectivos sistemas de anillo condensados pueden ser no sustituidos
u, opcionalmente, estar sustituidos por R^9 y/o cualquier combinación de
1 a 4 grupos R^8 :



en donde n es 0, 1, 2, 3, ó 4;

y R^8 tiene las definiciones abajo indicadas;

y R^9 tiene las definiciones arriba indicadas

y en donde

R^8 es seleccionado entre halógeno, OH, SH, NH_2 , SO_3H , COOH, ciano,
azido, nitro, formilo, $CONH_2$, $CSNH_2$, $CH=N-OH$, $CH=N-O-(C_1-C_6)$ -alquilo,

- 5 C(=O)R^{8c}, C(=S)R^{8c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquilamino, C₂-C₆-alquenilamino, C₂-C₆-alquinilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, di(C₂-C₆-alquenil)amino, di(C₂-C₆-alquinil)amino, C₁-C₆-alquiltio, C₂-C₆-alqueniltio, C₂-C₆-alquiniltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₂-C₆-alquenilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilsulfonilo, (C₁-C₆-alquil)carbonilo, (C₂-C₆-alquenil)-carbonilo, (C₂-C₆-alquinil)-carbonilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₂-C₆-alqueniloxi)carbonilo, (C₂-C₆-alquiniloxi)-carbonilo, (C₁-C₆-alquil)carboniloxi, (C₂-C₆-alquenil)-carbonil-oxi, (C₂-C₆-alquinil)carboniloxi, (C₁-C₆-alquil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquenil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquinil)carbonil-amino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;
- 10 C(O)NR^{8a}R^{8b}, (SO₂)NR^{8a}R^{8b}; en donde R^{8a}, R^{8b} y R^{8c} tienen las definiciones abajo indicadas,
- 15 un radical Y-Ar o un radical Y-Cy, en donde
- 20 Y es un enlace simple, O, S, NH, C₁-C₆-alcanodiilo o C₁-C₆-alcanodiiloxi; Ar es fenilo, naftilo o un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de
- 25 nitrógeno como miembros de anillo, en donde Ar no lleva sustituyente o

puede llevar cualquier combinación de uno a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

Cy es C₃-C₁₂-cicloalquilo, que es no sustituido o sustituido con uno a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

y en donde

R^{5a}, R^{6a}, R^{8a} y R^{5b}, R^{6b}, R^{8b}

son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alqueno, o C₂-C₆-alquino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquinoxilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

y R^{5c}, R^{6c}, R^{8c} y R^{9c}

son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-

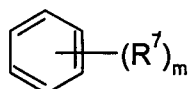
alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O, S y N

5

o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos.

Son preferidos los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde B es seleccionado entre:

10



y en donde

15 m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

y R⁷ es seleccionado entre halógeno, OH, SH, NH₂, SO₃H, COOH, ciano, azido, nitro, formilo, CONH₂, CSNH₂, CH=N-OH, CH=N-O-(C₁-C₆)-alquilo, C(=O)R^{7c}, C(=S)R^{7c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquilamino, C₂-C₆-alquenilamino, C₂-C₆-alquinilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, di(C₂-C₆-alquenil)amino, di(C₂-C₆-alquinil)amino, C₁-C₆-alquiltio, C₂-C₆-alqueniltio, C₂-C₆-alquiniltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₂-C₆-alquenilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilsulfonilo, (C₁-C₆-alquil)carbonilo, (C₂-C₆-alquenil)-carbonilo, (C₂-C₆-alquinil)-carbonilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₂-C₆-alqueniloxi)carbonilo, (C₂-C₆-alquiniloxi)-carbonilo, (C₁-C₆-alquil)carboniloxi, (C₂-C₆-alquenil-)carbonil-oxi, (C₂-C₆-

25

171

alquinil)carboniloxi, (C₁-C₆-alquil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquenil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquinil)carbonil-amino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende:

- 5 halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio; C(O)NR^{7a}R^{7b} o (SO₂)NR^{7a}R^{7b}; en donde R^{7a}, R^{7b} y R^{7c} tienen las definiciones abajo indicadas, un radical Y-Ar o un radical Y-Cy, en donde
- 10 Y es un enlace simple, O, S, NH, C₁-C₆-alcanodiilo o C₁-C₆-alcanodiiloxi;
- Ar es fenilo, naftilo o un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, en donde Ar no lleva sustituyente o puede llevar cualquier
- 15 combinación de uno a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;
- Cy es C₃-C₁₂-cicloalquilo, que es no sustituido o sustituido con uno a cinco
- 20 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

172

y en donde el radical R^7 que es ligado a átomos de carbono vecinos de los anillos fenilo puede formar, opcionalmente, conjuntamente con dichos átomos de carbono, un anillo benceno condensado, un carbociclo condensado, saturado o parcialmente insaturado de 5, 6, ó 7 miembros o un heterociclo condensado de 5, 6 ó 7 miembros, que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, y en donde el anillo condensado no lleva sustituyente o puede llevar 1, 2, 3 ó 4 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_2-C_6 -alqueniloxi, C_2-C_6 -alquiniloxi, C_1-C_6 -haloalcoxi y C_1-C_6 -alquiltio;

y en donde R^{7a} y R^{7b} son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo, C_2-C_6 -alquenilo, o C_2-C_6 -alquinilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_2-C_6 -alqueniloxi, C_2-C_6 -alquiniloxi, C_1-C_6 -haloalcoxi, C_1-C_6 -haloalquilo y C_1-C_6 -alquiltio;

20

y en donde R^{7c} son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 -alcoxi, $(C_1-C_6$ -alquil)amino, $di(C_1-C_6$ -alquil)amino, hidracino, $(C_1-C_6$ -alquil)hidracino, $di(C_1-C_6$ -alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o

bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O,S y N.

- Por tanto, la presente invención se refiere a compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula general I y a las sales aceptables en la agricultura de los mismos. Estos compuestos tienen una alta actividad pesticida y son activos contra un amplio espectro de plagas animales seleccionados entre insectos, arácnidos y nemátodos.
- 10 De manera, que la invención se refiere también a un método para combatir plagas animales, seleccionados entre insectos, arácnidos y nemátodos, que comprende contactar las plagas animales, su habitat, áreas de cría, suministro de comida, planta, semillas, suelos, áreas, materiales o el medio ambiente donde las plagas animales crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o
- 15 espacios a ser protegidos frente al ataque o la infestación por insectos, arácnidos o nemátodos con una cantidad efectiva pesticida de por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula general I de la fórmula general I y/o por lo menos una sal aceptable en la agricultura del mismo.
- 20 Además, la presente invención provee un método para proteger cultivos frente al ataque o la infestación por insectos, arácnidos o nemátodos, que comprende contactar un cultivo con una cantidad pesticida efectiva de un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula general I y/o por lo menos una sal del mismo.

174

Adicionalmente, la invención se refiere a una composición agrícola, preferentemente, en forma de soluciones, emulsiones, pastas, dispersiones de aceite, polvos directamente pulverizables, agentes de rociado, polvos, o en forma de granulados, que comprenden por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano
5 de la fórmula general I tal y como se define arriba, o una sal del mismo, en mezcla con uno o más soporte(s) inertes sólidos o líquidos, aceptales en la agricultura y, si se desea, por lo menos un surfactante.

Los compuestos de la fórmula I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo
10 caso están presentes como mezclas de estereoisómeros, tales como enantiómeros o diastereómeros. La presente invención provee tanto los estereoisómeros puros, es decir, los enantiómeros o diastereómeros puros, y mezclas de los mismos. Los compuestos de la fórmula I pueden existir también en forma de diferentes tautómeros. La invención comprende los tautómeros individuales, si son separables, también las
15 mezclas tautómeras.

Sales de compuestos de la fórmula I, que son apropiadas para ser usadas según la invención son, especialmente, las sales aceptables en la agricultura. Pueden generarse de manera habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar los compuestos con
20 un ácido o el anión en cuestión si el compuesto de la fórmula I tiene una funcionalidad básica, o haciendo reaccionar un compuesto ácido de la fórmula I con una base apropiada.

Sales útiles en la agricultura apropiadas son, especialmente, las sales de aquellos
25 cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos, cuyos cationes y aniones,

- respectivamente, no tienen un efecto perjudicial sobre la acción de los compuestos según la presente invención. Cationes apropiados son, especialmente, los iones de metales alcalinos, preferentemente, litio, sodio y potasio, de metales alcalinotérreos, preferentemente, calcio, magnesio y bario, y de metales transitorios, preferentemente, manganeso, cobre, cinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en donde uno o cuatro átomos de hidrógeno están sustituidos por $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -hidroxialquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, hidroxí- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones amonio sustituidos son: metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etilamonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltrietilamonio, además iones fosfonio, iones sulfonio, preferentemente, tri($\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfonio, e iones sulfoxonio, preferentemente, tri($\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfoxonio.
- 15 Aniones útiles de sales de adición ácidas son, primordialmente, cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogensulfato, sulfato, dihidrogenfosfato, hidrogenfosfato, fosfato, nitrato, hidrogencarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanoicos $\text{C}_1\text{-C}_4$, preferentemente, formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden ser preparados, haciendo reaccionar los compuestos de las fórmulas
- 20 la y lb con un ácido del correspondiente anión, preferentemente, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Las partes orgánicas mencionadas en las definiciones de arriba de las variables, como p.ej. el término "halógeno", son términos colectivos representativos de la relación

780

individual de los diferentes miembros de grupo. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el posible número de átomos de carbono del grupo.

El término halógeno significa en cada caso flúor, cloro, bromo e yodo, especialmente,
5 flúor, cloro o bromo.

Ejemplos de otros significados son:

El término " C_1-C_6 -alquilo" como se usa en la presente y en la partes de alquilo de C_1-
10 C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -alquilamino, di(C_1-C_6 -alquil)amino, C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 -
alquilsulfonilo, C_1-C_6 -alquilsulfoxilo, C_1-C_6 -alquilcarbonilo, C_1-C_6 -alcoxycarbonilo, C_1-C_6 -
alquiltiocarbonilo, y C_1-C_6 -alquilcarboniloxi se refieren a un grupo hidrocarburo
saturado lineal o ramificado, que tiene 1 a 6 átomos de carbono, especialmente, 1 a 4
grupos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo,
15 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-
dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo,
2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-
dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo,
1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo,
20 heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. C_1-C_4 -alquil significa, por
ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo ó 1,1-
dimetiletilo.

El término " C_1-C_6 -haloalquilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo
25 saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona

177

arriba), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar reemplazados por átomos de halógeno tal y como se menciona arriba, por ejemplo, C₁-C₄-haloalquilo, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, 5 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, pentafluoroetilo, etc.

El término, "C₁-C₆-alcoxi" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo 10 saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de oxígeno. Ejemplos incluyen C₁-C₆-alcoxi, tales como metoxi, etoxi, OCH₂-C₂H₅, OCH(CH₃)₂, n-butoxi, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂, OC(CH₃)₃, n-pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetil-propoxi, 1-etilpropoxi, n-hexoxi, 15 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi, 1-etil-2-metilpropoxi, etc.

20 El término "C₁-C₆-haloalcoxi" como se usa en la presente se refiere un grupo C₁-C₆-alcoxi tal y como se menciona arriba, donde los átomos de hidrógeno están parcial o completamente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo, a saber, por ejemplo, C₁-C₆-haloalcoxi, tales como clorometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, 25 clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-

- difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxi, heptafluoropropoxi, 1-(fluorometil)-2-fluoroetoxi, 1-(clorometil)-2-cloroetoxi, 1-(bromometil)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi, nonafluorobutoxi, 5-fluoro-1-pentoxi, 5-cloro-1-pentoxi, 5-bromo-1-pentoxi, 5-yodo-1-pentoxi, 5,5,5-tricloro-1-pentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluoro-1-hexoxi, 6-cloro-1-hexoxi, 6-bromo-1-hexoxi, 6-yodo-1-hexoxi, 6,6,6-tricloro-1-hexoxi o dodecafluorohexoxi, especialmente, clorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi ó 2,2,2-trifluoroetoxi.

- El término "C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo" como se usa en la presente se refiere a C₁-C₆-alquilo, donde 1 átomo de carbono lleva un radical C₁-C₆-alcoxi tal y como se menciona arriba. Ejemplos son: CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-propoximetilo, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)metilo, (2-metilpropoxi)metilo, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)etilo, 2-(1-metiletoxi)etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-(1-metilpropoxi)etilo, 2-(2-metilpropoxi)etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)etilo, 2-(metoxi)propilo, 2-(etoxi)propilo, 2-(n-propoxi)propilo, 2-(1-metiletoxi)propilo, 2-(n-butoxi)propilo, 2-(1-metilpropoxi)propilo, 2-(2-metilpropoxi)propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 3-(metoxi)propilo, 3-(etoxi)propilo, 3-(n-propoxi)propilo, 3-(1-metiletoxi)propilo, 3-(n-butoxi)propilo, 3-(1-metilpropoxi)propilo, 3-(2-metilpropoxi)propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 2-(metoxi)butilo, 2-(etoxi)butilo, 2-(n-propoxi)butilo, 2-(1-metiletoxi)butilo, 2-(n-butoxi)butilo, 2-(1-metilpropoxi)butilo, 2-(2-metilpropoxi)butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 3-(metoxi)butilo, 3-(etoxi)butilo, 3-(n-

179

propoxi)butilo, 3-(1-metiletoxi)butilo, 3-(n-butoxi)butilo, 3-(1-metilpropoxi)butilo, 3-(2-metilpropoxi)butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 4-(metoxi)butilo, 4-(etoxi)butilo, 4-(n-propoxi)butilo, 4-(1-metiletoxi)butilo, 4-(n-butoxi)butilo, 4-(1-metilpropoxi)butilo, 4-(2-metilpropoxi)butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)butilo, etc.

5

El término "(C₁-C₆-alquil)carbonilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba) enlazado por medio del átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen C₁-C₆-alquilcarbonil, como p.ej.

- 10 CO-CH₃, CO-C₂H₅, n-propilcarbonilo, 1-metiletilcarbonilo, n-butilcarbonilo, 1-metilpropilcarbonilo, 2-metilpropilcarbonilo, 1,1-dimetiletilcarbonilo, n-pentilcarbonilo, 1-metilbutilcarbonilo, 2-metilbutilcarbonilo, 3-metilbutilcarbonilo, 1,1-dimetilpropilcarbonilo, 1,2-dimetilpropilcarbonilo, 2,2-dimetilpropilcarbonilo, 1-etilpropilcarbonilo, n-hexilcarbonilo, 1-metilpentilcarbonilo, 2-metilpentilcarbonilo, 3-metilpentilcarbonilo, 4-metilpentilcarbonilo, 1,1-dimetilbutilcarbonilo, 1,2-dimetilbutilcarbonilo, 1,3-dimetilbutilcarbonilo, 2,2-dimetilbutilcarbonilo, 2,3-dimetilbutilcarbonilo, 3,3-dimetilbutilcarbonilo, 1-etilbutilcarbonilo, 2-etilbutilcarbonilo, 1,1,2-trimetilpropilcarbonilo, 1,2,2-trimetilpropilcarbonilo, 1-etil-1-metilpropilcarbonilo óo 1-etil-2-metilpropilcarbonilo, etc.

20

El término "(C₁-C₆-alcoxi)carbonilo" como se usa en la presente se refiere un grupo alcoxi lineal o ramificado (tal y como se menciona arriba), que tiene 1 a 6 átomos de carbono ligado por medio del átomo de carbono del grupo carbonilo, por ejemplo, CO-OCH₃, CO-OC₂H₅, COO-CH₂-C₂H₅, CO-OCH(CH₃)₂, n-butoxicarbonilo, CO-OCH(CH₃)-

- 25 C₂H₅, CO-OCH₂-CH(CH₃)₂, CO-OC(CH₃)₃, n-pentoxicarbonilo, 1-metilbutoxicarbonilo,

2-metilbutoxicarbonilo, 3-metilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilpropoxycarbonilo, 1-etilpropoxycarbonilo, n-hexoxycarbonilo, 1,1-dimetilpropoxycarbonilo, 1,2-dimetilpropoxycarbonilo, 1-metilpentoxycarbonilo, 2-metilpentoxycarbonilo, 3-metilpentoxycarbonilo, 4-metilpentoxycarbonilo, 1,1-dimetilbutoxicarbonilo, 1,2-dimetilbutoxicarbonilo, 1,3-dimetilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilbutoxicarbonilo, 2,3-dimetilbutoxicarbonilo, 3,3-dimetilbutoxicarbonilo, 1-etilbutoxicarbonilo, 2-etilbutoxicarbonilo, 1,1,2-trimetilpropoxycarbonilo, 1,2,2-trimetilpropoxycarbonilo, 1-etil-1-metilpropoxycarbonilo ó 1-etil-2-metilpropoxycarbonilo.

- 10 El término "(C₁-C₆-alquil)carboniloxi" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba) ligado por medio del átomo de carbono del grupo carboniloxi en cualquier enlace en el grupo alquilo, por ejemplo, O-CO-CH₃, O-CO-C₂H₅, n-propilcarboniloxi, 1-metiletilcarboniloxi, n-butilcarboniloxi, 1-metilpropilcarboniloxi, 2-metilpropilcarboniloxi, 1,1-dimetiletilcarboniloxi, n-pentilcarboniloxi, 1-metilbutilcarboniloxi, 2-metilbutilcarboniloxi, 3-metilbutilcarboniloxi, 1,1-dimetilpropilcarboniloxi ó 1,2-dimetilpropilcarboniloxi.

- El término "C₁-C₆-alquiltio (C₁-C₆-alquilsulfanilo: C₁-C₆-alquil-S-)" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de azufre, por ejemplo, C₁-C₄-alquiltio, tales como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetileltio, n-pentiltiocarbonilo, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, n-hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio,

4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio ó 1-etil-2-metilpropiltio.

- 5 El término "C₁-C₆-alquiltiocarbonilo" como se usa en la presente se refiere a lineal o ramificado alktio group (tal y como se menciona arriba), que tiene 1 a 6 átomos de carbono ligado por medio del átomo de carbono del grupo carbonilo. Ejemplos incluyen CO-SCH₃, CO-SC₂H₅, CO-SCH₂-C₂H₅, CO-SCH(CH₃)₂, n-butiltiocarbonilo, CO-SCH(CH₃)-C₂H₅, CO-SCH₂-CH(CH₃)₂, CO-SC(CH₃)₃, n-pentiltiocarbonilo, 1-
- 10 metilbutiltiocarbonilo, 2-metilbutiltiocarbonilo, 3-metilbutiltiocarbonilo, 2,2-dimetilpropiltiocarbonilo, 1-etilpropiltiocarbonilo, n-hexiltiocarbonilo, 1,1-dimetilpropiltiocarbonilo, 1,2-dimetilpropiltiocarbonilo, 1-metilpentiltiocarbonilo, 2-metilpentiltiocarbonilo, 3-metilpentiltiocarbonilo, 4-metilpentiltiocarbonilo, 1,1-dimetilbutiltiocarbonilo, 1,2-dimetilbutiltiocarbonilo, 1,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 2,2-
- 15 dimetilbutiltiocarbonilo, 2,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 3,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 1-etilbutltioycarbonilo, 2-etilbutiltiocarbonilo, 1,1,2-trimetilpropiltiocarbonilo, 1,2,2-trimetilpropiltiocarbonilo, 1-etil-1-metilpropiltiocarbonilo ó 1-etil-2-metilpropiltiocarbonilo.

- El término "C₁-C₆-alquilsulfinilo" (C₁-C₆-alquilsulfoxilo: C₁-C₆-alquil-S(=O)-), como se
- 20 usa en la presente se refiere un grupo hidrocarburo saturado lineal o ramificado (tal y como se menciona arriba), que tiene 1 a 6 átomos de carbono enlazado por medio del átomo de azufre del grupo sulfinilo en cualquier enlace en el grupo alquilo, por ejemplo, SO-CH₃, SO-C₂H₅, n-propilsulfinilo, 1-metiletilsulfinilo, n-butilsulfinilo, 1-metilpropilsulfinilo, 2-metilpropilsulfinilo, 1,1-dimetiletilsulfinilo, n-pentilsulfinilo, 1-
- 25 metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-

dimetilpropilsulfinilo, 2,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-etilpropilsulfinilo, n-hexilsulfinilo, 1-metilpentilsulfinilo, 2-metilpentilsulfinilo, 3-metilpentilsulfinilo, 4-metilpentilsulfinilo, 1,1-dimetilbutilsulfinilo, 1,2-dimetilbutilsulfinilo, 1,3-dimetilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilbutilsulfinilo, 2,3-dimetilbutilsulfinilo, 3,3-dimetilbutilsulfinilo, 1-etilbutilsulfinilo, 2-etilbutilsulfinilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfinilo, 1-etil-1-metilpropilsulfinilo ó 1-etil-2-metilpropilsulfinilo.

El término "C₁-C₆-alquilamino" se refiere a un grupo amino secundario, que lleva un grupo alquilo, como los arriba definidos, p.ej. metilamino, etilamino, propilamino, 1-metiletilamino, butilamino, 1-metilpropilamino, 2-metilpropilamino, 1,1-dimetiletilamino, pentilamino, 1-metilbutilamino, 2-metilbutilamino, 3-metilbutilamino, 2,2-dimetilpropilamino, 1-etilpropilamino, hexilamino, 1,1-dimetilpropilamino, 1,2-dimetilpropilamino, 1-metilpentilamino, 2-metilpentilamino, 3-metilpentilamino, 4-metilpentilamino, 1,1-dimetilbutilamino, 1,2-dimetilbutilamino, 1,3-dimetilbutilamino, 2,2-dimetilbutilamino, 2,3-dimetilbutilamino, 3,3-dimetilbutilamino, 1-etilbutilamino, 2-etilbutilamino, 1,1,2-trimetilpropilamino, 1,2,2-trimetilpropilamino, 1-etil-1-metilpropilamino ó 1-etil-2-metilpropilamino.

El término "di(C₁-C₆-alquil)amino" se refiere a un grupo amino terciario, que lleva dos radicales alquilo, como los arriba definidos, p.ej. dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, diisopropilamino, N-etil-N-metilamino, N-(n-propil)-N-metilamino, N-(isopropil)-N-metilamino, N-(n-butil)-N-metilamino, N-(n-pentil)-N-metilamino, N-(2-butil)-N-metilamino, N-(isobutil)-N-metilamino, N-(n-pentil)-N-metilamino, N-(n-propil)-N-etilamino, N-(isopropil)-N-etilamino, N-(n-butil)-N-etilamino, N-(n-pentil)-N-etilamino, N-(2-butil)-N-etilamino, N-(isobutil)-N-etilamino o N-(n-pentil)-N-etilamino.

- El término "C₁-C₆-alquilsulfonilo" (C₁-C₆-alquil-S(=O)₂-) como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado lineal o ramificado con 1 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es ligado por medio del átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier enlace en el grupo alquilo, por ejemplo, SO₂-CH₃, SO₂-C₂H₅, n-propilsulfonilo, SO₂-CH(CH₃)₂, n-butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, SO₂-C(CH₃)₃, n-pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo ó 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.
- El término "C₂-C₆-alquenilo" como se usa en la presente y en la partes de alquenilo de C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquenilamino, C₂-C₆-alqueniltio, C₂-C₆-alquenilsulfonilo, (C₂-C₆-alquenil)carbonilo, (C₂-C₆-alqueniloxi)carbonilo y (C₂-C₆-alquenil)carboniloxi se refiere a un grupo hidrocarburo no saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo; 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-

184

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, "C₂-C₆-alqueniloxi" como se usa en la presente se refiere un grupo alquenilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de oxígeno, tales como viniloxi, aliloxi (propen-3-iloxi), metalliloxi, buten-4-iloxi, etc.

El término "C₂-C₆-alqueniltio" como se usa en la presente se refiere un grupo alquenilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de azufre, por ejemplo, vinilsulfanilo, alilsulfanilo (propen-3-iltio), metalilsufanilo, buten-4-ilsulfanilo, etc.

El término "C₂-C₆-alquenilamino" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquenilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como

[85]

se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de azufre, por ejemplo, vinilamino, alilamino (propen-3-ilamino), metalilamino, buten-4-ilamino, etc.

El término "C₂-C₆-alquenilsulfonilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquenilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 to 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un grupo sulfonilo (SO₂), por ejemplo, vinilsulfonilo, alilsulfonil (propen-3-ilsulfonilo), metalilsufonilo, buten-4-ilsulfonilo, etc.

10 El término "C₂-C₆-alquinilo" como se usa en la presente y en la partes de alquinilo de C₂-C₆-alquiniloxi, C₂-C₆-alquinilamino, C₂-C₆-alquiniltio, C₂-C₆-alquinilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilcarbonilo, C₂-C₆-alquiniloxicarbonilo y C₁-C₆-alquinilcarboniloxi se refiere a un grupo hidrocarburo no saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 10 átomos de carbono y que contiene por lo menos un triple enlace, tales como etinilo, prop-1-in-1-ilo, prop-2-in-1-ilo, n-but-1-in-1-ilo, n-but-1-in-3-ilo, n-but-1-in-4-ilo, n-but-2-in-1-ilo, n-pent-1-in-1-ilo, n-pent-1-in-3-ilo, n-pent-1-in-4-ilo, n-pent-1-in-5-ilo, n-pent-2-in-1-ilo, n-pent-2-in-4-ilo, n-pent-2-in-5-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 3-metilbut-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-1-ilo, n-hex-1-in-3-ilo, n-hex-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-5-ilo, n-hex-1-in-6-ilo, n-hex-2-in-1-ilo, n-hex-2-in-4-ilo, n-hex-2-in-5-ilo, n-hex-2-in-6-ilo, n-hex-3-in-1-ilo, n-hex-3-in-2-ilo, 3-metilpent-1-in-1-ilo, 3-metilpent-1-in-3-ilo, 3-metilpent-1-in-4-ilo, 3-metilpent-1-in-5-ilo, 4-metilpent-1-in-1-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo ó 4-metilpent-2-in-5-ilo, etc.

El término, "C₂-C₆-alquiniloxi" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquinilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como

se menciona arriba) que es enlazado por medio de un átomo de oxígeno, tales como propargiloxi (propin-3-iloxi), butin-3-iloxi y butin-4-iloxi.

El término "C₂-C₆-alquiniltio" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquinilo
5 saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de azufre, tales como propargilsulfanilo (propin-3-iltio), butin-3-ilsufanilo y butin-4-ilsulfanilo.

El término "C₂-C₆-alquinilamino" como se usa en la presente se refiere a un grupo
10 alquinilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un átomo de azufre, tales como propargilamino (propin-3-ilamino), butin-3-amino, y butin-4-ilamino.

El término "C₂-C₆-alquinilsulfonilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo
15 alquinilo saturado lineal o ramificado, que tiene 2 a 6 átomos de carbono (tal y como se menciona arriba), que es enlazado por medio de un grupo sulfonilo (SO₂), tales como propargilsulfonilo (propin-3-ilsulfonil), butin-3-ilsufonilo y butin-4-ilsulfonilo.

El término "C₃-C₁₂-cicloalquilo" como se usa en la presente se refiere a un radical
20 hidrocarburo mono- o bi- o policíclico, que tiene 3 a 12 átomos de carbono, especialmente, 3 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de radicales monocíclicos son: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclonoilo y ciclodecilo. Ejemplos de radicales bicíclicos son: biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo y biciclo[3.2.1]nonilo. Ejemplos de radicales
25 tricíclicos son: adamantilo y homoadamantilo.

187

El término "anillo heteroaromático mono- o bicíclico " como se usa en la presente se refiere a un radical heteroaromático monocíclico, que tiene 5 ó 6 miembros de anillo,, que puede comprender un anillo condensado de 5, 6 ó 7 miembros, que tiene un número total de miembros de anillo de 8 a 10, donde 1, 2, 3 ó 4 de estos miembros de anillo son heteroátomos seleccionados, cada uno independientemente del otro, del grupo, que abarca: oxígeno, nitrógeno y azufre. El radical heterocíclico puede estar enlazado con el resto de la molécula por medio de un miembro anular de carbono o por medio de un miembro anular de nitrógeno. El anillo condensado comprende: C₅-C₇-cicloalquilo, C₅-C₇-cicloalquenilo, o heterociclilo de 5 a 7 miembros y fenilo.

10

Ejemplos de anillos heteroaromáticos monocíclicos de 5 a 6 miembros incluyen triacinilo, piracinilo, pirimidilo, piridacinilo, piridilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, tiazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, isotiazolilo y isoxazolilo.

15

Ejemplos de un anillos heteroaromáticos de 5 a 6 miembros, que llevan un anillo fenilo condensado son: quinolinilo, isoquinolinilo, indolilo, indolizinilo, isoindolilo, indazolilo, benzofurilo, benztienilo, benzo[b]tiazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, y benzimidazolilo. Ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 a 6 miembros, que llevan un anillo cicloalquenilo condensado son: dihidroindolilo, dihidroindolizinilo, dihidroisoindolilo, dihidroquinolinilo, dihidroisoquinolinilo, cromenilo, cromanilo, etc.

20

El término "heterociclilo de 5 a 7 miembros" abarca anillos heteroaromáticos monocíclicos, como los arriba definidos y anillos heterocíclicos no aromáticos, saturados o parcialmente insaturados, que tienen 5, 6 ó 7 miembros de anillo.

25

188

- Ejemplos de anillos no aromáticos son: pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihidrothienilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatiolanilo, piperidinilo,
- 5 piperacinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, tiopiranilo, dihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiacinilo, etc.

- En cuanto a la actividad pesticida de los compuestos de la fórmula I, se prefieren aquellos compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, en
- 10 los que las variables – cada una independientemente de la otra o en cualquier combinación entre si o con otras variables – tienen los siguientes significados:

- Se prefieren los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde R¹, R² y R³ son seleccionados entre hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-
- 15 cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-
- 20 haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

Si A corresponde a A² y R³ es hidrógeno, entonces R¹ y R² son seleccionados, preferentemente dependientemente entre si, en forma no idéntica a la combinación de R³ y B.

189

Son aún más preferidos los compuestos de (azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde R¹, R² y R³ son seleccionados entre hidrógeno y C₁-C₆-alquilo, especialmente, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butyl y iso-butilo.

- 5 Se prefieren, sobre todo, los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde R¹, R² y R³ son seleccionados de hidrógeno.

- Se prefieren los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d} son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo.
- 10

Se prefieren aún más los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} son seleccionados de hidrógeno.

15

- Se prefieren los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R⁵, R⁶, R⁹ son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{5c}, C(=O)R^{6c}, C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, (C₁-C₆-alcoxi)metilen, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de 1, 2 ó 3 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio y en donde R^{5c}, R^{6c} y R^{9c} son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C₁-C₆
- 20
- 25

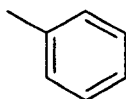
1490

- alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados
- 5 entre O,S y N.

- Se prefieren aún más los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R⁵, R⁶, R⁹ son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{5c} o C(=O)R^{6c} o C(=O)R^{9c} y C₁-C₆-
- 10 alquilo y en donde R^{5c}, R^{6c} y R^{9c} son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆-alenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4
- 15 heteroátomos seleccionados entre O,S y N.

Se prefieren los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I en donde B es seleccionado entre:

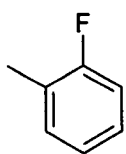
- 20 a) fenilo:



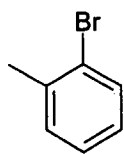
B.0

191

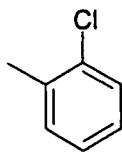
b) radicales fenilo monosustituídos:



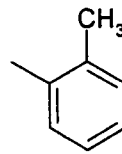
B.1



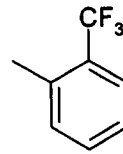
B.2



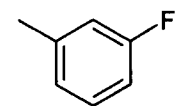
B.3



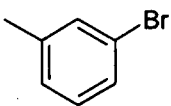
B.4



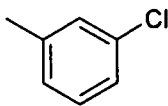
B.5



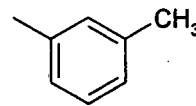
B.6



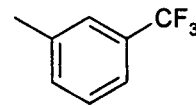
B.7



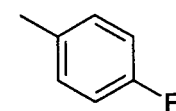
B.8



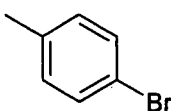
B.9



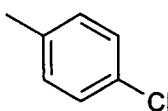
B.10



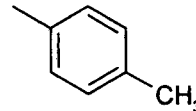
B.11



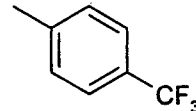
B.12



B.13

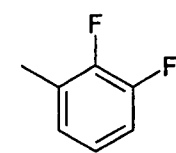


B.14

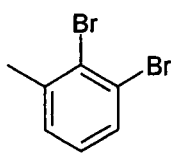


B.15

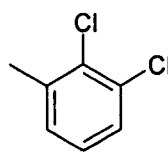
c) radicales fenilo disustituídos:



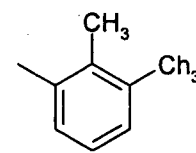
B.16



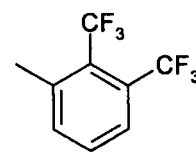
B.17



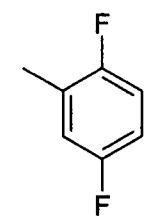
B.18



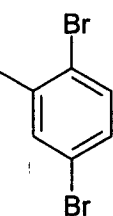
B.19



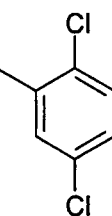
B.20



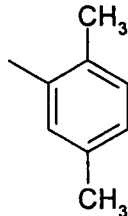
B.21



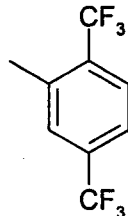
B.22



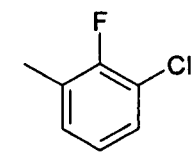
B.23



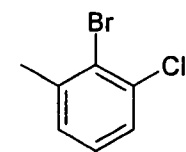
B.24



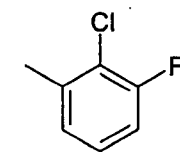
B.25



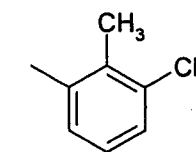
B.26



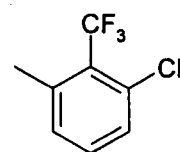
B.27



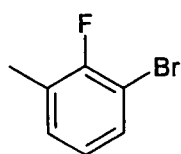
B.28



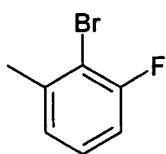
B.29



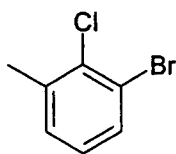
B.30



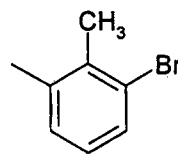
B.31



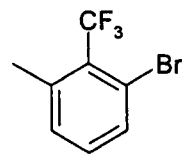
B.32



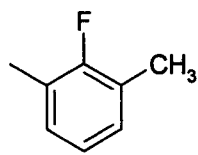
B.33



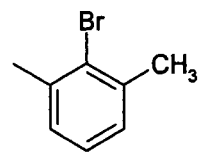
B.34



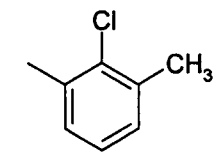
B.35



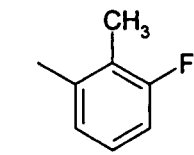
5 B.36



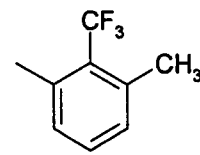
B.37



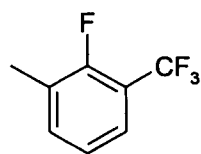
B.38



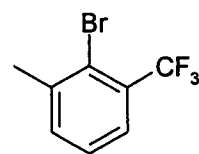
B.39



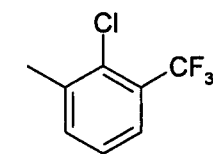
B.40



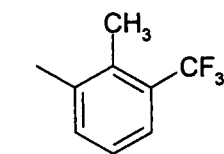
B.41



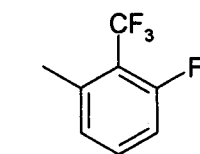
B.42



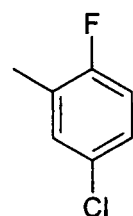
B.43



B.44

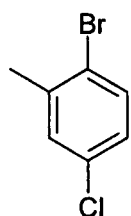


B.45

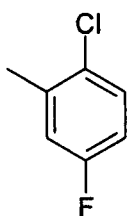


10

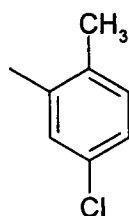
B.46



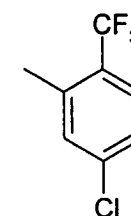
B.47



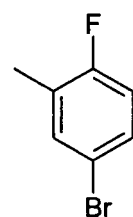
B.48



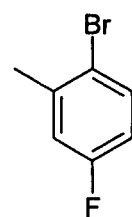
B.49



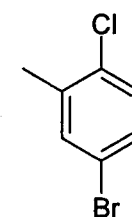
B.50



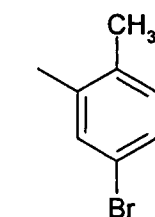
B.51



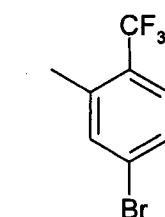
B.52



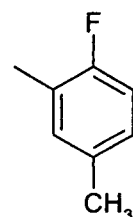
B.53



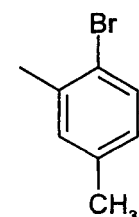
B.54



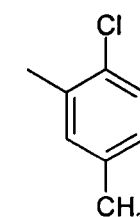
B.55



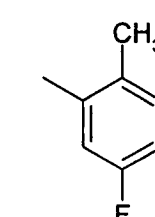
B.56



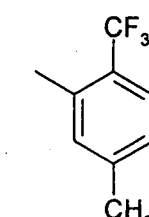
B.57



B.58



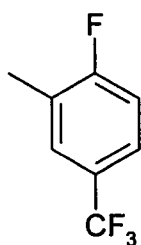
B.59



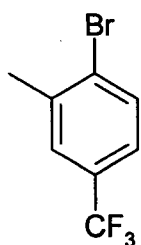
B.60

15

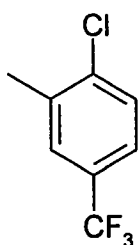
31



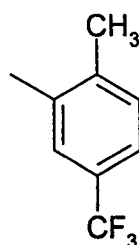
B.61



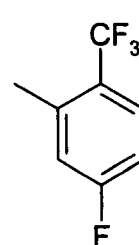
B.62



B.63



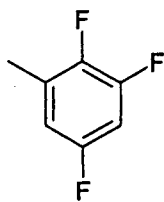
B.64



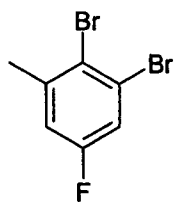
B.65

d) y radicales fenilo trisustituídos:

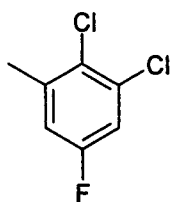
5



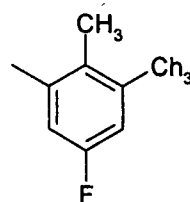
B.66



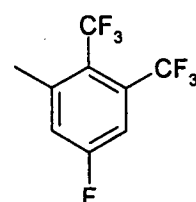
B.67



B.68

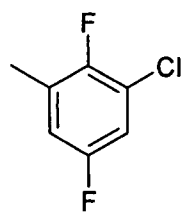


B.69

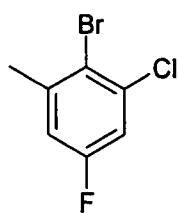


B.70

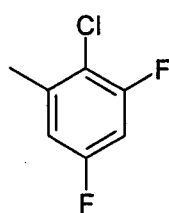
10



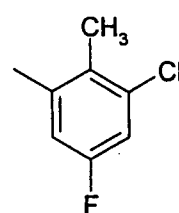
B.71



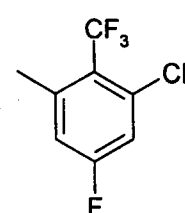
B.72



B.73

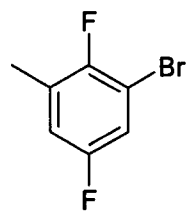


B.74

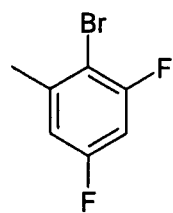


B.75

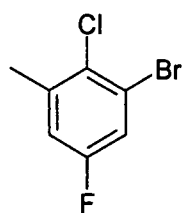
15



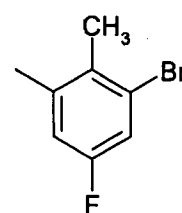
B.76



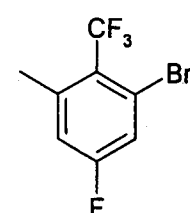
B.77



B.78

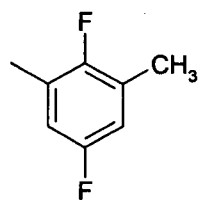


B.79

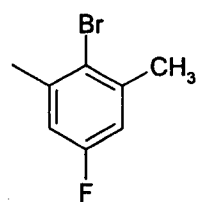


B.80

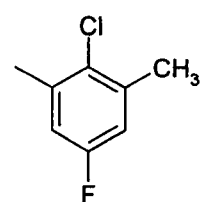
20



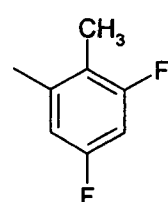
B.81



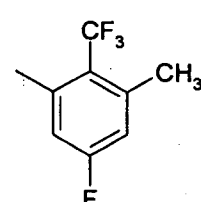
B.82



B.83

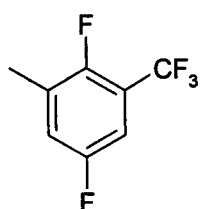


B.84

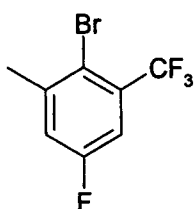


B.85

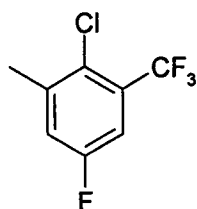
194



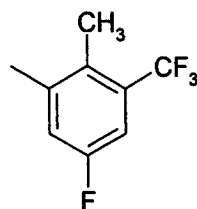
B.86



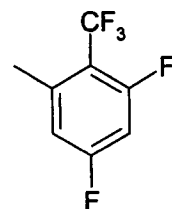
B.87



B.88

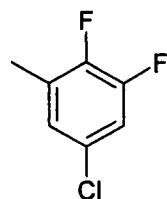


B.89

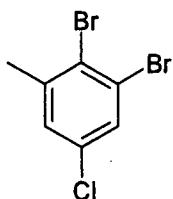


B.90

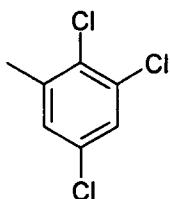
5



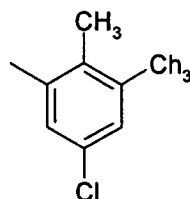
B.91



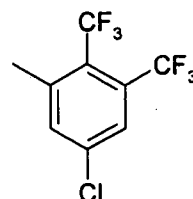
B.92



B.93

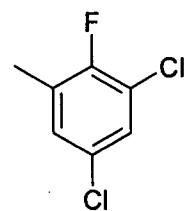


B.94

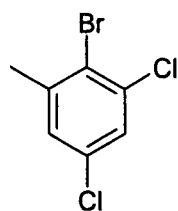


B.95

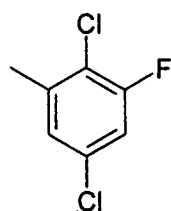
10



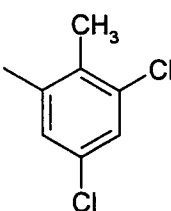
B.96



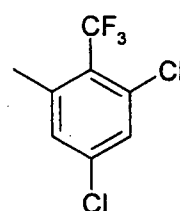
B.97



B.98

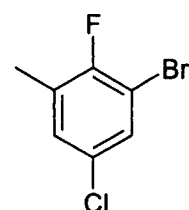


B.99

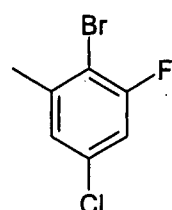


B.100

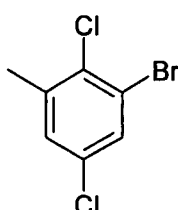
15



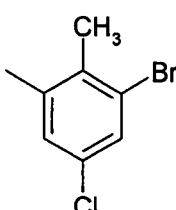
B.101



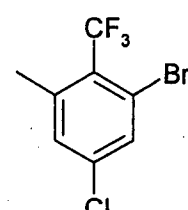
B.102



B.103

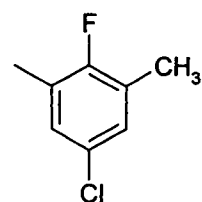


B.104

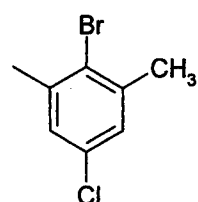


B.105

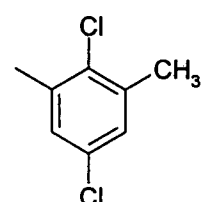
20



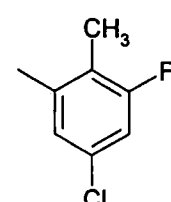
B.106



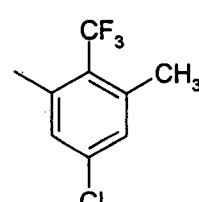
B.107



B.108



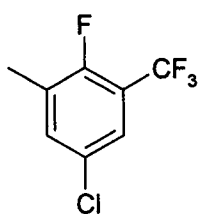
B.109



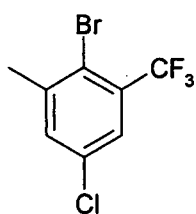
B.110

195

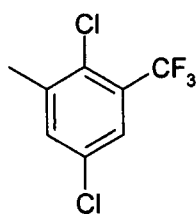
33



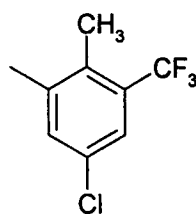
B.111



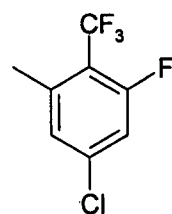
B.112



B.113

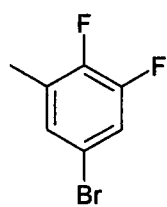


B.114

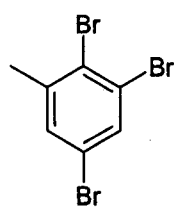


B.115

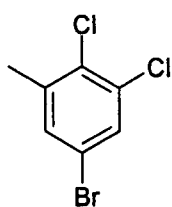
5



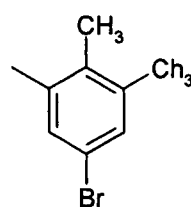
B.116



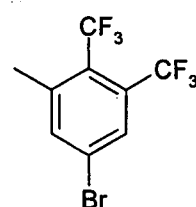
B.117



B.118

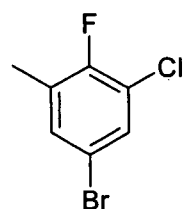


B.119

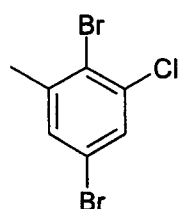


B.120

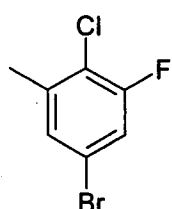
10



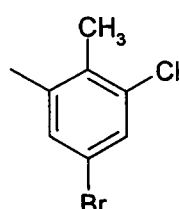
B.121



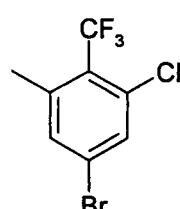
B.122



B.123

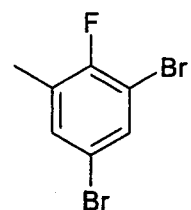


B.124

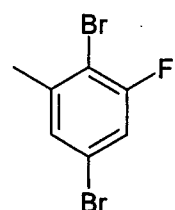


B.125

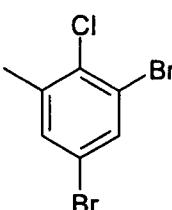
15



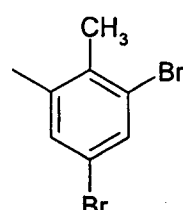
B.126



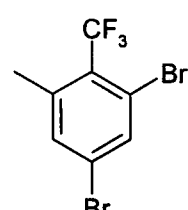
B.127



B.128

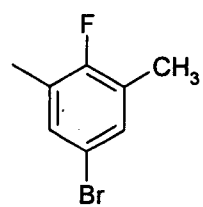


B.129

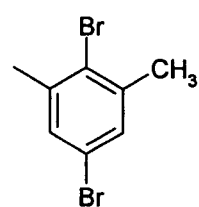


B.130

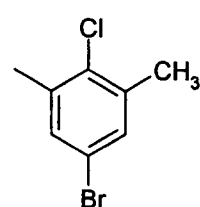
20



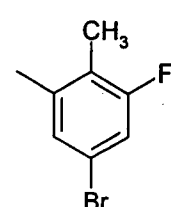
B.131



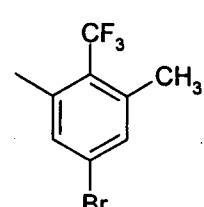
B.132



B.133

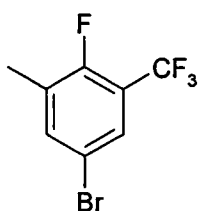


B.134

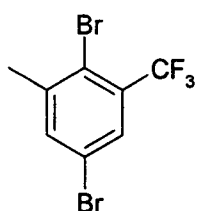


B.135

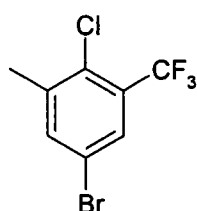
34



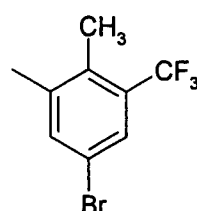
B.136



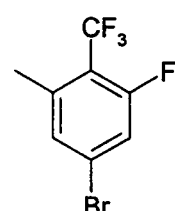
B.137



B.138

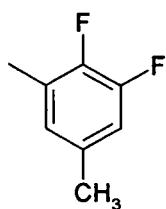


B.139

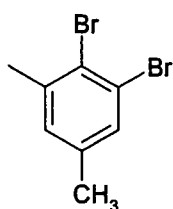


B.140

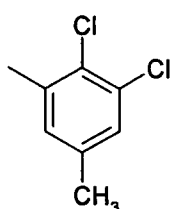
5



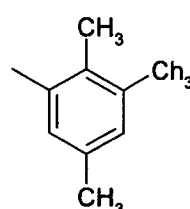
B.141



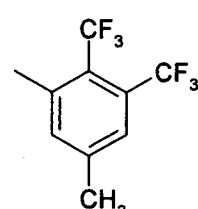
B.142



B.143

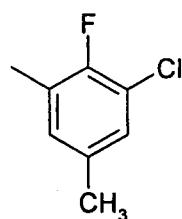


B.144

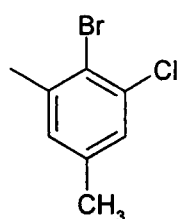


B.145

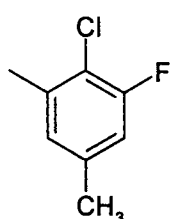
10



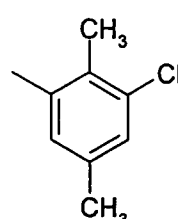
B.146



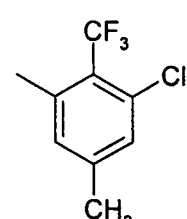
B.147



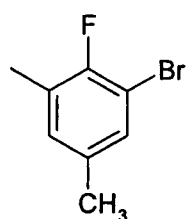
B.148



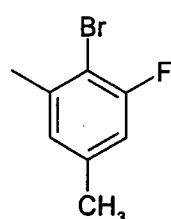
B.149



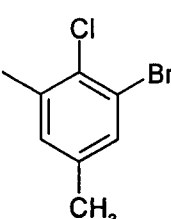
B.150



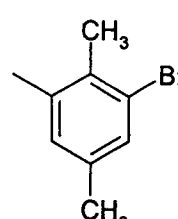
B.151



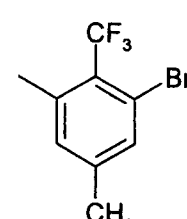
B.152



B.153

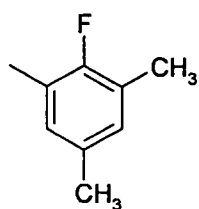


B.154

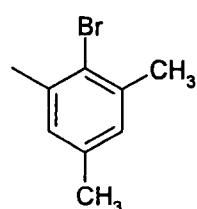


B.155

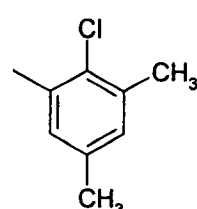
15



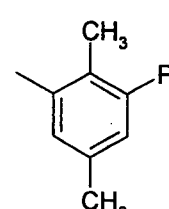
B.156



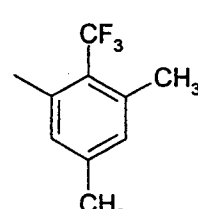
B.157



B.158



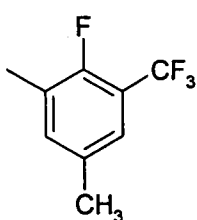
B.159



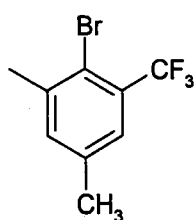
B.160

20

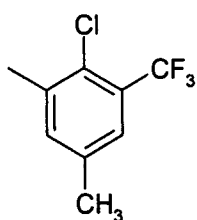
197



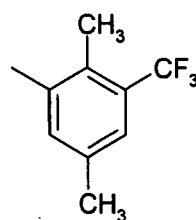
B.161



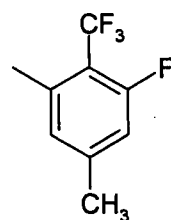
B.162



B.163

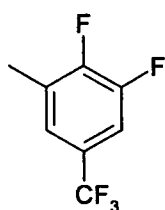


B.164

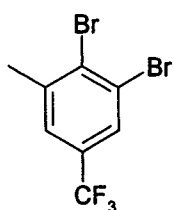


B.165

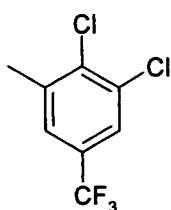
5



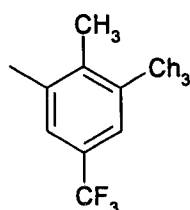
B.166



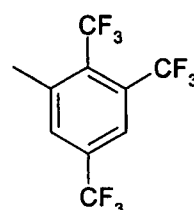
B.167



B.168

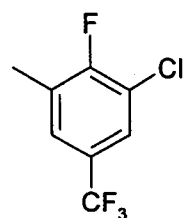


B.169

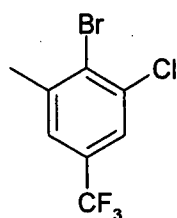


B.170

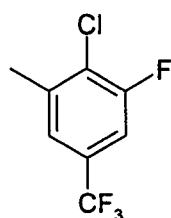
10



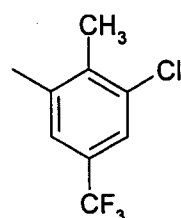
B.171



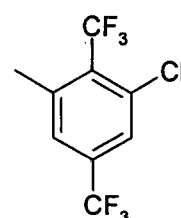
B.172



B.173

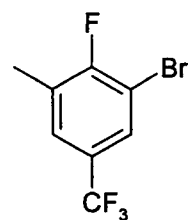


B.174

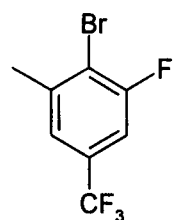


B.175

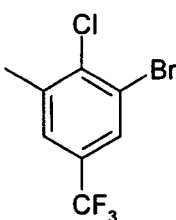
15



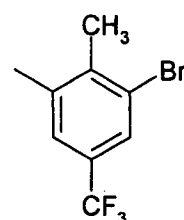
B.176



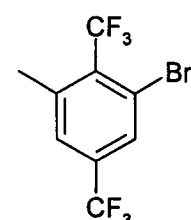
B.177



B.178

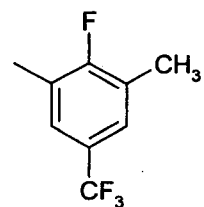


B.179

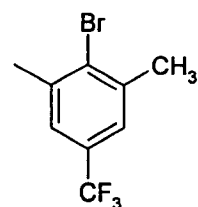


B.180

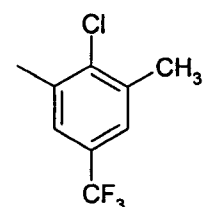
20



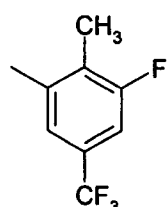
B.181



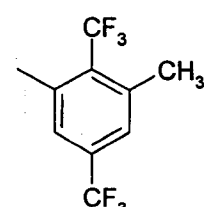
B.182



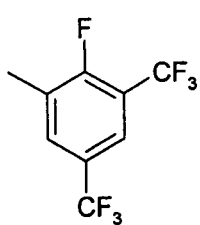
B.183



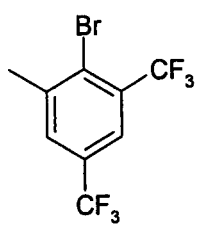
B.184



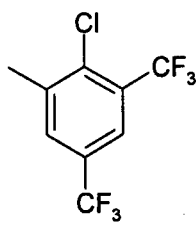
B.185



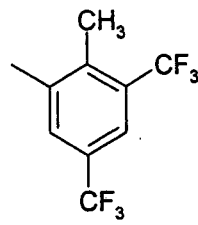
B.186



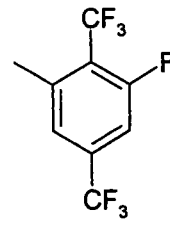
B.187



B.188



B.189



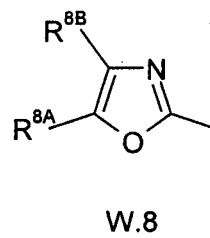
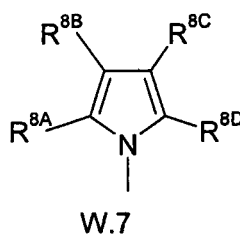
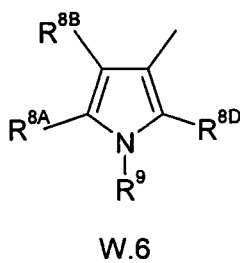
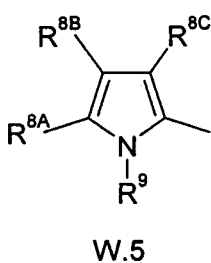
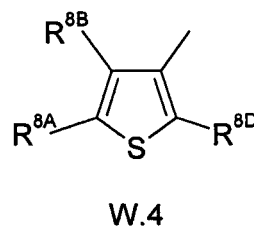
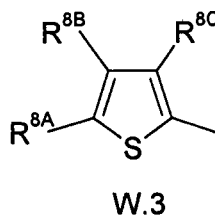
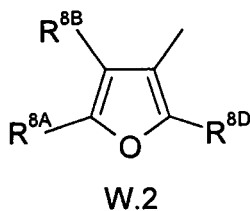
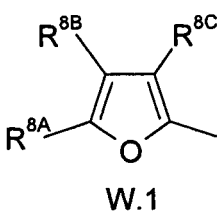
B.190

5

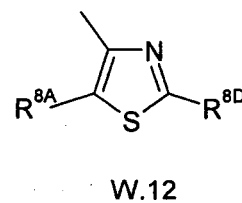
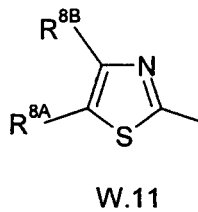
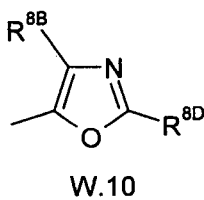
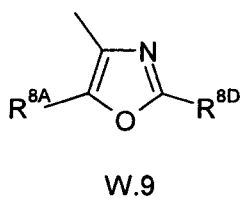
y donde el enlace libre indica la posición de enlace en la fórmula I

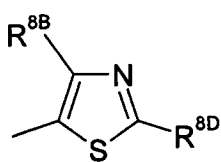
Se prefieren los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I en donde W es seleccionado entre:

10

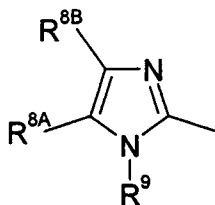


15

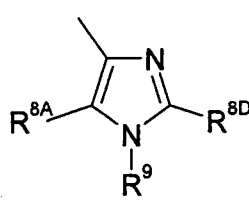




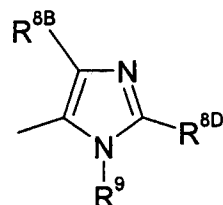
W.13



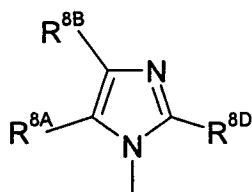
W.14



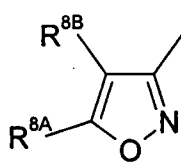
W.15



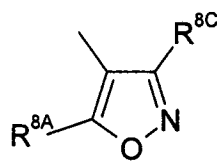
W.16



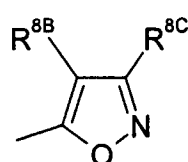
W.17



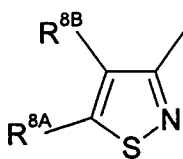
W.18



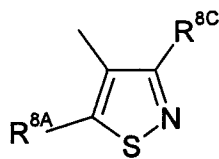
W.19



W.20



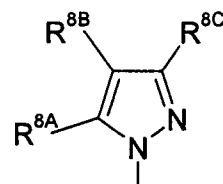
W.21



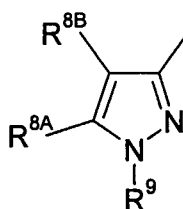
W.22



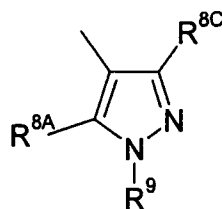
W.23



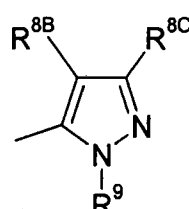
W.24



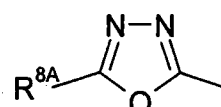
W.25



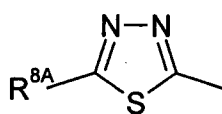
W.26



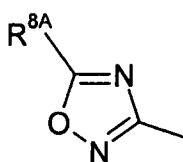
W.27



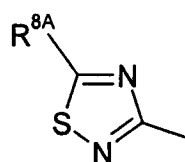
W.28



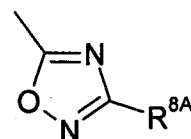
W.29



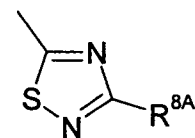
W.30



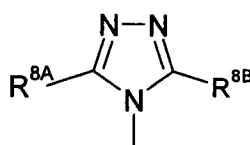
W.31



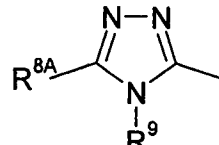
W.32



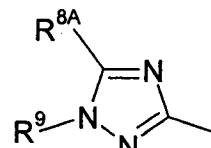
W.33



W.34



W.35

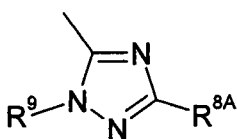


W.36

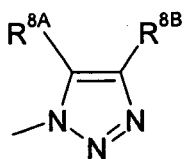
5

10

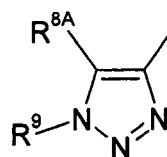
200



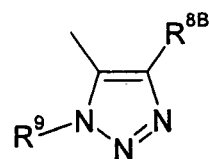
W.37



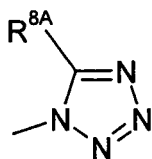
W.38



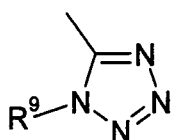
W.39



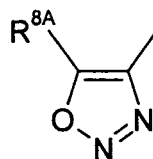
W.40



W.41



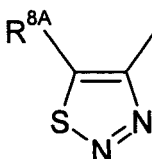
W.42



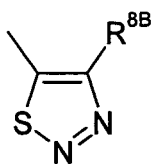
W.43



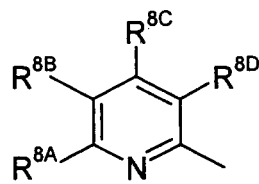
W.44



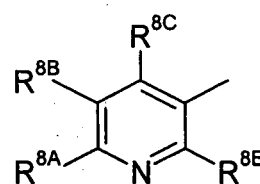
W.45



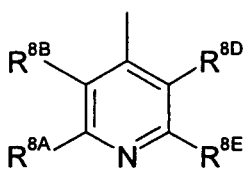
W.46



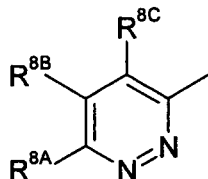
W.47



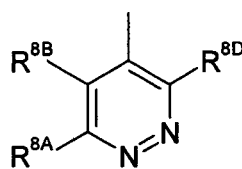
W.48



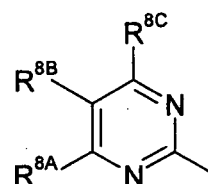
W.49



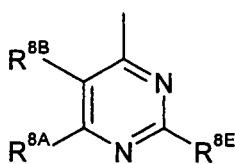
W.50



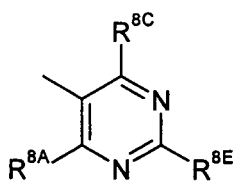
W.51



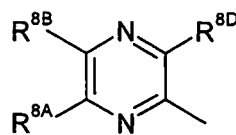
W.52



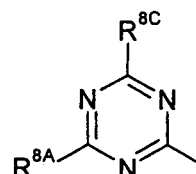
W.53



W.54



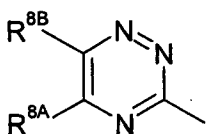
W.55



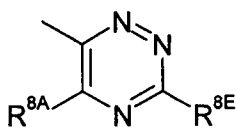
W.56

5

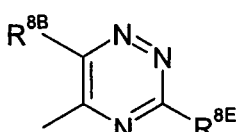
10



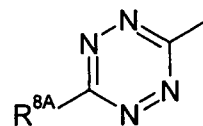
W.57



W.58



W.59



W.60

y donde el enlace libre indica la posición de enlace en la fórmula I.

- 5 Se prefieren aún más los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde W es seleccionado entre W.1, W.2, W.3, W.4, W.5, W.6, W.8, W.9, W.10, W.11, W.12, W.13, W.14, W.15, W.17, W.18, W.19, W.20, W.21, W.22, W.23, W.25, W.26, W.27, W.28, W.29, W.30, W.31, W.32, W.33, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 y W. 54.

10

Se prefieren, sobre todo, los compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano, en donde W es seleccionado entre W.1, W.3, W. 25, W.26, W.27, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 y W.54.

15

Son igualmente preferidos los compuestos de la fórmula I, en donde W es seleccionado entre los radicales heteroarilo monosustituídos indicados en la siguiente Tabla H (W-R.1 - W.R.512):

202

Tabla H:

Radical	W	R ^{8A}	R ^{8B}	R ^{8C}	R ^{8D}	R ^{8E}	R ⁹
W-R.1	W.1	H	H	H	/	/	/
W-R.2	W.1	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.3	W.1	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.4	W.1	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.5	W.1	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.6	W.1	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.7	W.1	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.8	W.1	Cl	H	H	/	/	/
W-R.9	W.1	H	Cl	H	/	/	/
W-R.10	W.1	H	H	Cl	/	/	/
W-R.11	W.2	H	H	/	H	/	/
W-R.12	W.2	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.13	W.2	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.14	W.2	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.15	W.2	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.16	W.2	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.17	W.2	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.18	W.2	Cl	H	/	H	/	/
W-R.19	W.2	H	Cl	/	H	/	/
W-R.20	W.2	H	H	/	Cl	/	/
W-R.21	W.3	H	H	H	/	/	/
W-R.22	W.3	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.23	W.3	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.24	W.3	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.25	W.3	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.26	W.3	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.27	W.3	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.28	W.3	Cl	H	H	/	/	/
W-R.29	W.3	H	Cl	H	/	/	/
W-R.30	W.3	H	H	Cl	/	/	/
W-R.31	W.4	H	H	/	H	/	/
W-R.32	W.4	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.33	W.4	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.34	W.4	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.35	W.4	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.36	W.4	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.37	W.4	H	H	/	CF ₃	/	/

293

W-R.38	W.4	Cl	H	/	H	/	/
W-R.39	W.4	H	Cl	/	H	/	/
W-R.40	W.4	H	H	/	Cl	/	/
W-R.41	W.5	H	H	H	/	/	H
W-R.42	W.5	CH ₃	H	H	/	/	H
W-R.43	W.5	H	CH ₃	H	/	/	H
W-R.44	W.5	H	H	CH ₃	/	/	H
W-R.45	W.5	CF ₃	H	H	/	/	H
W-R.46	W.5	H	CF ₃	H	/	/	H
W-R.47	W.5	H	H	CF ₃	/	/	H
W-R.48	W.5	Cl	H	H	/	/	H
W-R.49	W.5	H	Cl	H	/	/	H
W-R.50	W.5	H	H	Cl	/	/	H
W-R.51	W.5	H	H	H	/	/	CH ₃
W-R.52	W.5	CH ₃	H	H	/	/	CH ₃
W-R.53	W.5	H	CH ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.54	W.5	H	H	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.55	W.5	CF ₃	H	H	/	/	CH ₃
W-R.56	W.5	H	CF ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.57	W.5	H	H	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.58	W.5	Cl	H	H	/	/	CH ₃
W-R.59	W.5	H	Cl	H	/	/	CH ₃
W-R.60	W.5	H	H	Cl	/	/	CH ₃
W-R.61	W.6	H	H	/	H	/	H
W-R.62	W.6	CH ₃	H	/	H	/	H
W-R.63	W.6	H	CH ₃	/	H	/	H
W-R.64	W.6	H	H	/	CH ₃	/	H
W-R.65	W.6	CF ₃	H	/	H	/	H
W-R.66	W.6	H	CF ₃	/	H	/	H
W-R.67	W.6	H	H	/	CF ₃	/	H
W-R.68	W.6	Cl	H	/	H	/	H
W-R.69	W.6	H	Cl	/	H	/	H
W-R.70	W.6	H	H	/	Cl	/	H
W-R.71	W.6	H	H	/	H	/	CH ₃
W-R.72	W.6	CH ₃	H	/	H	/	CH ₃
W-R.73	W.6	H	CH ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.74	W.6	H	H	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.75	W.6	CF ₃	H	/	H	/	CH ₃
W-R.76	W.6	H	CF ₃	/	H	/	CH ₃

204

W-R.77	W.6	H	H	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.78	W.6	Cl	H	/	H	/	CH ₃
W-R.79	W.6	H	Cl	/	H	/	CH ₃
W-R.80	W.6	H	H	/	Cl	/	CH ₃
W-R.81	W.7	H	H	H	H	/	/
W-R.82	W.7	CH ₃	H	H	H	/	/
W-R.83	W.7	H	CH ₃	H	H	/	/
W-R.84	W.7	H	H	CH ₃	H	/	/
W-R.85	W.7	H	H	H	CH ₃	/	/
W-R.86	W.7	CF ₃	H	H	H	/	/
W-R.87	W.7	H	CF ₃	H	H	/	/
W-R.88	W.7	H	H	CF ₃	H	/	/
W-R.89	W.7	H	H	H	CF ₃	/	/
W-R.90	W.7	Cl	H	H	H	/	/
W-R.91	W.7	H	Cl	H	H	/	/
W-R.92	W.7	H	H	Cl	H	/	/
W-R.93	W.7	H	H	H	Cl	/	/
W-R.94	W.8	H	H	/	/	/	/
W-R.95	W.8	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.96	W.8	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.97	W.8	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.98	W.8	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.99	W.8	H	Cl	/	/	/	/
W-R.100	W.8	Cl	H	/	/	/	/
W-R.101	W.9	H	/	/	H	/	/
W-R.102	W.9	CH ₃	/	/	H	/	/
W-R.103	W.9	H	/	/	CH ₃	/	/
W-R.104	W.9	CF ₃	/	/	H	/	/
W-R.105	W.9	H	/	/	CF ₃	/	/
W-R.106	W.9	Cl	/	/	H	/	/
W-R.107	W.9	H	/	/	Cl	/	/
W-R.108	W.10	/	H	/	H	/	/
W-R.109	W.10	/	H	/	CH ₃	/	/
W-R.110	W.10	/	CH ₃	/	H	/	/
W-R.111	W.10	/	H	/	CF ₃	/	/
W-R.112	W.10	/	CF ₃	/	H	/	/
W-R.113	W.10	/	H	/	Cl	/	/
W-R.114	W.10	/	Cl	/	H	/	/
W-R.115	W.11	H	H	/	/	/	/

205

W-R.116	W.11	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.117	W.11	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.118	W.11	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.119	W.11	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.120	W.11	H	Cl	/	/	/	/
W-R.121	W.11	Cl	H	/	/	/	/
W-R.122	W.12	H	/	/	H	/	/
W-R.123	W.12	CH ₃	/	/	H	/	/
W-R.124	W.12	H	/	/	CH ₃	/	/
W-R.125	W.12	CF ₃	/	/	H	/	/
W-R.126	W.12	H	/	/	CF ₃	/	/
W-R.127	W.12	Cl	/	/	H	/	/
W-R.128	W.12	H	/	/	Cl	/	/
W-R.129	W.13	/	H	/	H	/	/
W-R.130	W.13	/	H	/	CH ₃	/	/
W-R.131	W.13	/	CH ₃	/	H	/	/
W-R.132	W.13	/	H	/	CF ₃	/	/
W-R.133	W.13	/	CF ₃	/	H	/	/
W-R.134	W.13	/	H	/	Cl	/	/
W-R.135	W.13	/	Cl	/	H	/	/
W-R.136	W.14	H	H	/	/	/	H
W-R.137	W.14	H	CH ₃	/	/	/	H
W-R.138	W.14	CH ₃	H	/	/	/	H
W-R.139	W.14	H	CF ₃	/	/	/	H
W-R.140	W.14	CF ₃	H	/	/	/	H
W-R.141	W.14	H	Cl	/	/	/	H
W-R.142	W.14	Cl	H	/	/	/	H
W-R.143	W.14	H	H	/	/	/	CH ₃
W-R.144	W.14	H	CH ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.145	W.14	CH ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.146	W.14	H	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.147	W.14	CF ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.148	W.14	H	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.149	W.14	Cl	H	/	/	/	CH ₃
W-R.150	W.15	H	/	/	H	/	H
W-R.151	W.15	CH ₃	/	/	H	/	H
W-R.152	W.15	H	/	/	CH ₃	/	H
W-R.153	W.15	CF ₃	/	/	H	/	H
W-R.154	W.15	H	/	/	CF ₃	/	H

W-R.155	W.15	Cl	/	/	H	/	H
W-R.156	W.15	H	/	/	Cl	/	H
W-R.157	W.15	H	/	/	H	/	CH ₃
W-R.158	W.15	CH ₃	/	/	H	/	CH ₃
W-R.159	W.15	H	/	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.160	W.15	CF ₃	/	/	H	/	CH ₃
W-R.161	W.15	H	/	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.162	W.15	Cl	/	/	H	/	CH ₃
W-R.163	W.15	H	/	/	Cl	/	CH ₃
W-R.164	W.16	/	H	/	H	/	H
W-R.165	W.16	/	H	/	CH ₃	/	H
W-R.166	W.16	/	CH ₃	/	H	/	H
W-R.167	W.16	/	H	/	CF ₃	/	H
W-R.168	W.16	/	CF ₃	/	H	/	H
W-R.169	W.16	/	H	/	Cl	/	H
W-R.170	W.16	/	Cl	/	H	/	H
W-R.171	W.16	/	H	/	H	/	CH ₃
W-R.172	W.16	/	H	/	CH ₃	/	CH ₃
W-R.173	W.16	/	CH ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.174	W.16	/	H	/	CF ₃	/	CH ₃
W-R.175	W.16	/	CF ₃	/	H	/	CH ₃
W-R.176	W.16	/	H	/	Cl	/	CH ₃
W-R.177	W.16	/	Cl	/	H	/	CH ₃
W-R.178	W.17	H	H	/	H	/	/
W-R.179	W.17	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.180	W.17	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.181	W.17	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.182	W.17	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.183	W.17	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.184	W.17	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.185	W.17	Cl	H	/	H	/	/
W-R.186	W.17	H	Cl	/	H	/	/
W-R.187	W.17	H	H	/	Cl	/	/
W-R.188	W.18	H	H	/	/	/	/
W-R.189	W.18	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.190	W.18	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.191	W.18	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.192	W.18	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.193	W.18	H	Cl	/	/	/	/

W-R.194	W.18	Cl	H	/	/	/	/
W-R.195	W.19	H	/	H	/	/	/
W-R.196	W.19	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.197	W.19	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.198	W.19	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.199	W.19	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.200	W.19	Cl	/	H	/	/	/
W-R.201	W.19	H	/	Cl	/	/	/
W-R.202	W.20	/	H	H	/	/	/
W-R.203	W.20	/	CH ₃	H	/	/	/
W-R.204	W.20	/	H	CH ₃	/	/	/
W-R.205	W.20	/	CF ₃	H	/	/	/
W-R.206	W.20	/	H	CF ₃	/	/	/
W-R.207	W.20	/	Cl	H	/	/	/
W-R.208	W.20	/	H	Cl	/	/	/
W-R.209	W.21	H	H	/	/	/	/
W-R.210	W.21	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.211	W.21	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.212	W.21	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.213	W.21	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.214	W.21	H	Cl	/	/	/	/
W-R.215	W.21	Cl	H	/	/	/	/
W-R.216	W.22	H	/	H	/	/	/
W-R.217	W.22	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.218	W.22	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.219	W.22	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.220	W.22	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.221	W.22	Cl	/	H	/	/	/
W-R.222	W.22	H	/	Cl	/	/	/
W-R.223	W.23	/	H	H	/	/	/
W-R.224	W.23	/	CH ₃	H	/	/	/
W-R.225	W.23	/	H	CH ₃	/	/	/
W-R.226	W.23	/	CF ₃	H	/	/	/
W-R.227	W.23	/	H	CF ₃	/	/	/
W-R.228	W.23	/	Cl	H	/	/	/
W-R.229	W.23	/	H	Cl	/	/	/
W-R.230	W.24	H	H	H	/	/	/
W-R.231	W.24	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.232	W.24	H	CH ₃	H	/	/	/

208

W-R.233	W.24	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.234	W.24	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.235	W.24	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.236	W.24	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.237	W.24	Cl	H	H	/	/	/
W-R.238	W.24	H	Cl	H	/	/	/
W-R.239	W.24	H	H	Cl	/	/	/
W-R.240	W.25	H	H	/	/	/	H
W-R.241	W.25	H	CH ₃	/	/	/	H
W-R.242	W.25	CH ₃	H	/	/	/	H
W-R.243	W.25	H	CF ₃	/	/	/	H
W-R.244	W.25	CF ₃	H	/	/	/	H
W-R.245	W.25	H	Cl	/	/	/	H
W-R.246	W.25	Cl	H	/	/	/	H
W-R.247	W.25	H	H	/	/	/	CH ₃
W-R.248	W.25	H	CH ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.249	W.25	CH ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.250	W.25	H	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.251	W.25	CF ₃	H	/	/	/	CH ₃
W-R.252	W.25	H	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.253	W.25	Cl	H	/	/	/	CH ₃
W-R.254	W.26	H	/	H	/	/	H
W-R.255	W.26	CH ₃	/	H	/	/	H
W-R.256	W.26	H	/	CH ₃	/	/	H
W-R.257	W.26	CF ₃	/	H	/	/	H
W-R.258	W.26	H	/	CF ₃	/	/	H
W-R.259	W.26	Cl	/	H	/	/	H
W-R.260	W.26	H	/	Cl	/	/	H
W-R.261	W.26	H	/	H	/	/	CH ₃
W-R.262	W.26	CH ₃	/	H	/	/	CH ₃
W-R.263	W.26	H	/	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.264	W.26	CF ₃	/	H	/	/	CH ₃
W-R.265	W.26	H	/	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.266	W.26	Cl	/	H	/	/	CH ₃
W-R.267	W.26	H	/	Cl	/	/	CH ₃
W-R.268	W.27	/	H	H	/	/	H
W-R.269	W.27	/	CH ₃	H	/	/	H
W-R.270	W.27	/	H	CH ₃	/	/	H
W-R.271	W.27	/	CF ₃	H	/	/	H

209

W-R.272	W.27	/	H	CF ₃	/	/	H
W-R.273	W.27	/	Cl	H	/	/	H
W-R.274	W.27	/	H	Cl	/	/	H
W-R.275	W.27	/	H	H	/	/	CH ₃
W-R.276	W.27	/	CH ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.277	W.27	/	H	CH ₃	/	/	CH ₃
W-R.278	W.27	/	CF ₃	H	/	/	CH ₃
W-R.279	W.27	/	H	CF ₃	/	/	CH ₃
W-R.280	W.27	/	Cl	H	/	/	CH ₃
W-R.281	W.27	/	H	Cl	/	/	CH ₃
W-R.282	W.28	H	/	/	/	/	/
W-R.283	W.28	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.284	W.28	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.285	W.28	Cl	/	/	/	/	/
W-R.286	W.29	H	/	/	/	/	/
W-R.287	W.29	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.288	W.29	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.289	W.29	Cl	/	/	/	/	/
W-R.290	W.30	H	/	/	/	/	/
W-R.291	W.30	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.292	W.30	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.293	W.30	Cl	/	/	/	/	/
W-R.294	W.31	H	/	/	/	/	/
W-R.295	W.31	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.296	W.31	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.297	W.31	Cl	/	/	/	/	/
W-R.298	W.32	H	/	/	/	/	/
W-R.299	W.32	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.300	W.32	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.301	W.32	Cl	/	/	/	/	/
W-R.302	W.33	H	/	/	/	/	/
W-R.303	W.33	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.304	W.33	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.305	W.33	Cl	/	/	/	/	/
W-R.306	W.34	H	H	/	/	/	/
W-R.307	W.34	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.308	W.34	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.309	W.34	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.310	W.34	CF ₃	H	/	/	/	/

W-R.311	W.34	H	Cl	/	/	/	/
W-R.312	W.34	Cl	H	/	/	/	/
W-R.313	W.35	H	/	/	/	/	H
W-R.314	W.35	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.315	W.35	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.316	W.35	Cl	/	/	/	/	H
W-R.317	W.35	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.318	W.35	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.319	W.35	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.320	W.35	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.321	W.36	H	/	/	/	/	H
W-R.322	W.36	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.323	W.36	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.324	W.36	Cl	/	/	/	/	H
W-R.325	W.36	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.326	W.36	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.327	W.36	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.328	W.36	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.329	W.37	H	/	/	/	/	H
W-R.330	W.37	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.331	W.37	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.332	W.37	Cl	/	/	/	/	H
W-R.333	W.37	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.334	W.37	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.335	W.37	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.336	W.37	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.337	W.38	H	H	/	/	/	/
W-R.338	W.38	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.339	W.38	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.340	W.38	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.341	W.38	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.342	W.38	H	Cl	/	/	/	/
W-R.343	W.38	Cl	H	/	/	/	/
W-R.344	W.39	H	/	/	/	/	H
W-R.345	W.39	CH ₃	/	/	/	/	H
W-R.346	W.39	CF ₃	/	/	/	/	H
W-R.347	W.39	Cl	/	/	/	/	H
W-R.348	W.39	H	/	/	/	/	CH ₃
W-R.349	W.39	CH ₃	/	/	/	/	CH ₃

211

W-R.350	W.39	CF ₃	/	/	/	/	CH ₃
W-R.351	W.39	Cl	/	/	/	/	CH ₃
W-R.352	W.40	/	H	/	/	/	H
W-R.353	W.40	/	CH ₃	/	/	/	H
W-R.354	W.40	/	CF ₃	/	/	/	H
W-R.355	W.40	/	Cl	/	/	/	H
W-R.356	W.40	/	H	/	/	/	CH ₃
W-R.357	W.40	/	CH ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.358	W.40	/	CF ₃	/	/	/	CH ₃
W-R.359	W.40	/	Cl	/	/	/	CH ₃
W-R.360	W.41	H	/	/	/	/	/
W-R.361	W.41	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.362	W.41	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.363	W.41	Cl	/	/	/	/	/
W-R.364	W.42	/	/	/	/	/	H
W-R.365	W.42	/	/	/	/	/	CH ₃
W-R.366	W.43	H	/	/	/	/	/
W-R.367	W.43	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.368	W.43	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.369	W.43	Cl	/	/	/	/	/
W-R.370	W.44	/	H	/	/	/	/
W-R.371	W.44	/	CH ₃	/	/	/	/
W-R.372	W.44	/	CF ₃	/	/	/	/
W-R.373	W.44	/	Cl	/	/	/	/
W-R.374	W.45	H	/	/	/	/	/
W-R.375	W.45	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.376	W.45	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.377	W.45	Cl	/	/	/	/	/
W-R.378	W.46	/	H	/	/	/	/
W-R.379	W.46	/	CH ₃	/	/	/	/
W-R.380	W.46	/	CF ₃	/	/	/	/
W-R.381	W.46	/	Cl	/	/	/	/
W-R.382	W.47	H	H	H	H	/	/
W-R.383	W.47	CH ₃	H	H	H	/	/
W-R.384	W.47	H	CH ₃	H	H	/	/
W-R.385	W.47	H	H	CH ₃	H	/	/
W-R.386	W.47	H	H	H	CH ₃	/	/
W-R.387	W.47	CF ₃	H	H	H	/	/
W-R.388	W.47	H	CF ₃	H	H	/	/

212

W-R.389	W.47	H	H	CF ₃	H	/	/
W-R.390	W.47	H	H	H	CF ₃	/	/
W-R.391	W.47	Cl	H	H	H	/	/
W-R.392	W.47	H	Cl	H	H	/	/
W-R.393	W.47	H	H	Cl	H	/	/
W-R.394	W.47	H	H	H	Cl	/	/
W-R.395	W.48	H	H	H	/	H	/
W-R.396	W.48	CH ₃	H	H	/	H	/
W-R.397	W.48	H	CH ₃	H	/	H	/
W-R.398	W.48	H	H	CH ₃	/	H	/
W-R.399	W.48	H	H	H	/	CH ₃	/
W-R.400	W.48	CF ₃	H	H	/	H	/
W-R.401	W.48	H	CF ₃	H	/	H	/
W-R.402	W.48	H	H	CF ₃	/	H	/
W-R.403	W.48	H	H	H	/	CF ₃	/
W-R.404	W.48	Cl	H	H	/	H	/
W-R.405	W.48	H	Cl	H	/	H	/
W-R.406	W.48	H	H	Cl	/	H	/
W-R.407	W.48	H	H	H	/	Cl	/
W-R.408	W.49	H	H	/	H	H	/
W-R.409	W.49	CH ₃	H	/	H	H	/
W-R.410	W.49	H	CH ₃	/	H	H	/
W-R.411	W.49	H	H	/	CH ₃	H	/
W-R.412	W.49	H	H	/	H	CH ₃	/
W-R.413	W.49	CF ₃	H	/	H	H	/
W-R.414	W.49	H	CF ₃	/	H	H	/
W-R.415	W.49	H	H	/	CF ₃	H	/
W-R.416	W.49	H	H	/	H	CF ₃	/
W-R.417	W.49	Cl	H	/	H	H	/
W-R.418	W.49	H	Cl	/	H	H	/
W-R.419	W.49	H	H	/	Cl	H	/
W-R.420	W.49	H	H	/	H	Cl	/
W-R.421	W.50	H	H	H	/	/	/
W-R.422	W.50	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.423	W.50	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.424	W.50	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.425	W.50	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.426	W.50	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.427	W.50	H	H	CF ₃	/	/	/

213

W-R.428	W.50	Cl	H	H	/	/	/
W-R.429	W.50	H	Cl	H	/	/	/
W-R.430	W.50	H	H	Cl	/	/	/
W-R.431	W.51	H	H	/	H	/	/
W-R.432	W.51	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.433	W.51	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.434	W.51	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.435	W.51	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.436	W.51	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.437	W.51	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.438	W.51	Cl	H	/	H	/	/
W-R.439	W.51	H	Cl	/	H	/	/
W-R.440	W.51	H	H	/	Cl	/	/
W-R.441	W.52	H	H	H	/	/	/
W-R.442	W.52	CH ₃	H	H	/	/	/
W-R.443	W.52	H	CH ₃	H	/	/	/
W-R.444	W.52	H	H	CH ₃	/	/	/
W-R.445	W.52	CF ₃	H	H	/	/	/
W-R.446	W.52	H	CF ₃	H	/	/	/
W-R.447	W.52	H	H	CF ₃	/	/	/
W-R.448	W.52	Cl	H	H	/	/	/
W-R.449	W.52	H	Cl	H	/	/	/
W-R.450	W.52	H	H	Cl	/	/	/
W-R.451	W.53	H	H	/	/	H	/
W-R.452	W.53	CH ₃	H	/	/	H	/
W-R.453	W.53	H	CH ₃	/	/	H	/
W-R.454	W.53	H	H	/	/	CH ₃	/
W-R.455	W.53	CF ₃	H	/	/	H	/
W-R.456	W.53	H	CF ₃	/	/	H	/
W-R.457	W.53	H	H	/	/	CF ₃	/
W-R.458	W.53	Cl	H	/	/	H	/
W-R.459	W.53	H	Cl	/	/	H	/
W-R.460	W.53	H	H	/	/	Cl	/
W-R.461	W.54	H	/	H	/	H	/
W-R.462	W.54	CH ₃	/	H	/	H	/
W-R.463	W.54	H	/	CH ₃	/	H	/
W-R.464	W.54	H	/	H	/	CH ₃	/
W-R.465	W.54	CF ₃	/	H	/	H	/
W-R.466	W.54	H	/	CF ₃	/	H	/

214

W-R.467	W.54	H	/	H	/	CF ₃	/
W-R.468	W.54	Cl	/	H	/	H	/
W-R.469	W.54	H	/	Cl	/	H	/
W-R.470	W.54	H	/	H	/	Cl	/
W-R.471	W.55	H	H	/	H	/	/
W-R.472	W.55	CH ₃	H	/	H	/	/
W-R.473	W.55	H	CH ₃	/	H	/	/
W-R.474	W.55	H	H	/	CH ₃	/	/
W-R.475	W.55	CF ₃	H	/	H	/	/
W-R.476	W.55	H	CF ₃	/	H	/	/
W-R.477	W.55	H	H	/	CF ₃	/	/
W-R.478	W.55	Cl	H	/	H	/	/
W-R.479	W.55	H	Cl	/	H	/	/
W-R.480	W.55	H	H	/	Cl	/	/
W-R.481	W.56	H	/	H	/	/	/
W-R.482	W.56	CH ₃	/	H	/	/	/
W-R.483	W.56	H	/	CH ₃	/	/	/
W-R.484	W.56	CF ₃	/	H	/	/	/
W-R.485	W.56	H	/	CF ₃	/	/	/
W-R.486	W.56	Cl	/	H	/	/	/
W-R.487	W.56	H	/	Cl	/	/	/
W-R.488	W.57	H	H	/	/	/	/
W-R.489	W.57	H	CH ₃	/	/	/	/
W-R.490	W.57	CH ₃	H	/	/	/	/
W-R.491	W.57	H	CF ₃	/	/	/	/
W-R.492	W.57	CF ₃	H	/	/	/	/
W-R.493	W.57	H	Cl	/	/	/	/
W-R.494	W.57	Cl	H	/	/	/	/
W-R.495	W.58	H	/	/	/	H	/
W-R.496	W.58	CH ₃	/	/	/	H	/
W-R.497	W.58	H	/	/	/	CH ₃	/
W-R.498	W.58	CF ₃	/	/	/	H	/
W-R.499	W.58	H	/	/	/	CF ₃	/
W-R.500	W.58	Cl	/	/	/	H	/
W-R.501	W.58	H	/	/	/	Cl	/
W-R.502	W.59	/	H	/	/	H	/
W-R.503	W.59	/	CH ₃	/	/	H	/
W-R.504	W.59	/	H	/	/	CH ₃	/
W-R.505	W.59	/	CF ₃	/	/	H	/

215

W-R.506	W.59	/	H	/	/	CF ₃	/
W-R.507	W.59	/	Cl	/	/	H	/
W-R.508	W.59	/	H	/	/	Cl	/
W-R.509	W.60	H	/	/	/	/	/
W-R.510	W.60	CH ₃	/	/	/	/	/
W-R.511	W.60	CF ₃	/	/	/	/	/
W-R.512	W.60	Cl	/	/	/	/	/

Compuestos preferidos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano se describen en las siguientes Tablas:

5

1. Tablas 1 - 1910:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W corresponde a cualquier radical W.1 definido como W-R.1 a W-R.10 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

2. Tablas 1911 - 3820:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W corresponde a cualquier radical W.2 definido como W-R.11 a W-R.20 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

3. Tablas 3821 - 5730:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W corresponde a cualquier radical W.3 definido como W-R.21 a W-R.30 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a

20

286

B.190 en las listas a), b) c) o d).

4. Tablas 5731 - 7640:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W

- 5 corresponde a cualquier radical W.4 definido como W-R.31 a W-R.40 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5. Tablas 7641 - 11460:

- 10 Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W corresponde a cualquier radical W.5 definido como W-R.41 a W-R.60 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15 6. Tablas 11461 - 15280:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W

- corresponde a cualquier radical W.6 definido como W-R.61 a W-R.80 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

7. Tablas 15281 - 17763:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W

- corresponde a cualquier radical W.7 definido como W-R.81 a W-R.93 en la Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).
- 25

27

8. Tablas 17764 - 19100:
Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.8 definido como W-R.94 a W-R.100 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
5 B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).
9. Tablas 19101 - 20437:
Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.9 definido como W-R.101 a W-R.107 en la
10 Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).
10. Tablas 20438 - 21774:
Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
15 corresponde a cualquier radical W.10 definido como W-R.108 a W-R.114 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).
11. Tablas 21775 - 23111:
20 Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.11 definido como W-R.115 a W-R.121 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

12. Tablas 23112 - 24448:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.12 definido como W-R.122 a W-R.128 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

13. Tablas 24449 - 25785:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.13 definido como W-R.129 a W-R.135 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

14. Tablas 25786 - 28459:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.14 definido como W-R.136 a W-R.149 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

15. Tablas 28460 - 31133:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.15 definido como W-R.150 a W-R.163 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

219

16. Tablas 31134 - 33807:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.16 definido como W-R.164 a W-R.177 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

17. Tablas 33808 - 35717:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.17 definido como W-R.178 a W-R.187 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

18. Tablas 35718 - 37054:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.18 definido como W-R.188 a W-R.194 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

19. Tablas 37055 - 38391:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.19 definido como W-R.195 a W-R.201 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

220

20. Tablas 38392 - 39728:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.20 definido como W-R.202 a W-R.208 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

21. Tablas 39729 - 41065:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.21 definido como W-R.209 a W-R.215 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

22. Tablas 41066 - 42024:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.22 definido como W-R.216 a W-R.222 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

23. Tablas 42403 - 43739:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.23 definido como W-R.223 a W-R.229 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

221

24. Tablas 43740 - 45649:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.24 definido como W-R.230 a W-R.239 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

25. Tablas 45650 - 48323:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.25 definido como W-R.240 a W-R.253 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

26. Tablas 48324 - 50997:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.26 definido como W-R.254 a W-R.267 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

27. Tablas 50998 - 53671:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.27 definido como W-R.268 a W-R.281 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

222

28. Tablas 53672 - 54435:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.28 definido como W-R.282 a W-R.285 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

29. Tablas 54436 - 55199:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.29 definido como W-R.286 a W-R.289 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

30. Tablas 55200 - 55963:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.30 definido como W-R.290 a W-R.293 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

31. Tablas 55964 - 56727:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.31 definido como W-R.294 a W-R.297 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

32. Tablas 56728 - 57491:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.32 definido como W-R.298 a W-R.301 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

33. Tablas 57492 - 58255:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.33 definido como W-R.302 a W-R.305 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

34. Tablas 58256 - 59592:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.34 definido como W-R.306 a W-R.312 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

35. Tablas 59593 - 61120:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.35 definido como W-R.313 a W-R.320 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

224

36. Tablas 61121 - 62648:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.36 definido como W-R.321 a W-R.328 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

37. Tablas 62649 - 64179:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.37 definido como W-R.329 a W-R.336 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

38. Tablas 64177 - 65513:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.38 definido como W-R.337 a W-R.343 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

39. Tablas 65514 - 67041:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.39 definido como W-R.344 a W-R.351 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

225

40. Tablas 67042 - 68569:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.41 definido como W-R.352 a W-R.359 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

41. Tablas 68570 - 69333:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.41 definido como W-R.360 a W-R.363 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

42. Tablas 69334 - 69715:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.42 definido como W-R.364 y W-R.365 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

43. Tablas 69716 - 70479:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.43 definido como W-R.366 a W-R.369 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

226

44. Tablas 70480 - 71243:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.44 definido como W-R.370 a W-R.373 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

45. Tablas 71243 - 72007:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.45 definido como W-R.374 a W-R.377 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

46. Tablas 72008 - 72771:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.46 definido como W-R.378 a W-R.381 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

47. Tablas 72772 - 75254:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.47 definido como W-R.382 a W-R.394 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

227

48. Tablas 75255 - 77737:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.48 definido como W-R.395 a W-R.407 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

49. Tablas 77738 - 80220:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.49 definido como W-R.408 a W-R.420 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

50. Tablas 80221 - 82130:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.50 definido como W-R.421 a W-R.430 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

51. Tablas 82131 - 84040:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.51 definido como W-R.431 a W-R.440 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

228

52. Tablas 84041 - 85950:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.52 definido como W-R.441 a W-R.450 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

53. Tablas 85951 - 87860:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.53 definido como W-R.451 a W-R.460 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

10

54. Tablas 87861 - 89770:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.54 definido como W-R.461 a W-R.470 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

15

55. Tablas 89771 - 91680:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.55 definido como W-R.471 a W-R.480 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

20

224

56. Tablas 91681 - 93017:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.56 definido como W-R.481 a W-R.487 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

57. Tablas 93018 - 94354:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.57 definido como W-R.488 a W-R.494 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

58. Tablas 94355 - 95691:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.58 definido como W-R.495 a W-R.501 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

59. Tablas 95692 - 97028:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.59 definido como W-R.502 a W-R.508 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

230

60. Tablas 97029 - 97792:

Compuestos de la fórmula I, en donde derivado de radical hetarilo W
corresponde a cualquier radical W.60 definido como W-R.509 a W-R.512 en la
Tabla H y el derivado de radical fenilo B corresponde a cualquier radical fenilo
B.0 a B.190 en las listas a), b) c) o d).

5

Son especialmente preferidos los compuestos de la fórmula I definidos en la siguiente
Tabla A, en donde R¹, R² y R³ significan hidrógeno;

A es A² y R^{4a}, R^{4b}, R^{4c} y R^{4d} significan hidrógeno y X es azufre;

10 y en donde R⁶ es hidrógeno:

Tabla A:

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.1	B.0	W-R.1
fórmula I.2	B.1	W-R.1
fórmula I.3	B.2	W-R.1
fórmula I.4	B.3	W-R.1
fórmula I.5	B.4	W-R.1
fórmula I.6	B.5	W-R.1
fórmula I.7	B.6	W-R.1
fórmula I.8	B.7	W-R.1
fórmula I.9	B.8	W-R.1
fórmula I.10	B.9	W-R.1
fórmula I.11	B.10	W-R.1
fórmula I.12	B.11	W-R.1
fórmula I.13	B.12	W-R.1
fórmula I.14	B.13	W-R.1
fórmula I.15	B.14	W-R.1
fórmula I.16	B.15	W-R.1
fórmula I.17	B.16	W-R.1
fórmula I.18	B.17	W-R.1
fórmula I.19	B.18	W-R.1
fórmula I.20	B.19	W-R.1

231

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.21	B.20	W-R.1
fórmula I.22	B.21	W-R.1
fórmula I.23	B.22	W-R.1
fórmula I.24	B.23	W-R.1
fórmula I.25	B.24	W-R.1
fórmula I.26	B.25	W-R.1
fórmula I.27	B.26	W-R.1
fórmula I.28	B.27	W-R.1
fórmula I.29	B.28	W-R.1
fórmula I.30	B.29	W-R.1
fórmula I.31	B.30	W-R.1
fórmula I.32	B.31	W-R.1
fórmula I.33	B.32	W-R.1
fórmula I.34	B.33	W-R.1
fórmula I.35	B.34	W-R.1
fórmula I.36	B.35	W-R.1
fórmula I.37	B.36	W-R.1
fórmula I.38	B.37	W-R.1
fórmula I.39	B.38	W-R.1
fórmula I.40	B.39	W-R.1
fórmula I.41	B.40	W-R.1
fórmula I.42	B.41	W-R.1
fórmula I.43	B.42	W-R.1
fórmula I.44	B.43	W-R.1
fórmula I.45	B.44	W-R.1
fórmula I.46	B.45	W-R.1
fórmula I.47	B.46	W-R.1
fórmula I.48	B.47	W-R.1
fórmula I.49	B.48	W-R.1
fórmula I.50	B.49	W-R.1
fórmula I.51	B.50	W-R.1
fórmula I.52	B.51	W-R.1
fórmula I.53	B.52	W-R.1
fórmula I.54	B.53	W-R.1
fórmula I.55	B.54	W-R.1
fórmula I.56	B.55	W-R.1
fórmula I.57	B.56	W-R.1
fórmula I.58	B.57	W-R.1

232

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.59	B.58	W-R.1
fórmula I.60	B.59	W-R.1
fórmula I.61	B.60	W-R.1
fórmula I.62	B.61	W-R.1
fórmula I.63	B.62	W-R.1
fórmula I.64	B.63	W-R.1
fórmula I.65	B.64	W-R.1
fórmula I.66	B.65	W-R.1
fórmula I.67	B.66	W-R.1
fórmula I.68	B.67	W-R.1
fórmula I.69	B.68	W-R.1
fórmula I.70	B.69	W-R.1
fórmula I.71	B.70	W-R.1
fórmula I.72	B.71	W-R.1
fórmula I.73	B.72	W-R.1
fórmula I.74	B.73	W-R.1
fórmula I.75	B.74	W-R.1
fórmula I.76	B.75	W-R.1
fórmula I.77	B.76	W-R.1
fórmula I.78	B.77	W-R.1
fórmula I.79	B.78	W-R.1
fórmula I.80	B.79	W-R.1
fórmula I.81	B.80	W-R.1
fórmula I.82	B.81	W-R.1
fórmula I.83	B.82	W-R.1
fórmula I.84	B.83	W-R.1
fórmula I.85	B.84	W-R.1
fórmula I.86	B.85	W-R.1
fórmula I.87	B.86	W-R.1
fórmula I.88	B.87	W-R.1
fórmula I.89	B.88	W-R.1
fórmula I.90	B.89	W-R.1
fórmula I.91	B.90	W-R.1
fórmula I.92	B.91	W-R.1
fórmula I.93	B.92	W-R.1
fórmula I.94	B.93	W-R.1
fórmula I.95	B.94	W-R.1
fórmula I.96	B.95	W-R.1

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.97	B.96	W-R.1
fórmula I.98	B.97	W-R.1
fórmula I.99	B.98	W-R.1
fórmula I.100	B.99	W-R.1
fórmula I.101	B.100	W-R.1
fórmula I.102	B.101	W-R.1
fórmula I.103	B.102	W-R.1
fórmula I.104	B.103	W-R.1
fórmula I.105	B.104	W-R.1
fórmula I.106	B.105	W-R.1
fórmula I.107	B.106	W-R.1
fórmula I.108	B.107	W-R.1
fórmula I.109	B.108	W-R.1
fórmula I.110	B.109	W-R.1
fórmula I.111	B.110	W-R.1
fórmula I.112	B.111	W-R.1
fórmula I.113	B.112	W-R.1
fórmula I.114	B.113	W-R.1
fórmula I.115	B.114	W-R.1
fórmula I.116	B.115	W-R.1
fórmula I.117	B.116	W-R.1
fórmula I.118	B.117	W-R.1
fórmula I.119	B.118	W-R.1
fórmula I.120	B.119	W-R.1
fórmula I.121	B.120	W-R.1
fórmula I.122	B.121	W-R.1
fórmula I.123	B.122	W-R.1
fórmula I.124	B.123	W-R.1
fórmula I.125	B.124	W-R.1
fórmula I.126	B.125	W-R.1
fórmula I.127	B.126	W-R.1
fórmula I.128	B.127	W-R.1
fórmula I.129	B.128	W-R.1
fórmula I.130	B.129	W-R.1
fórmula I.131	B.130	W-R.1
fórmula I.132	B.131	W-R.1
fórmula I.133	B.132	W-R.1
fórmula I.134	B.133	W-R.1

234

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.135	B.134	W-R.1
fórmula I.136	B.135	W-R.1
fórmula I.137	B.136	W-R.1
fórmula I.138	B.137	W-R.1
fórmula I.139	B.138	W-R.1
fórmula I.140	B.139	W-R.1
fórmula I.141	B.140	W-R.1
fórmula I.142	B.141	W-R.1
fórmula I.143	B.142	W-R.1
fórmula I.144	B.143	W-R.1
fórmula I.145	B.144	W-R.1
fórmula I.146	B.145	W-R.1
fórmula I.147	B.146	W-R.1
fórmula I.148	B.147	W-R.1
fórmula I.149	B.148	W-R.1
fórmula I.150	B.149	W-R.1
fórmula I.151	B.150	W-R.1
fórmula I.152	B.151	W-R.1
fórmula I.153	B.152	W-R.1
fórmula I.154	B.153	W-R.1
fórmula I.155	B.154	W-R.1
fórmula I.156	B.155	W-R.1
fórmula I.157	B.156	W-R.1
fórmula I.158	B.157	W-R.1
fórmula I.159	B.158	W-R.1
fórmula I.160	B.159	W-R.1
fórmula I.161	B.160	W-R.1
fórmula I.162	B.161	W-R.1
fórmula I.163	B.162	W-R.1
fórmula I.164	B.163	W-R.1
fórmula I.165	B.164	W-R.1
fórmula I.166	B.165	W-R.1
fórmula I.167	B.166	W-R.1
fórmula I.168	B.167	W-R.1
fórmula I.169	B.168	W-R.1
fórmula I.170	B.169	W-R.1
fórmula I.171	B.170	W-R.1
fórmula I.172	B.171	W-R.1

235

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.173	B.172	W-R.1
fórmula I.174	B.173	W-R.1
fórmula I.175	B.174	W-R.1
fórmula I.176	B.175	W-R.1
fórmula I.177	B.176	W-R.1
fórmula I.178	B.177	W-R.1
fórmula I.179	B.178	W-R.1
fórmula I.180	B.179	W-R.1
fórmula I.181	B.180	W-R.1
fórmula I.182	B.181	W-R.1
fórmula I.183	B.182	W-R.1
fórmula I.184	B.183	W-R.1
fórmula I.185	B.184	W-R.1
fórmula I.186	B.185	W-R.1
fórmula I.187	B.186	W-R.1
fórmula I.188	B.187	W-R.1
fórmula I.189	B.188	W-R.1
fórmula I.190	B.189	W-R.1
fórmula I.191	B.190	W-R.1
fórmula I.192	B.0	W-R.21
fórmula I.193	B.1	W-R.21
fórmula I.194	B.2	W-R.21
fórmula I.195	B.3	W-R.21
fórmula I.196	B.4	W-R.21
fórmula I.197	B.5	W-R.21
fórmula I.198	B.6	W-R.21
fórmula I.199	B.7	W-R.21
fórmula I.200	B.8	W-R.21
fórmula I.201	B.9	W-R.21
fórmula I.202	B.10	W-R.21
fórmula I.203	B.11	W-R.21
fórmula I.204	B.12	W-R.21
fórmula I.205	B.13	W-R.21
fórmula I.206	B.14	W-R.21
fórmula I.207	B.15	W-R.21
fórmula I.208	B.16	W-R.21
fórmula I.209	B.17	W-R.21
fórmula I.210	B.18	W-R.21

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.211	B.19	W-R.21
fórmula I.212	B.20	W-R.21
fórmula I.213	B.21	W-R.21
fórmula I.214	B.22	W-R.21
fórmula I.215	B.23	W-R.21
fórmula I.216	B.24	W-R.21
fórmula I.217	B.25	W-R.21
fórmula I.218	B.26	W-R.21
fórmula I.219	B.27	W-R.21
fórmula I.220	B.28	W-R.21
fórmula I.221	B.29	W-R.21
fórmula I.222	B.30	W-R.21
fórmula I.223	B.31	W-R.21
fórmula I.224	B.32	W-R.21
fórmula I.225	B.33	W-R.21
fórmula I.226	B.34	W-R.21
fórmula I.227	B.35	W-R.21
fórmula I.228	B.36	W-R.21
fórmula I.229	B.37	W-R.21
fórmula I.230	B.38	W-R.21
fórmula I.231	B.39	W-R.21
fórmula I.232	B.40	W-R.21
fórmula I.233	B.41	W-R.21
fórmula I.234	B.42	W-R.21
fórmula I.235	B.43	W-R.21
fórmula I.236	B.44	W-R.21
fórmula I.237	B.45	W-R.21
fórmula I.238	B.46	W-R.21
fórmula I.239	B.47	W-R.21
fórmula I.240	B.48	W-R.21
fórmula I.241	B.49	W-R.21
fórmula I.242	B.50	W-R.21
fórmula I.243	B.51	W-R.21
fórmula I.244	B.52	W-R.21
fórmula I.245	B.53	W-R.21
fórmula I.246	B.54	W-R.21
fórmula I.247	B.55	W-R.21
fórmula I.248	B.56	W-R.21

237

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.249	B.57	W-R.21
fórmula I.250	B.58	W-R.21
fórmula I.251	B.59	W-R.21
fórmula I.252	B.60	W-R.21
fórmula I.253	B.61	W-R.21
fórmula I.254	B.62	W-R.21
fórmula I.255	B.63	W-R.21
fórmula I.256	B.64	W-R.21
fórmula I.257	B.65	W-R.21
fórmula I.258	B.66	W-R.21
fórmula I.259	B.67	W-R.21
fórmula I.260	B.68	W-R.21
fórmula I.261	B.69	W-R.21
fórmula I.262	B.70	W-R.21
fórmula I.263	B.71	W-R.21
fórmula I.264	B.72	W-R.21
fórmula I.265	B.73	W-R.21
fórmula I.266	B.74	W-R.21
fórmula I.267	B.75	W-R.21
fórmula I.268	B.76	W-R.21
fórmula I.269	B.77	W-R.21
fórmula I.270	B.78	W-R.21
fórmula I.271	B.79	W-R.21
fórmula I.272	B.80	W-R.21
fórmula I.273	B.81	W-R.21
fórmula I.274	B.82	W-R.21
fórmula I.275	B.83	W-R.21
fórmula I.276	B.84	W-R.21
fórmula I.277	B.85	W-R.21
fórmula I.278	B.86	W-R.21
fórmula I.279	B.87	W-R.21
fórmula I.280	B.88	W-R.21
fórmula I.281	B.89	W-R.21
fórmula I.282	B.90	W-R.21
fórmula I.283	B.91	W-R.21
fórmula I.284	B.92	W-R.21
fórmula I.285	B.93	W-R.21
fórmula I.286	B.94	W-R.21

238

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.287	B.95	W-R.21
fórmula I.288	B.96	W-R.21
fórmula I.289	B.97	W-R.21
fórmula I.290	B.98	W-R.21
fórmula I.291	B.99	W-R.21
fórmula I.292	B.100	W-R.21
fórmula I.293	B.101	W-R.21
fórmula I.294	B.102	W-R.21
fórmula I.295	B.103	W-R.21
fórmula I.296	B.104	W-R.21
fórmula I.297	B.105	W-R.21
fórmula I.298	B.106	W-R.21
fórmula I.299	B.107	W-R.21
fórmula I.300	B.108	W-R.21
fórmula I.301	B.109	W-R.21
fórmula I.302	B.110	W-R.21
fórmula I.303	B.111	W-R.21
fórmula I.304	B.112	W-R.21
fórmula I.305	B.113	W-R.21
fórmula I.306	B.114	W-R.21
fórmula I.307	B.115	W-R.21
fórmula I.308	B.116	W-R.21
fórmula I.309	B.117	W-R.21
fórmula I.310	B.118	W-R.21
fórmula I.311	B.119	W-R.21
fórmula I.312	B.120	W-R.21
fórmula I.313	B.121	W-R.21
fórmula I.314	B.122	W-R.21
fórmula I.315	B.123	W-R.21
fórmula I.316	B.124	W-R.21
fórmula I.317	B.125	W-R.21
fórmula I.318	B.126	W-R.21
fórmula I.319	B.127	W-R.21
fórmula I.320	B.128	W-R.21
fórmula I.321	B.129	W-R.21
fórmula I.322	B.130	W-R.21
fórmula I.323	B.131	W-R.21
fórmula I.324	B.132	W-R.21

239

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.325	B.133	W-R.21
fórmula I.326	B.134	W-R.21
fórmula I.327	B.135	W-R.21
fórmula I.328	B.136	W-R.21
fórmula I.329	B.137	W-R.21
fórmula I.330	B.138	W-R.21
fórmula I.331	B.139	W-R.21
fórmula I.332	B.140	W-R.21
fórmula I.333	B.141	W-R.21
fórmula I.334	B.142	W-R.21
fórmula I.335	B.143	W-R.21
fórmula I.336	B.144	W-R.21
fórmula I.337	B.145	W-R.21
fórmula I.338	B.146	W-R.21
fórmula I.339	B.147	W-R.21
fórmula I.340	B.148	W-R.21
fórmula I.341	B.149	W-R.21
fórmula I.342	B.150	W-R.21
fórmula I.343	B.151	W-R.21
fórmula I.344	B.152	W-R.21
fórmula I.345	B.153	W-R.21
fórmula I.346	B.154	W-R.21
fórmula I.347	B.155	W-R.21
fórmula I.348	B.156	W-R.21
fórmula I.349	B.157	W-R.21
fórmula I.350	B.158	W-R.21
fórmula I.351	B.159	W-R.21
fórmula I.352	B.160	W-R.21
fórmula I.353	B.161	W-R.21
fórmula I.354	B.162	W-R.21
fórmula I.355	B.163	W-R.21
fórmula I.356	B.164	W-R.21
fórmula I.357	B.165	W-R.21
fórmula I.358	B.166	W-R.21
fórmula I.359	B.167	W-R.21
fórmula I.360	B.168	W-R.21
fórmula I.361	B.169	W-R.21
fórmula I.362	B.170	W-R.21

240

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.363	B.171	W-R.21
fórmula I.364	B.172	W-R.21
fórmula I.365	B.173	W-R.21
fórmula I.366	B.174	W-R.21
fórmula I.367	B.175	W-R.21
fórmula I.368	B.176	W-R.21
fórmula I.369	B.177	W-R.21
fórmula I.370	B.178	W-R.21
fórmula I.371	B.179	W-R.21
fórmula I.372	B.180	W-R.21
fórmula I.373	B.181	W-R.21
fórmula I.374	B.182	W-R.21
fórmula I.375	B.183	W-R.21
fórmula I.376	B.184	W-R.21
fórmula I.377	B.185	W-R.21
fórmula I.378	B.186	W-R.21
fórmula I.379	B.187	W-R.21
fórmula I.380	B.188	W-R.21
fórmula I.381	B.189	W-R.21
fórmula I.382	B.190	W-R.21
fórmula I.383	B.0	W-R.392
fórmula I.384	B.1	W-R.392
fórmula I.385	B.2	W-R.392
fórmula I.386	B.3	W-R.392
fórmula I.387	B.4	W-R.392
fórmula I.388	B.5	W-R.392
fórmula I.389	B.6	W-R.392
fórmula I.390	B.7	W-R.392
fórmula I.391	B.8	W-R.392
fórmula I.392	B.9	W-R.392
fórmula I.393	B.10	W-R.392
fórmula I.394	B.11	W-R.392
fórmula I.395	B.12	W-R.392
fórmula I.396	B.13	W-R.392
fórmula I.397	B.14	W-R.392
fórmula I.398	B.15	W-R.392
fórmula I.399	B.16	W-R.392
fórmula I.400	B.17	W-R.392

241

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.401	B.18	W-R.392
fórmula I.402	B.19	W-R.392
fórmula I.403	B.20	W-R.392
fórmula I.404	B.21	W-R.392
fórmula I.405	B.22	W-R.392
fórmula I.406	B.23	W-R.392
fórmula I.407	B.24	W-R.392
fórmula I.408	B.25	W-R.392
fórmula I.409	B.26	W-R.392
fórmula I.410	B.27	W-R.392
fórmula I.411	B.28	W-R.392
fórmula I.412	B.29	W-R.392
fórmula I.413	B.30	W-R.392
fórmula I.414	B.31	W-R.392
fórmula I.415	B.32	W-R.392
fórmula I.416	B.33	W-R.392
fórmula I.417	B.34	W-R.392
fórmula I.418	B.35	W-R.392
fórmula I.419	B.36	W-R.392
fórmula I.420	B.37	W-R.392
fórmula I.421	B.38	W-R.392
fórmula I.422	B.39	W-R.392
fórmula I.423	B.40	W-R.392
fórmula I.424	B.41	W-R.392
fórmula I.425	B.42	W-R.392
fórmula I.426	B.43	W-R.392
fórmula I.427	B.44	W-R.392
fórmula I.428	B.45	W-R.392
fórmula I.429	B.46	W-R.392
fórmula I.430	B.47	W-R.392
fórmula I.431	B.48	W-R.392
fórmula I.432	B.49	W-R.392
fórmula I.433	B.50	W-R.392
fórmula I.434	B.51	W-R.392
fórmula I.435	B.52	W-R.392
fórmula I.436	B.53	W-R.392
fórmula I.437	B.54	W-R.392
fórmula I.438	B.55	W-R.392

242

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.439	B.56	W-R.392
fórmula I.440	B.57	W-R.392
fórmula I.441	B.58	W-R.392
fórmula I.442	B.59	W-R.392
fórmula I.443	B.60	W-R.392
fórmula I.444	B.61	W-R.392
fórmula I.445	B.62	W-R.392
fórmula I.446	B.63	W-R.392
fórmula I.447	B.64	W-R.392
fórmula I.448	B.65	W-R.392
fórmula I.449	B.66	W-R.392
fórmula I.450	B.67	W-R.392
fórmula I.451	B.68	W-R.392
fórmula I.452	B.69	W-R.392
fórmula I.453	B.70	W-R.392
fórmula I.454	B.71	W-R.392
fórmula I.455	B.72	W-R.392
fórmula I.456	B.73	W-R.392
fórmula I.457	B.74	W-R.392
fórmula I.458	B.75	W-R.392
fórmula I.459	B.76	W-R.392
fórmula I.460	B.77	W-R.392
fórmula I.461	B.78	W-R.392
fórmula I.462	B.79	W-R.392
fórmula I.463	B.80	W-R.392
fórmula I.464	B.81	W-R.392
fórmula I.465	B.82	W-R.392
fórmula I.466	B.83	W-R.392
fórmula I.467	B.84	W-R.392
fórmula I.468	B.85	W-R.392
fórmula I.469	B.86	W-R.392
fórmula I.470	B.87	W-R.392
fórmula I.471	B.88	W-R.392
fórmula I.472	B.89	W-R.392
fórmula I.473	B.90	W-R.392
fórmula I.474	B.91	W-R.392
fórmula I.475	B.92	W-R.392
fórmula I.476	B.93	W-R.392

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.477	B.94	W-R.392
fórmula I.478	B.95	W-R.392
fórmula I.479	B.96	W-R.392
fórmula I.480	B.97	W-R.392
fórmula I.481	B.98	W-R.392
fórmula I.482	B.99	W-R.392
fórmula I.483	B.100	W-R.392
fórmula I.484	B.101	W-R.392
fórmula I.485	B.102	W-R.392
fórmula I.486	B.103	W-R.392
fórmula I.487	B.104	W-R.392
fórmula I.488	B.105	W-R.392
fórmula I.489	B.106	W-R.392
fórmula I.490	B.107	W-R.392
fórmula I.491	B.108	W-R.392
fórmula I.492	B.109	W-R.392
fórmula I.493	B.110	W-R.392
fórmula I.494	B.111	W-R.392
fórmula I.495	B.112	W-R.392
fórmula I.496	B.113	W-R.392
fórmula I.497	B.114	W-R.392
fórmula I.498	B.115	W-R.392
fórmula I.499	B.116	W-R.392
fórmula I.500	B.117	W-R.392
fórmula I.501	B.118	W-R.392
fórmula I.502	B.119	W-R.392
fórmula I.503	B.120	W-R.392
fórmula I.504	B.121	W-R.392
fórmula I.505	B.122	W-R.392
fórmula I.506	B.123	W-R.392
fórmula I.507	B.124	W-R.392
fórmula I.508	B.125	W-R.392
fórmula I.509	B.126	W-R.392
fórmula I.510	B.127	W-R.392
fórmula I.511	B.128	W-R.392
fórmula I.512	B.129	W-R.392
fórmula I.513	B.130	W-R.392
fórmula I.514	B.131	W-R.392

244

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.515	B.132	W-R.392
fórmula I.516	B.133	W-R.392
fórmula I.517	B.134	W-R.392
fórmula I.518	B.135	W-R.392
fórmula I.519	B.136	W-R.392
fórmula I.520	B.137	W-R.392
fórmula I.521	B.138	W-R.392
fórmula I.522	B.139	W-R.392
fórmula I.523	B.140	W-R.392
fórmula I.524	B.141	W-R.392
fórmula I.525	B.142	W-R.392
fórmula I.526	B.143	W-R.392
fórmula I.527	B.144	W-R.392
fórmula I.528	B.145	W-R.392
fórmula I.529	B.146	W-R.392
fórmula I.530	B.147	W-R.392
fórmula I.531	B.148	W-R.392
fórmula I.532	B.149	W-R.392
fórmula I.533	B.150	W-R.392
fórmula I.534	B.151	W-R.392
fórmula I.535	B.152	W-R.392
fórmula I.536	B.153	W-R.392
fórmula I.537	B.154	W-R.392
fórmula I.538	B.155	W-R.392
fórmula I.539	B.156	W-R.392
fórmula I.540	B.157	W-R.392
fórmula I.541	B.158	W-R.392
fórmula I.542	B.159	W-R.392
fórmula I.543	B.160	W-R.392
fórmula I.544	B.161	W-R.392
fórmula I.545	B.162	W-R.392
fórmula I.546	B.163	W-R.392
fórmula I.547	B.164	W-R.392
fórmula I.548	B.165	W-R.392
fórmula I.549	B.166	W-R.392
fórmula I.550	B.167	W-R.392
fórmula I.551	B.168	W-R.392
fórmula I.552	B.169	W-R.392

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.553	B.170	W-R.392
fórmula I.554	B.171	W-R.392
fórmula I.555	B.172	W-R.392
fórmula I.556	B.173	W-R.392
fórmula I.557	B.174	W-R.392
fórmula I.558	B.175	W-R.392
fórmula I.559	B.176	W-R.392
fórmula I.560	B.177	W-R.392
fórmula I.561	B.178	W-R.392
fórmula I.562	B.179	W-R.392
fórmula I.563	B.180	W-R.392
fórmula I.564	B.181	W-R.392
fórmula I.565	B.182	W-R.392
fórmula I.566	B.183	W-R.392
fórmula I.567	B.184	W-R.392
fórmula I.568	B.185	W-R.392
fórmula I.569	B.186	W-R.392
fórmula I.570	B.187	W-R.392
fórmula I.571	B.188	W-R.392
fórmula I.572	B.189	W-R.392
fórmula I.573	B.190	W-R.392
fórmula I.574	B.0	W-R.405
fórmula I.575	B.1	W-R.405
fórmula I.576	B.2	W-R.405
fórmula I.577	B.3	W-R.405
fórmula I.578	B.4	W-R.405
fórmula I.579	B.5	W-R.405
fórmula I.580	B.6	W-R.405
fórmula I.581	B.7	W-R.405
fórmula I.582	B.8	W-R.405
fórmula I.583	B.9	W-R.405
fórmula I.584	B.10	W-R.405
fórmula I.585	B.11	W-R.405
fórmula I.586	B.12	W-R.405
fórmula I.587	B.13	W-R.405
fórmula I.588	B.14	W-R.405
fórmula I.589	B.15	W-R.405
fórmula I.590	B.16	W-R.405

276

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.591	B.17	W-R.405
fórmula I.592	B.18	W-R.405
fórmula I.593	B.19	W-R.405
fórmula I.594	B.20	W-R.405
fórmula I.595	B.21	W-R.405
fórmula I.596	B.22	W-R.405
fórmula I.597	B.23	W-R.405
fórmula I.598	B.24	W-R.405
fórmula I.599	B.25	W-R.405
fórmula I.600	B.26	W-R.405
fórmula I.601	B.27	W-R.405
fórmula I.602	B.28	W-R.405
fórmula I.603	B.29	W-R.405
fórmula I.604	B.30	W-R.405
fórmula I.605	B.31	W-R.405
fórmula I.606	B.32	W-R.405
fórmula I.607	B.33	W-R.405
fórmula I.608	B.34	W-R.405
fórmula I.609	B.35	W-R.405
fórmula I.610	B.36	W-R.405
fórmula I.611	B.37	W-R.405
fórmula I.612	B.38	W-R.405
fórmula I.613	B.39	W-R.405
fórmula I.614	B.40	W-R.405
fórmula I.615	B.41	W-R.405
fórmula I.616	B.42	W-R.405
fórmula I.617	B.43	W-R.405
fórmula I.618	B.44	W-R.405
fórmula I.619	B.45	W-R.405
fórmula I.620	B.46	W-R.405
fórmula I.621	B.47	W-R.405
fórmula I.622	B.48	W-R.405
fórmula I.623	B.49	W-R.405
fórmula I.624	B.50	W-R.405
fórmula I.625	B.51	W-R.405
fórmula I.626	B.52	W-R.405
fórmula I.627	B.53	W-R.405
fórmula I.628	B.54	W-R.405

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.629	B.55	W-R.405
fórmula I.630	B.56	W-R.405
fórmula I.631	B.57	W-R.405
fórmula I.632	B.58	W-R.405
fórmula I.633	B.59	W-R.405
fórmula I.634	B.60	W-R.405
fórmula I.635	B.61	W-R.405
fórmula I.636	B.62	W-R.405
fórmula I.637	B.63	W-R.405
fórmula I.638	B.64	W-R.405
fórmula I.639	B.65	W-R.405
fórmula I.640	B.66	W-R.405
fórmula I.641	B.67	W-R.405
fórmula I.642	B.68	W-R.405
fórmula I.643	B.69	W-R.405
fórmula I.644	B.70	W-R.405
fórmula I.645	B.71	W-R.405
fórmula I.646	B.72	W-R.405
fórmula I.647	B.73	W-R.405
fórmula I.648	B.74	W-R.405
fórmula I.649	B.75	W-R.405
fórmula I.650	B.76	W-R.405
fórmula I.651	B.77	W-R.405
fórmula I.652	B.78	W-R.405
fórmula I.653	B.79	W-R.405
fórmula I.654	B.80	W-R.405
fórmula I.655	B.81	W-R.405
fórmula I.656	B.82	W-R.405
fórmula I.657	B.83	W-R.405
fórmula I.658	B.84	W-R.405
fórmula I.659	B.85	W-R.405
fórmula I.660	B.86	W-R.405
fórmula I.661	B.87	W-R.405
fórmula I.662	B.88	W-R.405
fórmula I.663	B.89	W-R.405
fórmula I.664	B.90	W-R.405
fórmula I.665	B.91	W-R.405
fórmula I.666	B.92	W-R.405

298

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.667	B.93	W-R.405
fórmula I.668	B.94	W-R.405
fórmula I.669	B.95	W-R.405
fórmula I.670	B.96	W-R.405
fórmula I.671	B.97	W-R.405
fórmula I.672	B.98	W-R.405
fórmula I.673	B.99	W-R.405
fórmula I.674	B.100	W-R.405
fórmula I.675	B.101	W-R.405
fórmula I.676	B.102	W-R.405
fórmula I.677	B.103	W-R.405
fórmula I.678	B.104	W-R.405
fórmula I.679	B.105	W-R.405
fórmula I.680	B.106	W-R.405
fórmula I.681	B.107	W-R.405
fórmula I.682	B.108	W-R.405
fórmula I.683	B.109	W-R.405
fórmula I.684	B.110	W-R.405
fórmula I.685	B.111	W-R.405
fórmula I.686	B.112	W-R.405
fórmula I.687	B.113	W-R.405
fórmula I.688	B.114	W-R.405
fórmula I.689	B.115	W-R.405
fórmula I.690	B.116	W-R.405
fórmula I.691	B.117	W-R.405
fórmula I.692	B.118	W-R.405
fórmula I.693	B.119	W-R.405
fórmula I.694	B.120	W-R.405
fórmula I.695	B.121	W-R.405
fórmula I.696	B.122	W-R.405
fórmula I.697	B.123	W-R.405
fórmula I.698	B.124	W-R.405
fórmula I.699	B.125	W-R.405
fórmula I.700	B.126	W-R.405
fórmula I.701	B.127	W-R.405
fórmula I.702	B.128	W-R.405
fórmula I.703	B.129	W-R.405
fórmula I.704	B.130	W-R.405

249

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.705	B.131	W-R.405
fórmula I.706	B.132	W-R.405
fórmula I.707	B.133	W-R.405
fórmula I.708	B.134	W-R.405
fórmula I.709	B.135	W-R.405
fórmula I.710	B.136	W-R.405
fórmula I.711	B.137	W-R.405
fórmula I.712	B.138	W-R.405
fórmula I.713	B.139	W-R.405
fórmula I.714	B.140	W-R.405
fórmula I.715	B.141	W-R.405
fórmula I.716	B.142	W-R.405
fórmula I.717	B.143	W-R.405
fórmula I.718	B.144	W-R.405
fórmula I.719	B.145	W-R.405
fórmula I.720	B.146	W-R.405
fórmula I.721	B.147	W-R.405
fórmula I.722	B.148	W-R.405
fórmula I.723	B.149	W-R.405
fórmula I.724	B.150	W-R.405
fórmula I.725	B.151	W-R.405
fórmula I.726	B.152	W-R.405
fórmula I.727	B.153	W-R.405
fórmula I.728	B.154	W-R.405
fórmula I.729	B.155	W-R.405
fórmula I.730	B.156	W-R.405
fórmula I.731	B.157	W-R.405
fórmula I.732	B.158	W-R.405
fórmula I.733	B.159	W-R.405
fórmula I.734	B.160	W-R.405
fórmula I.735	B.161	W-R.405
fórmula I.736	B.162	W-R.405
fórmula I.737	B.163	W-R.405
fórmula I.738	B.164	W-R.405
fórmula I.739	B.165	W-R.405
fórmula I.740	B.166	W-R.405
fórmula I.741	B.167	W-R.405
fórmula I.742	B.168	W-R.405

250

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.743	B.169	W-R.405
fórmula I.744	B.170	W-R.405
fórmula I.745	B.171	W-R.405
fórmula I.746	B.172	W-R.405
fórmula I.747	B.173	W-R.405
fórmula I.748	B.174	W-R.405
fórmula I.749	B.175	W-R.405
fórmula I.750	B.176	W-R.405
fórmula I.751	B.177	W-R.405
fórmula I.752	B.178	W-R.405
fórmula I.753	B.179	W-R.405
fórmula I.754	B.180	W-R.405
fórmula I.755	B.181	W-R.405
fórmula I.756	B.182	W-R.405
fórmula I.757	B.183	W-R.405
fórmula I.758	B.184	W-R.405
fórmula I.759	B.185	W-R.405
fórmula I.760	B.186	W-R.405
fórmula I.761	B.187	W-R.405
fórmula I.762	B.188	W-R.405
fórmula I.763	B.189	W-R.405
fórmula I.764	B.190	W-R.405
fórmula I.765	B.0	W-R.418
fórmula I.766	B.1	W-R.418
fórmula I.767	B.2	W-R.418
fórmula I.768	B.3	W-R.418
fórmula I.769	B.4	W-R.418
fórmula I.770	B.5	W-R.418
fórmula I.771	B.6	W-R.418
fórmula I.772	B.7	W-R.418
fórmula I.773	B.8	W-R.418
fórmula I.774	B.9	W-R.418
fórmula I.775	B.10	W-R.418
fórmula I.776	B.11	W-R.418
fórmula I.777	B.12	W-R.418
fórmula I.778	B.13	W-R.418
fórmula I.779	B.14	W-R.418
fórmula I.780	B.15	W-R.418

251

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.781	B.16	W-R.418
fórmula I.782	B.17	W-R.418
fórmula I.783	B.18	W-R.418
fórmula I.784	B.19	W-R.418
fórmula I.785	B.20	W-R.418
fórmula I.786	B.21	W-R.418
fórmula I.787	B.22	W-R.418
fórmula I.788	B.23	W-R.418
fórmula I.789	B.24	W-R.418
fórmula I.790	B.25	W-R.418
fórmula I.791	B.26	W-R.418
fórmula I.792	B.27	W-R.418
fórmula I.793	B.28	W-R.418
fórmula I.794	B.29	W-R.418
fórmula I.795	B.30	W-R.418
fórmula I.796	B.31	W-R.418
fórmula I.797	B.32	W-R.418
fórmula I.798	B.33	W-R.418
fórmula I.799	B.34	W-R.418
fórmula I.800	B.35	W-R.418
fórmula I.801	B.36	W-R.418
fórmula I.802	B.37	W-R.418
fórmula I.803	B.38	W-R.418
fórmula I.804	B.39	W-R.418
fórmula I.805	B.40	W-R.418
fórmula I.806	B.41	W-R.418
fórmula I.807	B.42	W-R.418
fórmula I.808	B.43	W-R.418
fórmula I.809	B.44	W-R.418
fórmula I.810	B.45	W-R.418
fórmula I.811	B.46	W-R.418
fórmula I.812	B.47	W-R.418
fórmula I.813	B.48	W-R.418
fórmula I.814	B.49	W-R.418
fórmula I.815	B.50	W-R.418
fórmula I.816	B.51	W-R.418
fórmula I.817	B.52	W-R.418
fórmula I.818	B.53	W-R.418

252

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.819	B.54	W-R.418
fórmula I.820	B.55	W-R.418
fórmula I.821	B.56	W-R.418
fórmula I.822	B.57	W-R.418
fórmula I.823	B.58	W-R.418
fórmula I.824	B.59	W-R.418
fórmula I.825	B.60	W-R.418
fórmula I.826	B.61	W-R.418
fórmula I.827	B.62	W-R.418
fórmula I.828	B.63	W-R.418
fórmula I.829	B.64	W-R.418
fórmula I.830	B.65	W-R.418
fórmula I.831	B.66	W-R.418
fórmula I.832	B.67	W-R.418
fórmula I.833	B.68	W-R.418
fórmula I.834	B.69	W-R.418
fórmula I.835	B.70	W-R.418
fórmula I.836	B.71	W-R.418
fórmula I.837	B.72	W-R.418
fórmula I.838	B.73	W-R.418
fórmula I.839	B.74	W-R.418
fórmula I.840	B.75	W-R.418
fórmula I.841	B.76	W-R.418
fórmula I.842	B.77	W-R.418
fórmula I.843	B.78	W-R.418
fórmula I.844	B.79	W-R.418
fórmula I.845	B.80	W-R.418
fórmula I.846	B.81	W-R.418
fórmula I.847	B.82	W-R.418
fórmula I.848	B.83	W-R.418
fórmula I.849	B.84	W-R.418
fórmula I.850	B.85	W-R.418
fórmula I.851	B.86	W-R.418
fórmula I.852	B.87	W-R.418
fórmula I.853	B.88	W-R.418
fórmula I.854	B.89	W-R.418
fórmula I.855	B.90	W-R.418
fórmula I.856	B.91	W-R.418

253

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.857	B.92	W-R.418
fórmula I.858	B.93	W-R.418
fórmula I.859	B.94	W-R.418
fórmula I.860	B.95	W-R.418
fórmula I.861	B.96	W-R.418
fórmula I.862	B.97	W-R.418
fórmula I.863	B.98	W-R.418
fórmula I.864	B.99	W-R.418
fórmula I.865	B.100	W-R.418
fórmula I.866	B.101	W-R.418
fórmula I.867	B.102	W-R.418
fórmula I.868	B.103	W-R.418
fórmula I.869	B.104	W-R.418
fórmula I.870	B.105	W-R.418
fórmula I.871	B.106	W-R.418
fórmula I.872	B.107	W-R.418
fórmula I.873	B.108	W-R.418
fórmula I.874	B.109	W-R.418
fórmula I.875	B.110	W-R.418
fórmula I.876	B.111	W-R.418
fórmula I.877	B.112	W-R.418
fórmula I.878	B.113	W-R.418
fórmula I.879	B.114	W-R.418
fórmula I.880	B.115	W-R.418
fórmula I.881	B.116	W-R.418
fórmula I.882	B.117	W-R.418
fórmula I.883	B.118	W-R.418
fórmula I.884	B.119	W-R.418
fórmula I.885	B.120	W-R.418
fórmula I.886	B.121	W-R.418
fórmula I.887	B.122	W-R.418
fórmula I.888	B.123	W-R.418
fórmula I.889	B.124	W-R.418
fórmula I.890	B.125	W-R.418
fórmula I.891	B.126	W-R.418
fórmula I.892	B.127	W-R.418
fórmula I.893	B.128	W-R.418
fórmula I.894	B.129	W-R.418

254

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.895	B.130	W-R.418
fórmula I.896	B.131	W-R.418
fórmula I.897	B.132	W-R.418
fórmula I.898	B.133	W-R.418
fórmula I.899	B.134	W-R.418
fórmula I.900	B.135	W-R.418
fórmula I.901	B.136	W-R.418
fórmula I.902	B.137	W-R.418
fórmula I.903	B.138	W-R.418
fórmula I.904	B.139	W-R.418
fórmula I.905	B.140	W-R.418
fórmula I.906	B.141	W-R.418
fórmula I.907	B.142	W-R.418
fórmula I.908	B.143	W-R.418
fórmula I.909	B.144	W-R.418
fórmula I.910	B.145	W-R.418
fórmula I.911	B.146	W-R.418
fórmula I.912	B.147	W-R.418
fórmula I.913	B.148	W-R.418
fórmula I.914	B.149	W-R.418
fórmula I.915	B.150	W-R.418
fórmula I.916	B.151	W-R.418
fórmula I.917	B.152	W-R.418
fórmula I.918	B.153	W-R.418
fórmula I.919	B.154	W-R.418
fórmula I.920	B.155	W-R.418
fórmula I.921	B.156	W-R.418
fórmula I.922	B.157	W-R.418
fórmula I.923	B.158	W-R.418
fórmula I.924	B.159	W-R.418
fórmula I.925	B.160	W-R.418
fórmula I.926	B.161	W-R.418
fórmula I.927	B.162	W-R.418
fórmula I.928	B.163	W-R.418
fórmula I.929	B.164	W-R.418
fórmula I.930	B.165	W-R.418
fórmula I.931	B.166	W-R.418
fórmula I.932	B.167	W-R.418

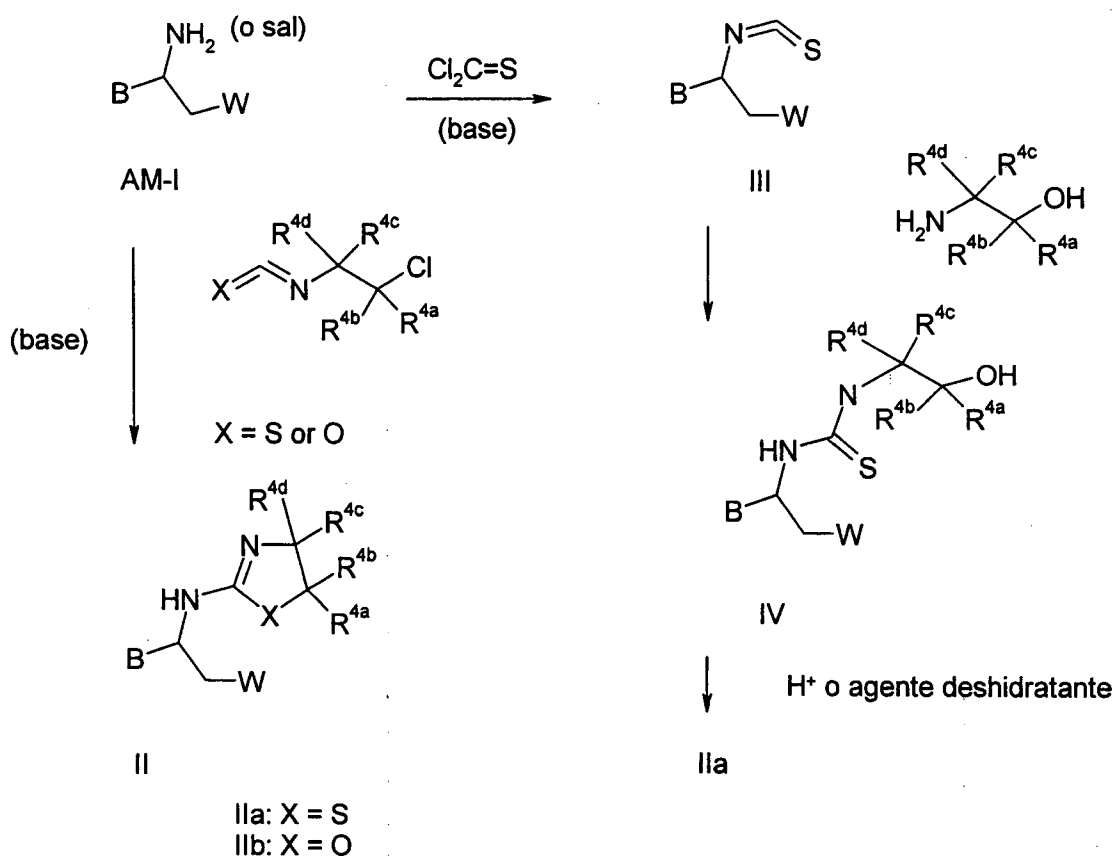
255

Fórmula I	Radical fenilo B	Radical hetarilo W
fórmula I.933	B.168	W-R.418
fórmula I.934	B.169	W-R.418
fórmula I.935	B.170	W-R.418
fórmula I.936	B.171	W-R.418
fórmula I.937	B.172	W-R.418
fórmula I.938	B.173	W-R.418
fórmula I.939	B.174	W-R.418
fórmula I.940	B.175	W-R.418
fórmula I.941	B.176	W-R.418
fórmula I.942	B.177	W-R.418
fórmula I.943	B.178	W-R.418
fórmula I.944	B.179	W-R.418
fórmula I.945	B.180	W-R.418
fórmula I.946	B.181	W-R.418
fórmula I.947	B.182	W-R.418
fórmula I.948	B.183	W-R.418
fórmula I.949	B.184	W-R.418
fórmula I.950	B.185	W-R.418
fórmula I.951	B.186	W-R.418
fórmula I.952	B.187	W-R.418
fórmula I.953	B.188	W-R.418
fórmula I.954	B.189	W-R.418
fórmula I.955	B.190	W-R.418

Los compuestos de la presente invención pueden ser preparados, por ejemplo, partiendo de las correspondientes aminas AM-I valiéndose de la síntesis representada

5 en el siguiente esquema:

256



Según el método representado en el esquema se transforma una amina AM-I en el correspondiente isotiocianato III mediante métodos convencionales, p.ej. haciendo reaccionar AM-I con tiofosgeno (see p.ej. Houben-Weyl, E4, "Methoden der Organischen Chemie", capítulo IIc, pp. 837-842, Georg Thieme Verlag 1983). El isotiocianato III es transformado, entonces, con aminoetanol, dando tiourea IV.

La reacción del aminoetanol con isotiocianato III puede efectuarse de acuerdo con los métodos estándar de la química orgánica, véase al respecto Biosci. Biotech. Biochem. 56 (7), 1062-65 (1992).

Las tioureas IV así obtenidas pueden ser ciclizada mediante métodos convencionales dando el compuesto de tiazolina deseado de la fórmula IIa. La ciclización del

257

compuesto IV puede tener lugar, por ejemplo, bajo catálisis ácida o bajo condiciones deshidratantes, por ejemplo, mediante la reacción de Mitsunobu (véase Tetrahedron Letters 1999, 40, 3125-3128).

- 5 Según el método representado en el esquema se puede transformar una amina AM-I también en azolinas de la fórmula IIa o IIb por reacción con 2-cloroetilisotiocianato ó 2-cloroetilisocianato, tal y como se describe en Bioorg. Med. Chem. Lett. 1994, 4, 2317-22 y ciclización subsiguiente en presencia o ausencia de una base o bajo las condiciones abajo descritas.

10

Aminas tales como AM-I son conocidas al perito o pueden ser preparadas, generalmente, mediante métodos conocidos a un experto en química orgánica y que son bien conocidos en el estado de la técnica, ver p.ej. J. Chinese Chem. Soc. 2003, 50, 109-114, Synthesis 1976, 593-595, J. Med. Chem. 1995, 38, 10, 1600-1607, J.

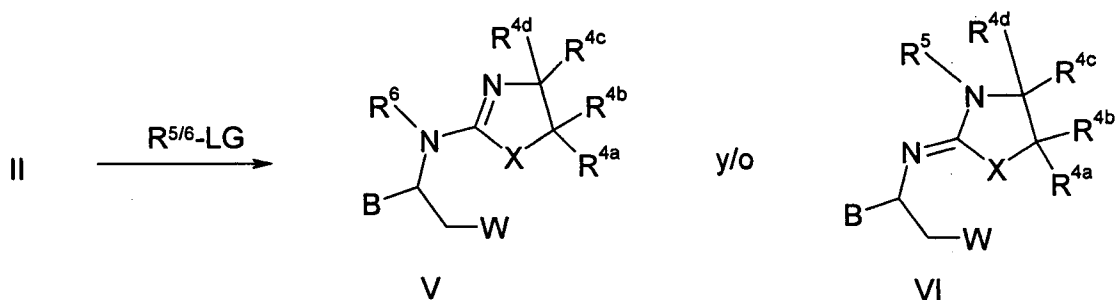
- 15 Org. Chem. 1962, 1970-1972, o, por ejemplo por reducción de precursores adecuados, derivados de la condensación de compuestos apropiados de nitro-metano con aldehídos, tal y como se demuestra abajo (ejemplos de preparación) en analogía a métodos similares descritos, por ejemplo, en J. Am. Chem. Soc. 1934, 1556-1558 o J. Org. Chem. 1956, 1118-1119. Adicionalmente, se pueden obtener las aminas AM-I por
- 20 alquilación de iminas apropiadas e hidrólisis subsiguiente, tal y como se describe abajo (ejemplos de preparación), valiéndose de métodos análogos como los descritos en, p.ej. Tet. Asymm. 1995, 6, 1225-1228. Alternativamente, se pueden transformar las aminas AM-I por adición de reactivos de haluro metilénico de litio o de magnesio, en presencia o ausencia de aditivos de cobre o cinc, en las iminas apropiadas, tal y como

se describe abajo (ejemplos de preparac) valiéndose de métodos similares descritos en, por ejemplo, Org. Lett. 2001, 3, 1841-1844.

2-Cloroetil isotiocianato (CAS-reg.-no.: 6099-88-3) y 2-cloroetilisocianato (CAS-reg.-no.: 1943-83-5) se obtienen en el comercio.

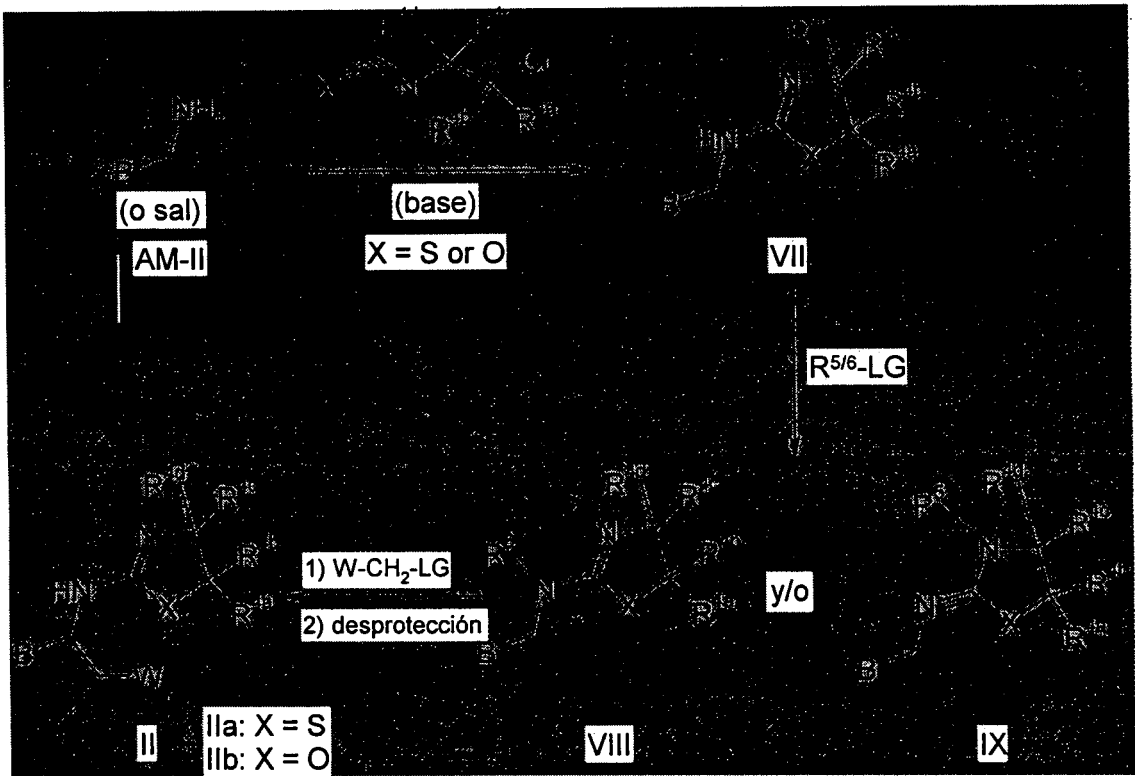
Compuestos de la fórmula general V o VI pueden ser obtenidos por reacción con un electrófilo apropiado, tal y como está representado en el siguiente esquema, por ejemplo, con un agente de alquilación o de acilación $R^{5/6}$ -LG (LG = grupo saliente; p.ej.

Cl, Br, I, OSO_2R , OCO_2R , en donde R es C_1 - C_4 -alquilo), tal y como se describe en la WO 2005063724.



Como otra alternativa, se pueden preparar los compuestos de la presente invención partiendo de aminas AM-II por vía de aminotiazolinas o aminooxazolinas VII. La transformación ulterior con un reactivo de alquilación o acilación $R^{5/6}$ -LG proporciona aminotiazolinas o aminooxazolinas derivatizadas VIII y/o IX. Estas son transformadas subsiguientemente con reactivos heteroaromáticos de halometilo apropiados, tal y como está representado en el siguiente esquema y abajo (ejemplos de preparación):

259



Los significados de los sustituyentes B, W, R^{4a-d}, R⁵ y R⁶ en los esquemas
5 corresponden a las definiciones arriba indicadas.

Pestes

Gracias a su excelente actividad, los compuestos de la fórmula I pueden ser usados
para controlar pestes animales, especialmente, insectos, arácnidos y nemátodos
10 nocivos seleccionados.

Los compuestos de la fórmula I y las composiciones pesticidas que los contienen son
agentes efectivos para controlar pestes animales, seleccionados entre los insectos,
arácnidos y nemátodos. Pestes animales controlados por los compuestos de la
15 fórmula I incluyen, por ejemplo:

- Insectos del orden de los lepidópteros (*Lepidoptera*), por ejemplo, *Agrotis ypsilon*,
Agrotis segetum, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyrestia conjugella*,
Autographa gamma, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*,
Cheimatobia brumata, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis*
5 *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*,
10 *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*,
Lithocolletis blancardella, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*,
Lymantria monacha, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*,
Orgyia pseudotsugata, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*,
Peridroma saucia, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*,
15 *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*,
Rhyacionia frustrana, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis*
pilleriana, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*,
Thaumtopoea pityocampa, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*;
20 *escarabajos (Coleoptera)*, por ejemplo, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes*
obscurus, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*,
Anthonomus pomorum, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*,
Bruchus rufimanus, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida*
nebulosa, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*,
25 *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica*

- longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*,
- 5 *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*,
- 10 dípteros (*Diptera*), por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*,
- 15 *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* y *Tipula*
- 20 *paludosa*,
- trips (*Thysanoptera*), p.ej. *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

262

- himenópteros (*Hymenoptera*), p.ej. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*,
- 5 heterópteros (*Heteroptera*), p.ej.. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* y *Thyanta perditor*,
- 10 homópteros (*Homoptera*), p.ej. *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus*
- 15 *horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes*
- 20 *persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion*
- 25 *avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, y *Viteus*

vitifolii;

termitas (*Isoptera*), p.ej. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* und *Termes natalensis*,

5

ortópteros (*Orthoptera*), p.ej. *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca*

10 *americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*,

aracnoideos, tales como arácnidos (*Acarina*), p.ej. de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, such as *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas*

15 *persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp. such as *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*;

20 *Tarsonemidae* spp. such as *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. such as *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. such as *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *oligonychus pratensis*,

25

sifonápteros, p.ej. *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp ;

- Las composiciones y compuestos de la fórmula I son útiles para controlar nemátodos, especialmente, nemátodos fitoparásitos, tales anquilulas de las raíces, *Meloidogine*
- 5 *hapla*, *Meloidogine incognita*, *Meloidogine javanica*, y otras especies de *Meloidogine*, nemátodos agalladores, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*, nemátodos galígenos, especies de *Anguina*; nemátodos de los tallos y las hojas, especies de *Aphelenchoides*; nemátodos *Sting*, *Belonolaimus*
- 10 *longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*, nemátodos de los pinos, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*, nemátodos anillados, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*, nemátodos del tallo y de los bulbos, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*,
- 15 nemátodos Awl, especies de *Dolichodorus*, nemátodos espirales, *Heliocotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*, nemátodos de las vainas y en forma de vainas, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*, especies de *Hirshmanniella*, nemátodos lanciformes, especies de *Hoploaimus*, anquilulas falsas de las raíces, especies de *Nacobbus*, nemátodos aciculares, *Longidorus elongatus* y
- 20 otras especies de *Longidorus*, nemátodos de los pinos, especies de *Paratylenchus*, nemátodos lesionadores, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvittatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*, nemátodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*, nemátodos reniformes, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*,
- 25 especies de *Scutellonema*, nemátodos trichodorus, *Trichodorus primitivus* y otras

265

especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*, nemátodos del enanismo, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*, nemátodos de los cítricos, especies de *Tylenchulus*, nemátodos daga, especies de *Xiphinema*, y otras especies de nemátodos fitoparásitos.

5

En una modalidad preferida de la invención se usan los compuestos de la fórmula I para el control de insectos o arácnidos, especialmente, insectos del orden de los lepidópteros, coleópteros y homópteros y arácnidos del orden de Acarina. Los compuestos de la fórmula I según la presente invención son especialmente útiles para

10 controlar insectos del orden de los lepidópteros y homópteros.

Formulaciones

Para su uso en el método según la presente invención, los compuestos I pueden ser

15

transformados en las formulaciones usuales, p.ej. soluciones, emulsiones, suspensions, polvos, pastas, granulados y soluciones directamente pulverizables. La forma de aplicación depende del fin respectivo y del método de aplicación. Las formulaciones y métodos de aplicación se eligen de manera, que esté garantizada una distribución fina y uniforme del compuesto compound de la fórmula I según la presente

20

invención.

Por tanto, la invención provee, adicionalmente, p.ej. una composición agrícola para combatir tales plagas animales, que comprende una cantidad de por lo menos un compuesto de la fórmula I o por lo menos una sal útil en la agricultura de I y por lo

25

menos un soporte inerte líquido y/o sólido agronómicamente aceptable, que es

266

suficiente para que tenga un efecto pesticida, y, si se desea, por lo menos un surfactante.

- Tal composición puede contener un solo compuesto activo de la fórmula I, o los
- 5 enantiómeros del mismo o una mezcla de diferentes compuestos activos de la fórmula I según la presente invención. La composición según la presente invención puede comprender un isómero individual o una mezcla de isómeros, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.
- 10 Las formulaciones se preparan de manera conocida (ver al respecto, p.ej. 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 siguientes, 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,
- 15 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 Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry y Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers,
- 20 Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo, diluyendo el compuesto activo con los auxiliares apropiados para la formulación de agroquímicos, tales como disolventes y/o soportes, en caso de desearlo, emulsionantes, surfactantes y dispersantes, agentes de conservación, antiespumantes, anticongelantes, para formulaciones para el tratamiento de semillas, opcionalmente, también colorantes y/o
- 25 vehículos y/o gelificantes.

Como disolventes/sustancias auxiliares son apropiados, p.ej.:

- 5 - agua, disolventes aromáticos (p.ej. productos Solvesso, xileno), parafinas (p.ej. fracciones de petróleo), alcoholes (p.ej. metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (p.ej. ciclohexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (diacetato de glicol), alquil lactatos, lactonas, tales como g-butirolactona, glicoles, amidas de ácido dimetilgraso, ácidos grasos y ésteres grasos, triglicéridos, aceites de origen vegetal o animal y aceites modificados, tales aceites vegetales alquilados.
- Básicamente, se pueden usar también mezclas de disolventes.
- 10 - sustancias soporte, tales como minerales naturales molidos y minerales sintéticos molidos, tales como geles de silicio, ácidos silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, attaclay, caliza, cal, tiza, bol, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, amonio
- 15 fosfato, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, polvos de corteza, de madera y de cáscaras de nueces, polvos de celulosa u otros soportes sólidos.

Emulsionantes apropiados son los emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de polioxietileno-alcohol graso, sulfonatos de alquilo y sulfonatos de arilo).

Ejemplos de dispersantes son lejías residuales sulfíticas y metilcelulosa.

25 Surfactantes apropiados son son las sales de metal alcalino, alcalinotérreo y de amonio del ácido ligninosulfónico, ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido

5 dibutilnaftalinsulfónico, sulfonatos de alquilarilo, sulfatos de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además, condensados de naftalina sulfonada y derivados de naftalina con formaldehído, condensados de naftalina o de ácido naftalinsulfónico con fenol y formaldehído, éter octilfenílico de polioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil-poliglicol éter, triestearilfenil-poliglicol éter, alquilaril poliéter alcohol, condensados de alcohol y de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres alquílicos de polioxietileno, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico de poliglicoléter acetal, ésteres de sorbitol.

10

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

15

Antiespumantes apropiados son, por ejemplo, antiespumantes basados en silicona o estearato de magnesio.

Agentes de conservación apropiados son, por ejemplo, diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

20

Espesantes apropiados son compuestos, que proporcionan a la formulación un comportamiento pseudoplástico, a saber, una alta viscosidad en estado de reposo y una baja viscosidad en estado agitado. En este contexto sean mencionados, por ejemplo, los espesantes comerciales con base en polisacáridos, tales como Xanthan Gum® (Kelzan® de Kelco), Rhodopol® 23 (Rhône Poulenc) o Veegum® (de R.T. Vanderbilt),

25

o filosilisatos orgánicos, tales como Attaclay® (de Engelhardt). Antiespumantes

269

apropiados para las dispersiones según la invención son, por ejemplo, silicona emulsiones (como por ejemplo, Silikon® SRE, Wacker o Rhodorsil® de Rhodia), alcoholes de larga cadena, ácidos grasos, compuestos de flúor orgánicos y mezclas de los mismos. Biocidas pueden ser adicionado para estabilizar las composiciones según la invención contra el ataque por microorganismos. Biocidas apropiados son, por ejemplo, basados en isotiazolonas, tales como los compuestos comercializados bajo las marcas comerciales Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK de Rohm & Haas. Agentes anticongelantes apropiados son los polioles orgánicos, por ejemplo, etilenglicol, propilenglicol o glicerol. Generalmente, se usan en cantidades de, como máximo, 10% en peso, con respecto al peso total de la composición de compuesto activo. De ser apropiado, la composición de compuesto activos según la invención puede comprender 1 a 5% en peso se un tampón, con respecto a la cantidad total de la fórmula preparada, para regular el pH. La cantidad y el tipo de tampón depende de las propiedades químicas del compuesto activo o de los compuestos activos. Ejemplos de tampones son las sales de metal alcalino de ácidos inorgánicos u orgánicos débiles, como por ejemplo, ácido fosfórico, ácido borónico, ácido acético, ácido propiónico, ácido cítrico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico y ácido succínico.

20 Sustancias apropiadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o
dispersiones de aceite directamente pulverizables son: fracciones de aceite mineral de
punto de ebullición mediano hasta elevado, como p.ej. keroseno o aceite diesel,
además, aceites de alquitrán de carbón, y aceites de origen vegetal o animal,
hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, xileno, parafina,
25 tetrahidronaftalina, naftalinas alquiladas y sus derivados, metanol, etanol, propanol,

butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo, N-metilpirrolidona y agua.

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

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

15 Generalmente, las formulaciones contienen entre 0,01 y 95% en peso, preferentemente, entre 0,1 y 90% en peso, de la sustancia activa. En este contexto, se usan las sustancias activas en una pureza de 90% a 100%, preferentemente, 95% a 100% (según el espectro de RNM).

20 Para el tratamiento de las semillas se diluyen las formulaciones en cuestión al doble hasta décuplo, dando concentraciones en sustancia activa de 0,01 a 60% en peso, preferentemente, 0,1 a 40% en peso, en las preparaciones listas para el uso.

El compuesto de la fórmula I puede ser usado como tal, en forma de formulaciones o formas de aplicación preparadas a partir del mismo, por ejemplo, en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones directamente pulverizables, dispersiones de aceite, pastas, productos empolvables, materiales de esparcimiento o granulados, por pulverización, atomización, empolvado, esparcimiento o regado. Las formas de aplicación dependen enteramente de los fines a que están destinados; en todo caso deben garantizar una distribución lo más fina posible de los compuestos activos según la invención.

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

Las concentraciones en ingrediente activo en los productos listos para el uso pueden
20 variar ampliamente. Generalmente, varía de 0,0001 a 10%, preferentemente, de 0,01 a 1% en peso.

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

252

Ejemplos de formulaciones son:

1. Productos para la dilución con agua. Para el tratamiento de semillas, tales productos pueden ser aplicados a las semillas en forma diluida o no diluida:

5

- A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10 partes en peso del compuesto activo son disueltos con 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se agregan humectantes u otros auxiliares. En la dilución con agua se disuelve el sustancia activa. De este modo se obtiene una formulación que contiene 10 % en peso de sustancia activa.

- B Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 70 partes en peso de ciclohexanona, adicionando 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo, polivinilpirrolidona. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión. El contenido en sustancia activa asciende a 20 % en peso

- C Concentrados emulsionables (EC)

20 15 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 75 partes en peso de xileno adicionando dodecibencenosulfonato de Ca y etoxilato de aceite de ricino (cada vez 5 partes en peso). Cuando se diluye con agua se obtiene una emulsión. La formulación contiene 15 % en peso de sustancia activa.

273

D Emulsiones (EW, EO, ES)

25 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 35 partes en peso de xileno adicionando dodecilmecenosulfonato de y etoxilato de aceite de ricino (5 partes en peso, respectivamente). Esta mezcla se introduce mediante una máquina

- 5 emulsionadora (p.ej. Ultraturax) en 30 partes en peso de agua y se transforman en una emulsión estable. Cuando se diluye con agua se obtiene una emulsión. La formulación contiene 25 % en peso de sustancia activa.

E Suspensiones (SC, OD, FS)

- 10 20 partes en peso del compuesto activo se desmenuzan tras adición de 10 partes en peso de dispersante y humectante y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico en un molino de agitador de bola, obteniéndose una suspensión de sustancia activa. Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable del sustancia activa. El contenido en sustancia activa en la formulación asciende a 20 % en peso .

15

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

- 50 partes en peso del compuesto activo se muelen finamente tras adición de 50 partes en peso de dispersante y humectante y se transforman, valiéndose de aparatos técnicos (extrusionadora, torre de pulverización, lecho fluidizado), en granulados
- 20 dispersables o solubles en agua. Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión estable o una solución estable del sustancia activa. La formulación contiene 50 % en peso de sustancia activa.

274

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

75 partes en peso del compuesto activo se muelen tras adición de 25 partes en peso de dispersante y humectante y gel de ácido silícico en un molino de rotor-estator.

Cuando se diluye con agua se obtiene una dispersión estable o una solución estable

- 5 del sustancia activa. El contenido en sustancia activa de la formulación asciende a 75 % en peso.

H Formulaciones de gel

20 partes en peso de un compuesto usado según la invención, 10 partes en peso de

- 10 dispersante, 1 parte en peso de gelificante y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico se muelen en un molino de bolas dando una suspensión fina.

Cuando se diluye con agua se obtiene una suspensión estable con un contenido en sustancia activa de 20% en peso.

15

2. Productos para la aplicación en forma no diluida. Para el tratamiento de semillas se pueden usar tales productos sobre las semillas en forma diluida:

- 20 I) Polvos pulverizables (DP, DS)

5 partes en peso del compuesto activo se muelen finamente y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente particulado. Se obtiene un agente de espolvoreo con 5 % en peso de sustancia activa.

25

275

J) Granulados (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de un compuesto usados según la invención se muelen finamente y se reúnen con 99,5 partes en peso de sustancia soporte. Procedimientos habituales para este fin son extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado. Se obtiene un granulado para la aplicación directa con 0,5 % en peso de sustancia activa.

K Soluciones de volumen ultrabajo (UL)

10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. De este modo se obtiene un producto para la aplicación directa con 10 % en peso de sustancia activa.

15 A los ingredientes activos se pueden adicionar varios tipos de aceite, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, u otros pesticidas o bactericidas, en caso dado, recién antes de la aplicación (mezcla de tanque). Estos agentes pueden ser mezclados con los agentes según la invención en una relación ponderal de 1:100 hasta 100:1, preferentemente, de 1:10 hasta 10:1.

20 Los compuestos y composiciones de compuestos I de la presente invención pueden ser aplicados con otros ingredientes activos, por ejemplo, por ejemplo, otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas, fertilizantes, tales como amonio nitrato, urea, potasio, y superfosfato, agentes fitotóxicos y reguladores del crecimiento, safeners y nematocidas. Estos ingredientes adicionales pueden ser usados secuencialmente o en combinación con las

25 composiciones arriba descritas, en caso dado, también se puede agregarlos

276

inmediatamente antes del uso (mezcla de tanque). Por ejemplo, la(s) planta(s) pueden ser pulverizadas con una composición de la presente invención antes o después de haber sido tratados con otros ingredientes activos.

- 5 Estos agentes adicionales pueden ser mezclados con los agente usados según la invención en una relación ponderal de 1:10 hasta 10:1. Cuando se mezclan los compuestos I o las composiciones que los contienen en su forma de aplicación como pesticidas con otros pesticidas, se alcanza en muchos casos un espectro de acción pesticida más amplio.

10

La siguiente lista M de pesticidas con las que se pueden usar los compuestos según la invención y con las cuales se pueden producir efectos sinérgicos, es ilustrativa de las combinaciones posibles, pero no debe entenderse como limitativa a estas combinaciones:

15

M.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, acinfos-metilo, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinfos, diacinona, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotona, etiona, fenitrotiona, fentiona, isoxationa, malationa, metamidofos, metidationa, metil-parationa, mevinfos, monocrotofos, oxidemeton-metilo, paraoxona, parationa, fenthioate,

- 20 fosalone, fosmet, fosfamidona, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfona;

M.2. Carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb,

- 25 propoxur, tiodicarb, triazamato;

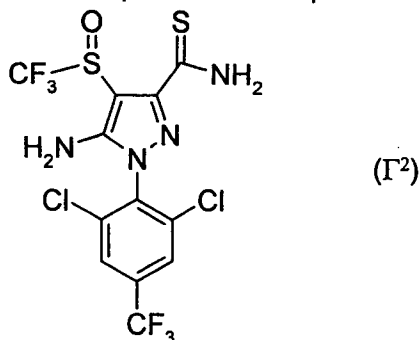
277

- M.3. Piretroides: alletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alpha-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, pralletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofen, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina;

- M.4. Reguladores del crecimiento: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloخورona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, teflubenzurona, triflumurona; buprofezina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clofentacina; b) antagonistas de ecdysone: halofenozida, metoxifenoza, tebufenozida, azadirachtina; c) juvenoides: piriproxifeno, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis lípida: espiroclodifeno, espiromesifeno, espirotetramato;

- M.5. Compuestos agonistas/antagonistas de receptores nicotínicos: clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprida, tiacloprida y AKD-1022;

- M.6. Compuestos antagonistas de GABA: acetoprol, endosulfano, etiprol, fipronilo, vaniliprol, pirafluprol, piriprol, el compuesto de fenilpirazol de la fórmula I²



278

M.7. Insecticidas macrocíclicas de lactona: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad

M.8. Compuestos METI I: fenazaquin, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim;

5

M.9 Compuestos. METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnona;

M.10. Compuestos desacopladores: clorfenapir;

10 M.11. Compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa: cihexatina, diafentiurona, óxido de fenbutatina, propargito;

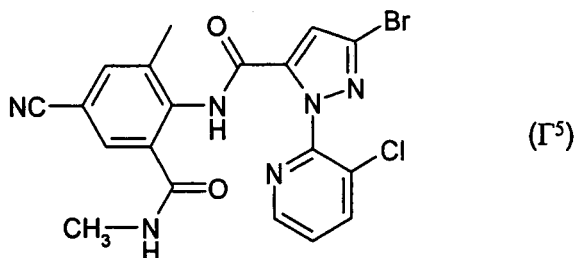
M.12. Compuestos disruptores del enmohecimiento: ciromacina;

15 M.13. Compuestos inhibidores de oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;

M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio, metaflumizona;

20 M.15. Varios: benclofiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, flubendiamida, cienopirafeno, flupirazofos, ciflumetofeno, amidoflumet, N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-propanecarboxamido-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamido-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, compuestos de antranilamida de la fórmula I⁵

279



- y compuestos de malononitrilo, tal y como se describen en la JP 2002 284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, JP 2004 99597, WO 05/68423, WO 05/68432, o WO 05/63694, especialmente, los compuestos de
- 5 malononitrilo $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$.
- 10 Los compuestos que se obtienen en el comercio del grupo M pueden desprenderse de The Pesticide Manual, 13ª Edición British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones. Tioamidas de la fórmula I² y su obtención se describen en la WO 98/28279. Lepimectiona es conocida de Agro Project, PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. Bencloctiaz y su obtención se describen en la EP-A1 454621. Metidationa y
- 15 paraoxona y su obtención se describen en Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoproles y su preparación se describen en WO 98/28277. Metaflumizona y su preparación se describen en EP-A1 462 456. Flupirazofos se describe en Pesticide Science 54, 1988, p.237-243 y en US 4822779. Pirafluproles y su preparación se describen en JP 2002193709 y en WO 01/00614.
- 20 Piriproles y su preparación se describen en WO 98/45274 y en US 6335357. Amidoflumet y su preparación se describen en US 6221890 y en JP 21010907. Flufenerim y su preparación se describen en WO 03/007717 y en WO 03/007718.

220

Ciflumetofeno y su preparación se describen en WO 04/080180. Los compuestos de aminoquinazolinona de la fórmula I⁴ se describen en la EP A 109 7932.

Antranilamidas de la fórmula I⁵ y su preparación se describen en la WO 01/70671; WO 02/48137; WO 03/24222, WO 03/15518, WO 04/67528; WO 04/33468; y WO

- 5 05/118552. Los compuestos de malononitrilo $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ se describen en la WO 05/63694.

10

Componentes de mezcla fungicida son aquellos seleccionados del grupo F, que comprende:

F.1 acilalaninas, tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo;

- 15 F.2 derivados de amina, tales como aldimorf, dodine, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, espiroxamin, tridemorf;

F.3 anilino pirimidines, tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo;

F.4 antibióticos, tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomycin;

- 20 F.5 azoles, tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, myclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol;

F.6 dicarboximidas, tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina;

281

F.7 ditiocarbamatos, tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb;

F.8 compuestos heterocíclicos, tales como anilacina, benomilo, boscalida, carbendazim, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona,

- 5 fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprothiolano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifuluzamid, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina;

F.9 fungicidas de cobre, tales como caldo de Burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico;

- 10 F.10 derivados de nitrofenilo, tales como binapacril, dinocap, dinobutona, nitroftalisopropilo;

F.11 fenilpirroles, tales como fenpiclonilo o fludioxonilo;

F.12 estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina o trifloxistrobina;

- 15 F.13 derivados de ácido sulfénico, tales como captafol, captan, diclofluanida, folpet, toliifluanida;

F.14 amidas de ácido cinámico y análogos, tales como dimetomorf, flumetover o flumorf;

- F.15 azufre, y otros fungicidas, tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, 20 carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida cimoxanilo, dazomet, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentin-acetato, fenoxanilo, ferimzona, fluacinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamida.

282

Aplicaciones

Los pestes animales, a saber, los insectos, arácnidos y nemátodos, las plantas, el suelo o el agua donde la planta crece pueden ser contactados con el/los presentes compuesto(s) o composición(iones), que los contienen mediante cualquier método conocido en la técnica. En este sentido, "contactar" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre los pestes y/o plantas – típicamente, sobre las hojas, el tallo o los raíces de la planta) como también el contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones sobre el locus de los pestes y/o plantas).

Los compuestos de la fórmula I o las composiciones pesticidas que los contienen pueden ser usados para proteger plantas en crecimiento y cultivos frente al ataque o la infestación por pestes animales, especialmente, insectos, acáridos o arácnidos, contactando la planta/el cultivo con una cantidad efectiva pesticida de compuestos de la fórmula I. El término "cultivo" se refiere tanto a cultivo en crecimiento como a cultivos cosechados.

Además, los pestes animales pueden ser controlados contactando el peste objetivo, su suministro de comida, habitat, área de cría o su locus con una cantidad efectiva pesticida de compuestos de la fórmula I. La aplicación puede tener lugar antes o después de la infección del locus, de los cultivos en crecimiento o de los cultivos cosechados.

Los compuestos de la invención también pueden ser aplicados preventivamente sobre lugares donde se cuenta con la presencia de los pestes.

- Los compuestos de la fórmula I pueden usarse también para proteger plantas en
- 5 crecimiento frente al ataque o la infestación por pestes, contactando la planta con una cantidad efectiva pesticida de compuestos de la fórmula I. En este sentido, "contactar" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre los pestes y/o plantas – típicamente, sobre las hojas, el tallo o los raíces de la planta) como también el contacto indirecto (aplicando los
- 10 compuestos/composiciones sobre el locus de los pestes y/o plantas).

"Locus" significa a habitat, sitio de incubación, planta, semillas, el suelo, área, material o medio ambiente donde un peste o parásito crece o puede crecer.

- 15 Generalmente, "cantidad efectiva pesticida " significa la cantidad en ingrediente activo necesario para alcanzar un efecto notable sobre el crecimiento, inclusive efectos de necrosis, muerte, retardación, prevención y eliminación, destrucción u otro método de reducir la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva pesticida puede variar para los diferentes compuestos/composiciones usadas en la invención.
- 20 Una cantidad efectiva pesticida de las composiciones también puede variar según la condiciones que prevalecen, como p.ej. el efecto pesticida deseado y la duración, el tiempo, las especies objetivo, el locus, modo de aplicación, etc.

284

Los compuestos de la fórmula I actúan tanto por contacto (por vía del el suelo, vidrio, pared, red de cama, alfombra, partes de planta o partes del animal), e ingestión (cebo o parte de planta).

- 5 Cuando se usan contra hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos o cucarachas, los compuestos de la fórmula I se usan, preferentemente, en una composición de cebo.

- El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (p.ej. un gel). Cebos
- 10 sólidos pueden confeccionarse en diferentes diseños y formas apropiadas para la respectiva aplicación, p.ej. granulados, bloques, barritas, discos. Cebos líquidos pueden llenarse en diferentes recipientes para asegurar una aplicación apropiada, recipientes abiertos, dispositivos de pulverización, dispositivos de goteo o fuentes de evaporación. Geles pueden tener una matriz acuosa o oleica y pueden ser formulados
- 15 de acuerdo con las necesidades en cuanto a pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

- El cebo usado en la composición es un producto, que es suficientemente atractivo para inducir a insectos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos,
- 20 grillos, etc. o cucarachas a comerlo. La atractividad puede ser manipulada usando estimulantes de comida o feromonas sexuales. Estimulantes de comida se escogen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (partes de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas o aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente, de
- 25 sucrosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o aún melasas o miel.

Partes frescas o picadas de frutas, plantas de cultivo, plantas, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir de estimulantes de comida. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas según el insecto respectivo.

Feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas al perito.

5

Formulaciones de compuestos de la fórmula I, tales como aerosoles (p.ej. en latas de esprays), esprays de aceite o esprays de bombeo son sumamente apropiados para el usuario no profesional para controlar pestes, tales como pulgas, moscas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Recetas de aerosol se componen, preferentemente, del

- 10 principio activo, disolventes, tales como alcoholes inferiores (p.ej. metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (p.ej. acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (p.ej. kerosenos), que tienen un intervalo de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno, agua, además, auxiliares, tales como
- 15 emulsionantes, tales como sorbitol monooleato, oleil etoxilato, que contienen 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume, tales como aceites esenciales, ésteres de ácidos grasos medianos con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromáticos, en caso dado, estabilizantes, tales como sodio benzoato, tensoactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, de ser
- 20 necesario, impelentes, tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, éter dimetílico, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de esprays de aceite difieren de las recetas de aerosol, en que no se usan impelentes.

25

286

Los compuestos de la fórmula I y sus respectivas composiciones pueden ser usadas también en serpentines para mosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, platos de vaporizador, vaporizadores de largo plazo y también en papeles antipolilla, almohadillas antipolilla u otros sistemas de vaporización independientes del calor.

5

Métodos de controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (p.ej.

malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática, y leishmaniasis) con compuestos de la fórmula I y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento se superficies de cabañas y casas, pulverización del aire e impregnación de cortinas,

10

tiendas de campaña, indumentaria, redes de cama, trampas para moscas tsetse, etc.

Composiciones insecticidas a ser aplicadas sobre fibras, telas, tricotados, no tejidos, a materiales para redes o láminas y lonas comprenden, preferentemente, una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente, un repelente y por lo menos un aglutinante.

Repelentes apropiados son, por ejemplo, N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-

15

dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, ácido (2-hidroximetilciclohexil)-acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona,

metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para el control de insectos, p.ej

{{(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado de o idénticos con extractos vegetales, tales como limoneno,

20

eugenol, (+)-eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos vegetales crudos de

plantas, tales como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogan martinii,

Cymbopogan citratus (lemon grass), Cymopogan nartdus (citronella). Aglutinantes apropiados son seleccionados, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como tales como acetato de vinilo y versatato de

25

vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo,

287

acrilato de 2-etilhexilo, y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y di-etilénicamente insaturados, tales como estireno y dienos alifáticos, como p.ej. butadieno.

- La impregnación de cortinas y redes de cama se realiza, generalmente, sumergiendo
- 5 el material textil en una emulsión o dispersión del insecticida o pulverizando las redes.

- Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones pueden ser usados para la protección de materiales de madera, tales como árboles, estacadas, coches dormitorio, etc. y edificios, tales como casas, excusados exteriores, fábricas, but también
- 10 materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cables eléctricos y cables etc. frente a hormigas y/o termitas, y para el control de hormigas y termitas, que causan daño en plantas de cultivo o seres humanos (p.ej. cuando los pestes invaden la casa y las localidades públicas). Los compuestos de la fórmula I se aplican no solamente sobre el área de superficie alrededor o en el suelo debajo de
- 15 materiales de madera para su protección, sino también pueden ser aplicados sobre los artículos de madera, como p.ej superficies del subsuelo de hormigón, columnas de nichos, barras, madera contrachapeada, muebles, etc., artículos de madera, tales como tableros de virutas, semichapas, etc. y artículos de vinilo, tales como cables eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, materiales termoaislantes, tales como
- 20 espumas de estireno, etc. Cuando se aplican contra hormigas que causan daño a plantas de cultivo o seres humanos, el agente de control de hormiga de la presente invención se aplica sobre las plantas de cultivo o el suelo alrededor de las mismas, o se aplica directamente sobre el nido de las hormigas o similares.

En caso de un tratamiento del suelo o en la aplicación sobre los lugares donde viven los pestes o el nido, los ingredientes activos se aplican en cantidades de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferentemente, de 0,001 a 20 g por 100 m².

- 5 Cantidades de aplicación usuales para la protección de materiales varían, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, preferentemente, de 0,1 g a 50 g por m².

- 10 Composiciones insecticidas a ser usadas en la impregnación de materiales contienen, típicamente, de 0,001 a 95% en peso, preferentemente, de 0,1 a 45% en peso, y más preferentemente, de 1 a 25% en peso de por lo menos un repelente y / o insecticida

- 15 En composiciones de cebo asciende el contenido en ingrediente activo típico a 0,001% en peso hasta 15% en peso, preferentemente, a 0,001% en peso hasta 5% en peso de compuesto activo.

- 20 En composiciones de espray asciende el contenido en ingrediente activo a 0,001 hasta 80% en peso, preferentemente, a 0,01 hasta 50% en peso y más preferentemente, a 0,01 hasta 15% en peso.

Para el tratamiento de plantas de cultivo varía la cantidad de aplicación en ingrediente activo de la presente invención de 0,1 g a 4000 g por hectárea, preferentemente, de 25 g a 600 g por hectárea, más preferentemente, de 50 g a 500 g por hectárea.

289

Tratamiento de semillas

Los compuestos de la fórmula I también son apropiados para el tratamiento de semillas para protegerlas frente a pestes de insectos, especialmente, frente a pestes de insectos que viven en el suelo y para proteger las resultantes raíces y vástagos de las plantas y frente a pestes del suelo e insectos foliares.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para la protección de semillas frente a pestes de suelo y las resultantes raíces y vástagos de las plantas frente a pestes del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las resultantes raíces y vástagos de las plantas. Es especialmente preferida la protección de los resultantes vástagos frente a insectos perforadores y chupadores, siendo especialmente preferida la protección frente a pulgones.

Por tanto, la presente invención comprende un método para la protección de semillas frente a insectos, especialmente, insectos de suelo y las raíces y vástagos de las plántulas, especialmente, frente a insectos del suelo, cuyo método consiste en contactar las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la fórmula general I o una sal del mismo. Es especialmente preferido un método, en el que se protegen las raíces y vástagos de la planta, sobre todo, un método en el que se protegen los vástagos de la planta frente a insectos perforadores y chupadores, especialmente un método, en que se protegen los vástagos de las plantas frente a pulgones.

El término "semilla" comprende semillas y productos de propagación de cualquier tipo, inclusive pero no limitado a semillas verdaderas, partes de semillas, retoños, bulbos, frutos, tubérculos, granos, recortes, vástagos cortados, etc y se refiere en una modalidad preferida a semillas verdaderas.

5

El término "tratamiento de semillas" comprende todas las técnicas conocidas del estado de la técnica para el tratamiento de semillas, tales como desinfección, recubrimiento, empolvado y pelletizado de semillas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

10

El término "recubierto con o que contienen" significa, generalmente, que el ingrediente activo se encuentra, mayormente en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación.

15

Cuando dicho producto de propagación es (re)plantado, entonces puede absorber el ingrediente activo.

Semillas apropiadas son las semillas de cereales, raíces comestibles, plantas oleaginosas, verduras, especies, plantas ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo duro y otro tipo de trigo, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz dulce y maíz de campo), soja, plantas oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, nabo, remolacha de azúcar, remolacha forrajera, berenjenas, papas, pasto, césped, pasto forrajero, tomates, puerro, calabazas, repollo, lechuga iceberg, pimientos, pepinos, melones, especies de Brassica, frijoles, alverjas, apio, cebollas,

25

zanahorias, plantas tuberosas, tales como papas, caña de azúcar, tabaco, vid, petunias, geranio/pelargonio, pensamientos y bálsamo.

- Adicionalmente, el compuesto activo puede ser usado para el tratamiento de semillas
- 5 de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas debido a métodos de cultivo, inclúyase métodos de tecnología genética.

- Por ejemplo, el compuesto activo puede ser usado en el tratamiento de semillas de plantas que son resistentes a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, imidazolinonas,
- 10 glufosinato-amonio o glifosato-isopropilamonio y sustancias activas análogas (ver, por ejemplo, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EP-A-0257993, U.S. Pat. No. 5,013,659) o en plantas transgénicas, por ejemplo, algodón, que son capaces de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt), que hacen que las plantas sean resistentes a ciertas plagas (EP-A-0142924, EP-A-0193259).

15

- Además, el compuesto activo puede ser usado también para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas, en comparación con plantas existentes, cuyas modificaciones pueden ser generadas, por ejemplo, mediante métodos de cultivo tradicionales y/o la generación de mutantes o procedimientos de
- 20 recombinación. Por ejemplo, se han descrito algunos casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el fin de modificar el almidón sintetizado en las plantas (p.ej., WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivo transgénicas con una composición modificada de ácido graso (WO 91/13972).

El compuesto activo se aplica sobre las semillas mediante pulverización o empolvado de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la emergencia de las plantas.

5 Composiciones especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, por ejemplo:

A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

E Suspensiones (SC, OD, FS)

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

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

H Formulaciones de gel (GF)

I Polvos pulverizables (DP, DS)

15 Formulaciones convencionales para el tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para el tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para el tratamiento de suspensiones WS, polvos solubles en agua SS y emulsiones ES y EC. La aplicación sobre las semillas se realiza antes de la siembra, o bien directamente sobre las semillas o después de que éstas hayan
20 pregerminado.

En una modalidad preferida se usa una formulación FS. Típicamente, una formulación FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de surfactante, 0 to 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 15 g/l de un pigmento
25 y hasta un litro de un disolvente, preferentemente, agua.

293

Formulaciones FS especialmente preferidas de los compuestos de la fórmula I para el tratamiento de semillas comprenden de 0,1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0,1 a 20 % en peso (1 a 200 g/l) de por lo menos un surfactante, p.ej. 0,05 a 5 % en peso de un humectante y de 0,5 a 15 % en peso de un dispersante, hasta 20 % en peso, p.ej. de 5 a 20 % de un anticongelante, de 0 a 15 % en peso, p.ej. 1 a 15 % en peso de un pigmento y/o colorante, de 0 a 40 % en peso, p.ej. 1 a 40 % en peso de un aglutinante (pegante /adhesivo), opcionalmente, hasta 5 % en peso, p.ej. de 0,1 a 5 % en peso de un espesante, opcionalmente, de 0,1 a 2 % de un antiespumante y, opcionalmente, un agente de conservación, como p.ej. un biocida, antioxidante o similar, p.ej. en una cantidad de 0,1 a 1 % en peso y una carga/vehículo ad 100 % en peso.

Formulaciones para el tratamiento de semillas pueden contener, adicionalmente, aglutinantes y colorantes.

15

Aglutinantes pueden ser adicionados para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Aglutinantes apropiados son surfactantes de copolímeros de bloques de óxido de etileno/óxido de propileno, pero también alcoholes polivinílicos, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos y copolímeros derivados de estos polímeros.

20

Opcionalmente, se pueden incluir colorantes en la formulación. Colorantes o materias colorantes apropiados para formulaciones de tratamiento de semillas son: Rhodamin

25

299

B, C.I. pigment red 112, C.I. solvent red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

Un gelificante apropiado es, por ejemplo, carragaen (Satiagel®).

10

En el tratamiento de las semillas se suelen aplicar los compuestos I en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas, preferentemente, de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, muy preferentemente, de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas y especialmente, de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas.

15

Por tanto, la invención se refiere a semillas, que comprenden un compuesto de la fórmula I, o una sal aceptable en la agricultura de I, tal y como se define en la presente. La cantidad del compuesto I o de la sal útil en la agricultura de I, generalmente, varía de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas, preferentemente, de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, especialmente, de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas. Para determinados cultivos, por ejemplo, lechuga, la cantidad de aplicación puede ser más alta.

20

Salud animal

25

295

Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos también son apropiados, especialmente, para combatir parásitos en y sobre animales.

- 5 Por tanto, un objeto de la presente invención es proveer nuevos métodos para controlar parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proveer pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención es proveer pesticidas para animales, que pueden ser usados en dosis más bajas que los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proveer pesticidas para
- 10 animales que proporcionan un largo control residual de parásitos.

- La invención también se refiere a composiciones, que contienen una cantidad efectiva antiparasitaria compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y un soporte aceptable, para combatir parásitos en y sobre
- 15 animales.

- La presente invención también provee un método para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación y infección por parásitos, que comprende administrar oral, tópica o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad efectiva
- 20 antiparasitaria de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composition que la contiene.

- La invención también provee un procedimiento para la obtención de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección
- 25 por parásitos, que comprende una cantidad efectiva antiparasitaria de un compuesto

296

de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composition que la contiene.

Que los compuestos sean activos contra pestes agrícolas no quiere decir

- 5 necesariamente que sean apropiados para controlar endo- y ectoparásitos en y sobre animales, lo que requiere, por ejemplo, dosis bajas, no eméticas en el caso de una aplicación oral., compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.

- 10 Sorprendentemente, se ha encontrado, que los compuestos de la fórmula I son apropiados para combatir endo- y ectoparásitos en y sobre animales.

- Compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones, que comprenden los mismos, se usan, preferentemente,
- 15 para controlar y prevenir infestaciones y infecciones en animales, inclusive animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Por ejemplo, son apropiados para controlar y prevenir infestaciones y infecciones en mamales, tales como ganado bovino y vacuno, ganado ovino, cerdos, camellos, venado, caballos, puercos, aves, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, monos, caza mayor y reno y también
- 20 en animales de piel, tales como visones, chinchillas y oso lavador, aves, tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces, tales como peces de agua dulce y de agua salada, tales como truchas, carpas y anguilas.

- Compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de
- 25 los mismos y composiciones que comprenden los mismos se usan, preferentemente,

2917

para controlar y prevenir infestaciones y infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

Infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no están limitadas a piojos, piojos picadores, garrapatas, tábano nasal, melófago, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas miásicas voladores, niguas, culícidos, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que comprenden los mismos son apropiados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o endoparásitos. Son activos en todos o algunos estadios de desarrollo.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

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

cucarachas (Blattaria - Blattodea), p.ej. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

25

- moscas, mosquitos (dípteros), p.ej. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*,
Anastrepha ludens, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles*
albimanus, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*,
5 *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Callifora vicina*, *Chrysomya*
bezziana, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*,
Chrysops silacea, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia*
anthropophaga, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex*
quinquefasciatus, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia*
hominis, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina*
10 *palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina taquinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis*
equestris, *Hippelates spp.*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*,
Lucilia cuprina, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia spp.*, *Musca domestica*,
Muscina stabulans, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorofora columbiae*,
Psorofora discolor, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga*
15 *sp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*,
Tabanus lineola, y *Tabanus similis*,
- piojos (ftirápteros), p.ej. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*,
Pthirus pubis, *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*,
20 *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.

garrapatas y pulgones parasíticos (parasitiformes): garrapatas (Ixodida), p.ej. *Ixodes*
scapularis, *Ixodes holociclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*,
Dermacentor andersoni, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*,

Ambryomma maculatum, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y parasitic mites (Mesostigmata), p.ej. *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

actínidos (Prostigmata) y acáridos (Astigmata) p.ej. *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp.,

- 5 *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listroforus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Citodites* spp., y *Laminosioptes* spp,

- 10 chinches (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*,

Anoplurida, p.ej. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., y *Solenopotes* spp,

15

Mallophagida (subórdenes de Amblycerina y Ischnocerina), p.ej. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,

- 20 nemátodo ascárido:

gusanos látigo y Triquinosis (Trichosyringida), p.ej. Trichinellidae (*Trichinella* spp.), (Trichuridae) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,

- 25 Rhabditida, p.ej. *Rhabditis* spp., *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

Strongylida, p.ej. *Strongylus* spp., *Ancilostoma* spp., *Necator americanus*,
Bunostomum spp. (Hookworm), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*,
Ostertagia spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Ciathostoma*
spp., *Oesophagostomum* spp., *Etapahanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp.,

- 5 *Etapahanurus dentatus*, *Singamus trachea*, *Ancilostoma* spp., *Uncinaria* spp.,
Globocephalus spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*,
Protostrongylus spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelafostongylus* spp. *Aleurostrongylus*
abstrusus, y *Dioctophyma renale*,

- 10 ascáridos intestinales (Ascaridida), p.ej. *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia*
galli, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*,
Toxascaris leonine, *Skrjabinema* spp., y *Oxyuris equi*,

Camallanida, p.ej. *Dracunculus medinensis* (gusano de guineo)

15

Spirurida, p.ej. *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari*
spp.a, *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeofora* spp., *Espirocerca lupi*, y *Habronema*
spp.,

- 20 gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), p.ej. *Acanthocephalus* spp.,
Macracanthorhynchus hirudinaceus y *Oncicola* spp,

planarias (Plathelminthes):

301

trematodos (Trematoda), p.ej. *Faciola spp.*, *Fascioloides magna*, *Paragonimus spp.*,
Dicrocoelium spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma spp.*,
Trichobilharzia spp., *Alaria alata*, *Paragonimus spp.*, y *Nanocietes spp.*

- 5 Cercomeromorfa, especialmente, Cestoda (Tapeworms), p.ej. *Diphyllbothrium spp.*,
Tenia spp., *Equinococcus spp.*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps spp.*, *Hymenolepis spp.*,
Mesocestoides spp., *Vampirolepis spp.*, *Moniezia spp.*, *Anoplocephala spp.*, *Sirometra*
spp., *Anoplocephala spp.*, y *Hymenolepis spp.*

- 10 Los compuestos de la fórmula I y las composiciones, que contienen los mismos son
especialmente útiles para controlar pestes del orden de los dípteros, sifonápteros e
ixódidos.

Además, se prefiere, especialmente, usar los compuestos de la fórmula I y las

- 15 composiciones, que contienen los mismos para combatir mosquitos.

El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones, que contienen los
mismos para combatir moscas es otra modalidad preferida de la presente invención.

- 20 Además, es especialmente preferido usar los compuestos de la fórmula I y las
composiciones, que contienen los mismos para combatir moscas.

El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones, que contienen los
mismos para combatir garrapatas es otra modalidad preferida de la presente

- 25 invención.

Los compuestos de la fórmula I también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (nemátodos ascáridos, gusanos de cabeza espinosa y planarias).

La administración se puede efectuar tanto profilácticamente como terapéuticamente.

5

Los compuestos activos son administrados directamente o en forma de una preparación apropiada oral tópica/dermal o parenteral.

10 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la fórmula I pueden ser formuladas como alimentos animales, premezclas de alimentos animales, concentrados de alimentos animales, comprimidos, soluciones, pastas, suspensiones, enjuagües, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Adicionalmente, los compuestos de la fórmula I pueden ser administrados a los animales en su agua de beber. Para la administración oral, la forma de dosificación escogida debe ser tal, que

15 el animal reciba 0,01 mg/kg a 100 mg/kg por peso del animal por día del compuesto de la fórmula I, preferentemente, 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por peso del animal por día de la mezcla.

20 Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden ser administrados a los animales parenteralmente, por ejemplo, por inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula I pueden ser dispersados o disueltos en un soporte fisiológicamente aceptable para la inyección subcutánea.

Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden ser formulados en un implante para la administración subcutánea. Adicionalmente, los compuestos de la

25 fórmula I pueden ser admininstrados transdermalmente a los animales. Para la

303

administración parenteral, se debe escoger una dosis, que proporciona al animal 0,01 mg/kg a 100 mg/kg por peso corporal del animal por día de los compuestos de la fórmula I.

- 5 Los compuestos de la fórmula I pueden ser aplicadas también tópicamente a los animales en forma de baños, polvos, collares, medallones, esprays, chapúes, formulaciones de tamponado o para untar y en pomadas o emulsiones de agua en aceite o aceite en agua. Para la aplicación tópica, los baños y esprays contienen, generalmente, 0,5 ppm a 5000 ppm y preferentemente, 1 ppm a 3000 ppm de los
- 10 compuestos inventivos. Adicionalmente, los compuestos de la fórmula I pueden ser formulados como marcas orejeras para animales, especialmente cuadrúpedos, tales como ganado y corderos.

Preparaciones apropiadas son:

15

Soluciones, tales como soluciones orales, concentrados para la administración oral tras dilución, soluciones para ser usadas sobre la piel o en cavidades corporales, formulaciones para extender, geles;

- Emulsiones y suspensiones para la administración oral o dermal; preparaciones
- 20 semisólidas;

- Formulaciones donde el compuesto activo es procesado en una base de ungüento o una base de emulsion de aceite en agua o de emulsión de agua en aceite;

- 25 - Preparaciones sólidas, tales como polvos, premezclas o concentrados, granulados,

pellets, tabletas, bol, cápsulas; aerosoles y polvos de inhalación, y artículos conformados conteniendo el compuesto activo.

Composiciones apropiadas para inyecciones se preparan disolviendo el ingrediente
5 activo en un disolvente apropiado y, opcionalmente, agregando otros ingredientes adicionales, tales como ácidos, bases, sales tampón, agentes de conservación y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se llenan en forma estéril.

Disolventes apropiados son disolvente fisiológicamente tolerados, tales como agua,
10 alcoholes, tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

Los compuestos activos se pueden disolver, opcionalmente, en aceites vegetales o
sintéticos fisiológicamente tolerados, que son apropiados para inyecciones.
15

Solubilizantes apropiados son disolventes, que facilitan la disolución del compuesto activo en el disolvente principal e impiden su precipitación. Ejemplos son:
polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite castor polioxietilado y éster de sorbitano polioxietilado.

20 Agentes de conservación apropiados son: alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres de ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

Soluciones orales se administran directamente. Concentrados se administran
25 oralmente tras dilución previa a la concentración de uso. Soluciones orales se

305

preparan según el estado de la técnica y tal y como se describe arriba para las soluciones de inyección, sin que sea necesario aplicar procedimiento estériles.

Soluciones a ser usadas sobre la piel se aplican en gotas, por extensión, se untan, se
5 pulverizan o se nebulizan.

Soluciones a ser usadas sobre la piel se preparan según el estado de la técnica y tal y como se describe arriba para las soluciones de inyección, sin que sea necesario aplicar procedimiento estériles.

10

Otros disolventes apropiados son polipropilenglicol, fenil etanol, fenoxi etanol, ésteres, tales como acetato de etilo o acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres, tales como alquilenglicol alquil éter, p.ej. dipropilenglicol monometiléter, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos,
15 dimetilformamida, dimetilacetamida, transcuto, solquetol, propilencarbonato, y mezclas de los mismos.

Puede ser ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Espesantes apropiados son los espesantes inorgánicos, tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesante orgánicos, tales como derivados de
20 celulosa, alcoholes polivinílicos y su copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

Geles se aplican o se extienden sobre la piel o se introducen en cavidades del cuerpo. Geles se preparan tratando soluciones preparadas en la forma descrita para soluciones de inyección son suficiente espesante para que se obtenga un material
25 claro de consistencia parecida a ungentos. Los espesantes usados son los arriba

descritos.

Formulaciones para untar se aplican vertiendo o pulverizando las mismas sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo en la piel y actuando

5 sistémicamente.

Formulaciones para untar se preparan disolviendo o emulsionando el compuesto activo en disolvente o mezclas de disolventes apropiados, compatibles con la piel. Si es apropiado, se pueden agregar otros auxiliares, tales como colorantes, sustancia

10 promotora de la absorción biológica, antioxidantes, estabilizantes a la luz, adhesivos.

Disolventes apropiados son: agua, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos, tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres,

15 tales como alquilenglicol alquil éteres, tales como dipropilenglicol monometil éter,

dietilenglicol mono-butyl éter, cetonas, tales como acetona, metil etil cetona,

carbonatos cíclicos, tales como propilencarbonato, etilencarbonato, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-

alquilpirrolidonas, tales como metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o n-ocilpirrolidona, N-

20 metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oxi-metilene-1,3-diox- olano y glicerol formal.

Colorantes apropiados son todos los colorantes apropiados para el uso en animales y que pueden ser disueltos o suspendidos.

304

Sustancias apropiadas promotoras de la absorción son, por ejemplo, DMSO, spreading oils, tales como miristato de isopropilo, dipropilenglicol pelargonato, aceites de silicona y copolimers de los mismos con poliéteres, ésteres de ácido graso,

5 triglicéridos y alcoholes grasos.

Antioxidantes apropiados son los sulfitos o metabisulfitos, tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

10 Estabilizantes a la luz son, por ejemplo, ácido novantisólico.

Adhesivos apropiados son, por ejemplo, derivados de celulos, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales, tales como alginatos, gelatina.

15 Las emulsiones pueden ser administradas oralmente, dermalmente o como inyecciones.

Las emulsiones pueden ser de tipo agua en aceite o aceite en agua.

20 Se preparan disolviendo el compuesto activo o bien en la fase hidófoba o en la fase hidrófila y homoneizando esta con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes apropiados y, si es apropiado, con auxiliares, tales como colorantes, sustancia promotoras de la absorción, agentes de conservación, antioxidantes, estabilizantes a la luz, sustancias promotoras de la viscosidad.

25 Fases hidrófobas (aceites) apropiadas son:

- parafina líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales, tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite castor, triglicéridos sintéticos, tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con aceites grasos vegetales con una cadena de 8 a 12 átomos de carbono u otros ácidos grasos naturales
- 5 seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o no saturados, que posiblemente contienen adicionalmente grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de ácidos grasos con 8 a 10 átomos de carbono, ésteres de ácido graso, tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butilo, laurato de hexilo, dipropilenglicol pelargonato, ésteres de ácidos grasos ramificados de
- 10 mediana longitud de cadena con alcoholes grasos saturados de 16 a 18 átomos de carbono, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos de 12 a 18 átomos de carbono, estearato de isopropilo, oleato de oleato, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos, tales como grasa de glándula coccigeal de pato, ftalato de
- 15 dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionados con los últimos, alcoholes grasos, tales como alcohol isotridecílico, 2-ocilidodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico y ácidos grasos, tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.
- 20 Fases hidrófilas apropiadas son: agua, alcoholes, tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Emulsionantes apropiados son:

surfactantes no iónicos, p.ej. aceite castor polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monostearato de sorbitano, glicerol monostearato, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol eter;

- 5 surfactantes anfólicos, tales como di-sodium N-lauril-p-iminodipropionato o lecitina; surfactantes aniónicos, tales como laurilsulfato de sodio, éteres de alcohol graso sulfatos, sal de monoetanolamina de ésteres ortofosfóricos de mono/dialquil poliglicol; surfactantes catión activos, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

- 10 Auxiliares adicionales apropiados son: sustancias que mejoran la viscosidad y estabilizan a la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y derivados de almidón, poliacrilatos, alginates, gelatina, goma arábica, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal silícico o mezclas de
- 15 las sustancias mencionadas.

- Suspensiones pueden ser administradas oralmente o tópica/dermalmente. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, de ser apropiado, con adición de otros auxiliares, tales como humectantes, colorantes, sustancias promotoras
- 20 de la absorción biológica, agentes de conservación, antioxidantes, estabilizantes a la luz.

Agentes de suspensión líquidos son todos los disolventes y mezclas de disolvente homogéneos.

310

Humectantes (dispersantes) son los emulsionantes arriba indicados.

Otros auxiliares adecuados son los arriba mencionados.

- 5 Preparaciones semisólidas pueden ser administradas oralmente o tópica/dermalmente, Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas únicamente en su más alta viscosidad.

- 10 Para la obtención de preparaciones sólidas se mezcla el componente activo con excipientes apropiados, si es necesario con adición de auxiliares, y se convierte en la forma deseada.

- Excipientes apropiados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente toleradas. Excipientes usados son sustancias inorgánicas y orgánicas. Sustancias inorgánicas, son, por ejemplo, cloruro sódico, carbonatos, tales como carbonato de calcio, hidrogencarbonates, óxidos de aluminio óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras acrillosas, sílica precipitada o coloidal o fosfatos. Sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos humanos y alimentos animales, tales como leche en polvo, harina animal, harina de grano y materiales desmenuzados, almidones.
- 15
- 20 Auxiliares apropiados son los agentes de conservación, antioxidantes, y/o colorantes arriba mencionados.

- Otros auxiliares apropiados son: lubricantes y deslizantes, tales como stearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancia promotoras de la
- 25 desintegración, tales como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes, tales

como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglutinantes secos, tal como celulosa microcristalina.

- En general, "cantidad efectiva antiparasitaria" significa la cantidad en ingrediente
- 5 activo necesaria para alcanzar un efecto notable sobre el crecimiento, inclusive efectos de necrosis, muerte, retardación, prevención y eliminación, destrucción y otra forma de reducir la presencia del organismo destino. La cantidad efectiva antiparasitaria puede variar para los diferentes compuestos/composiciones usados en la invención. La
- 10 cantidad efectiva antiparasitaria de las composiciones también variará según las condiciones que prevalecen, como p.ej. el efecto y la duración del antiparasitario deseados, el modo de aplicación, etc.

Las composiciones que pueden ser usadas en la invención pueden comprender, generalmente, de 0,001 a 95% del compuesto de la fórmula I.

15

Generalmente, es ventajoso aplicar los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por day , preferentemente, 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

- Preparaciones listas para el uso contienen los compuestos efectivos contra parásitos,
- 20 preferentemente, ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferentemente, de 0,1 a 65 por ciento en peso, muy preferentemente, de 1 a 50 por ciento en peso, especialmente, de 5 a 40 por ciento en peso.

Preparaciones que son diluidas antes de su aplicación contienen los compuestos

efectivos contra ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferentemente, de 1 a 50 por ciento en peso.

- Además, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula I contra
- 5 endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferentemente, de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy especialmente, de 0,005 a 0,25 por ciento en peso.

- En una modalidad preferida de la presente invención, se aplican las composiciones
- 10 que comprenden los compuestos de la fórmula I dermalmente/tópicamente.

- En otra modalidad preferida, se realiza la aplicación tópica en forma de artículos conformados, que contienen el compuesto activo, tales como collares, medallones, marcas orejeras, cintas para fijar en partes del cuerpo y cintas y láminas adhesivas.
- 15

- Generalmente, es ventajoso aplicar formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferentemente, 20 mg/kg a 200 mg/kg, muy preferentemente, 25 mg/kg a 160 mg/kg por peso corporal del animal tratado en el curso de tres semanas.
- 20 Para la preparación de artículos conformados se usan elastómeros termoplásticos y plásticos flexibles, al igual que elastómeros y elastómeros. Plásticos y elastómeros apropiados son las resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxídicas, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliésteres, que son suficientemente compatibles con los compuestos de la fórmula I. Una lista detallada de plásticos y

elastómeros, así como de los procedimientos de obtención de artículos conformados se encuentra, por ejemplo en la WO 03/086075.

La presente invención es ilustrada, ahora, en detalle en los ejemplos siguientes.

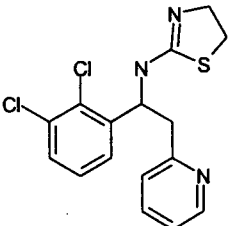
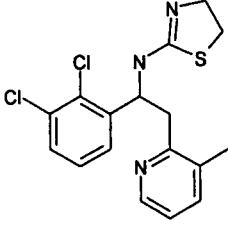
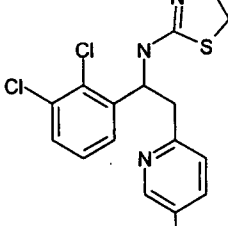
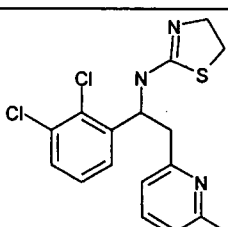
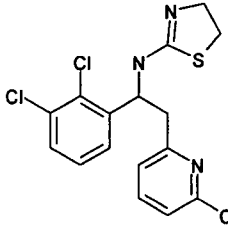
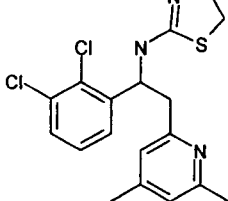
5

Ejemplos de compuestos

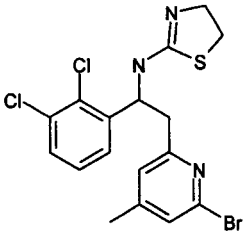
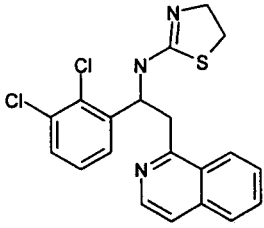
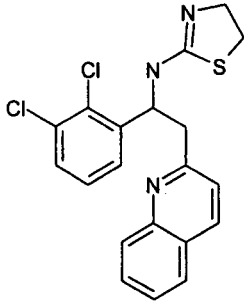
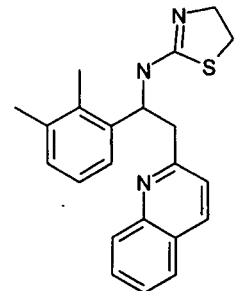
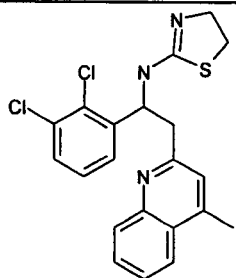
- Los compuestos de la fórmula I según la invención, así como sus productos intermedios fueron caracterizados mediante cromatografía líquida de alto
- 10 rendimiento/espectroscopía de masa acoplada (High Performance Liquid Chromatography / mass spectroscopy (HPLC/MS)) y por RNM o mediante sus puntos de fusión. Columna de HPLC: RP-18 column (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania). Elución: acetonitrilo + 0.1% ácido trifluoroacético (TFA) / agua + 0.1 % TFA en una relación de 5:95 hasta 95:5 en 5 minutos a 40 °C. Ionización de electroe
- 15 cuadripolar MS, 80 V (modo positivo).

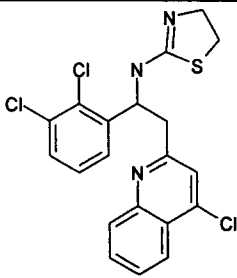
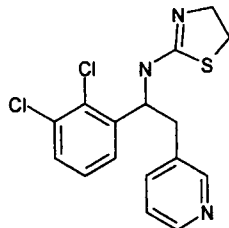
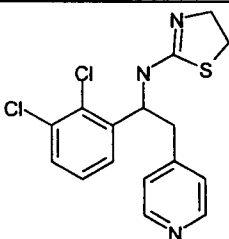
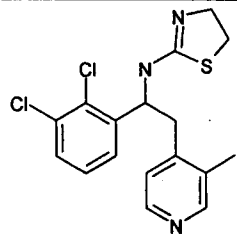
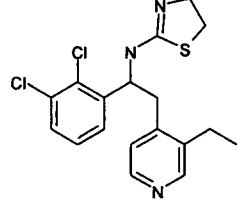
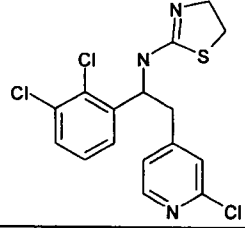
314

Tabla C:

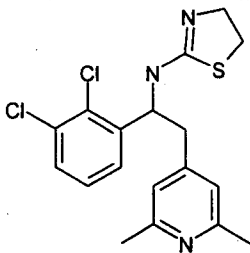
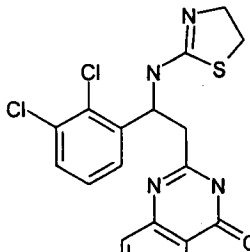
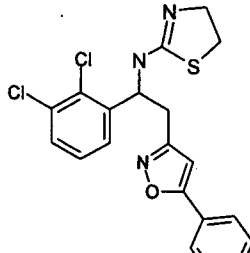
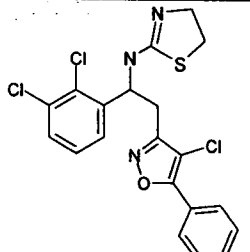
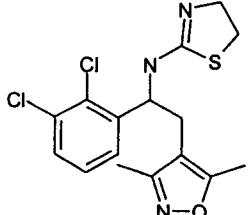
N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t_r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
1.		p.f. = 160 - 162°C
2.		$^1\text{H-NMR}$: 2.16 (s, 3H), 3.12-3.34 (m, 4H), 3.67-3.80 (m, 2H), 5.44-5.47 (m, 1H), 7.04-7.09 (m, 2H), 7.14 (d, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 8.40 (d, 1H)
3.		$^1\text{H-NMR}$: 2.30 (s, 3H), 3.02 (dd, 1H), 3.06-3.22 (m, 2H), 3.30 (dd, 1H), 3.79-3.92 (m, 2H), 5.40-5.44 (m, 1H), 6.83 (d, 1H), 7.02-7.07 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 2H), 8.36 (s, 1H)
4.		$^1\text{H-NMR}$: 2.58 (s, 3H), 3.00 (dd, 1H), 3.19-3.31 (m, 3H), 3.79-3.92 (m, 2H), 5.37-5.40 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 6.98-7.10 (m, 3H), 7.31 (dd, 1H), 7.40 (t, 1H)
5.		t_r = 2.72 min m/z = 386 (M+1)
6.		p.f. = 111 - 113°C

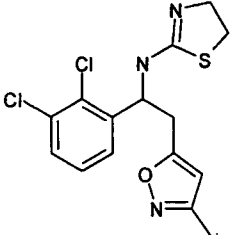
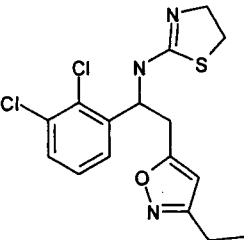
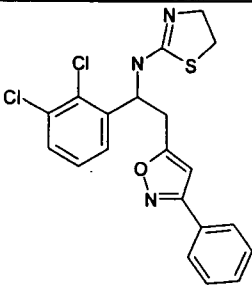
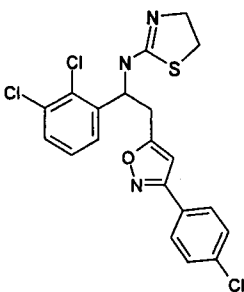
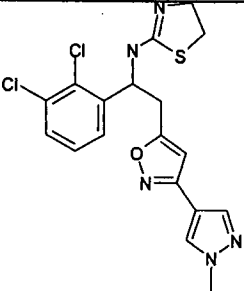
315

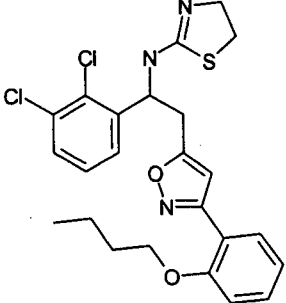
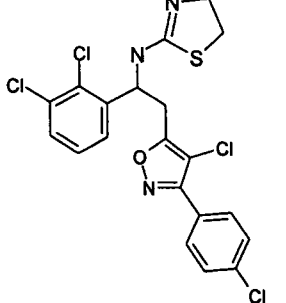
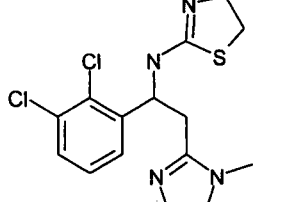
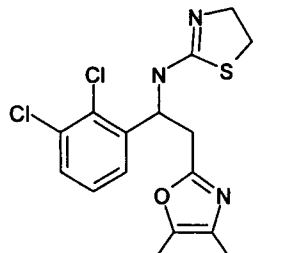
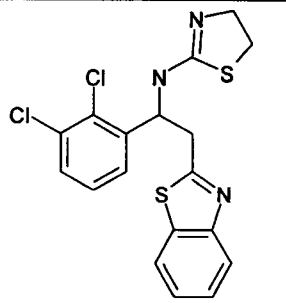
N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t _r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico (¹ H-NMR [CDCl ₃ , δ ppm])
7.		¹ H-NMR: 2.48 (s, 3H), 2.83 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 3.21-3.24 (m, 2H), 3.72-3.75 (m, 2H), 5.11-5.16 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.17-7.30 (m, 2H), 7.40 (d, 1H)
8.		p.f. = 117 - 121°C
9.		p.f. = 129 - 131°C
10.		p.f. = 139 - 141°C
11.		p.f. = 126 - 128°C

N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t _r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico (¹H-NMR [CDCl₃, δ ppm])
12.		p.f. = 71 - 73°C
13.		p.f. = 190 - 193°C
14.		p.f. = 224 - 225°C
15.		p.f. = 157 - 159°C
16.		p.f. = 132 - 134°C
17.		t _r = 2.80 min m/z = 386 (M+1)

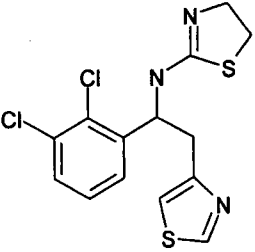
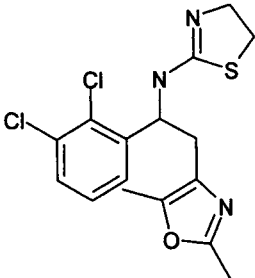
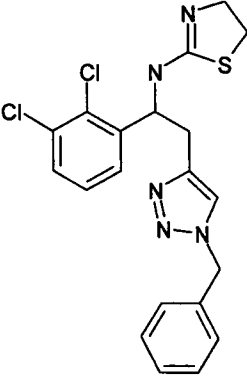
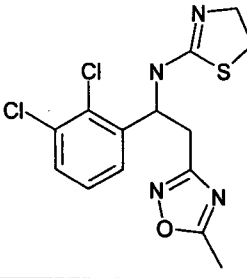
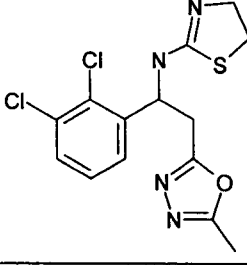
317

N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t_r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
18.		$^1\text{H-NMR}$: 2.47 (s, 6H), 2.79 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 3.20-3.25 (m, 2H), 3.77-3.87 (m, 2H), 5.21-5.24 (m, 1H), 6.78 (s, 2H), 7.17-7.29 (m, 2H), 7.40 (d, 1H)
19.		p.f. = 293 - 294°C
20.		t_r = 3.26 min m/z = 452 (M+1)
21.		t_r = 3.46 min m/z = 466 (M+1)
22.		p.f. = 188 - 194°C

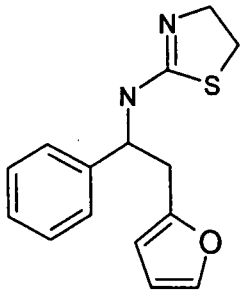
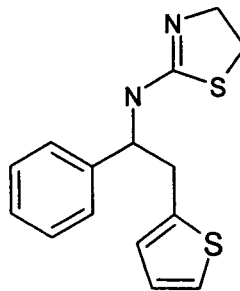
N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t_r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
23.		p.f. = 128 - 130°C
24.		$^1\text{H-NMR}$: 1.22 (t, 3H), 2.63 (q, 2H), 3.17 (dd, 1H), 3.21-3.32 (m, 3H), 3.77-3.82 (m, 2H), 5.32-5.37 (m, 1H), 5.81 (s, 1H), 7.11-7.24 (m, 2H), 7.37 (dd, 1H)
25.		t_r = 2.98 min m/z = 418 (M+1)
26.		t_r = 3.24 min m/z = 452 (M+1)
27.		t_r = 2.43 min m/z = 422 (M+1)

N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t _r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico (¹H-NMR [CDCl ₃ , δ ppm])
28.		t _r = 3.49 min m/z = 490 (M+1)
29.		t _r = 3.46 min m/z = 486 (M+1)
30.		p.f. = 195 - 196°C
31.		p.f. = 146 - 149°C
32.		p.f. = 165 - 166°C

320

N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t_r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico ($^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3 , δ ppm])
33.		p.f. = 154 - 156°C
34.		t_r = 2.56 min m/z = 370 (M+1)
35.		p.f. = 74 - 89°C
36.		p.f. = 137 - 141°C
37.		t_r = 2.342 min m/z = 357 (M+1)

321

N° de compuesto	Fórmula	Propiedades físicas (p.f. [°C], tiempo de retención t _r [min], espectro de masa m/z (HPLC/MS) o desplazamiento químico (¹ H-NMR [CDCl ₃ , δ ppm])
38.		¹ H-NMR = 3.2-3.4 (m), 3.85 (mc), 4.95 (mc), 5.95 (d), 6.20 (d), 7.05-7.4 (m).
39.		¹ H-NMR = 3.25 (t), 3.35 (mc), 3.9 (t), 4.85 (mc), 6.7-7.4 (m)

P. Ejemplos de preparación

5 Los compuestos de la fórmula I según la presente invención pueden ser preparados mediante diferentes métodos y por vía de diferentes productos intermedios, tal y como se describe en lo sucesivo:

P.I Método A

10

P.I.1. Nivel de preparación 1: Derivados de etilamina como compuestos intermedios

P.I.1.a) Etapa 1: Preparación de 2-(2-nitro-2-fenil-vinil)-tiofeno

322

A una solución de nitrometil-benceno (1.00 g; cf. *J. Org. Chem.* 2004, 6907-6908) y tiofen-2-carbaldehído (0,42 g) en tolueno (10 ml) se agregó fluoruro de potasio (42 mg) y dimetilamina clorhidrato (0,60 g) y se calentó la solución bajo reflujo en una trampa de Dean Stark durante 4 h. Se evaporó el disolvente y se disolvió el residuo en

5 diclorometano, se lavó con agua y se secó sobre sulfato de sodio. Tras evaporación del disolvente se obtuvo un producto crudo (1,35 g), que se purificó ulteriormente por trituración en una mezcla 1:1 de hexano y acetato de etilo, dando 0,96,g del producto.

P.I.1.a) Etapa 2: Preparación de 1-fenil-2-tiofen-2-il-etilamina

10

A una suspensión de hidruro de litio-aluminio (0,75 g) en tetrahidrofurano anhidro (15 ml) se agregó a 0 °C ácido sulfúrico concentrado (0,49 g) en porciones (reacción exotérmica) dentro de 30 min y se continuó agitando durante otros 30 min a la misma temperatura. Se agregó una solución de 2-(2-nitro-2-fenil-vinil)-tiofeno (0,96 g) en

15 tetrahidrofurano (17 ml) dentro de 30 min y se continuó agitando durante 1 h a 0 °C y entonces durante 3 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con una solución diluida de hidróxido sódico y los precipitados se eliminaron por filtración. El filtrado se secó sobre sulfato de sodio y se concentró en el vacío dando 1,02 g de 1-fenil-2-tiofen-2-il-etilamina cruda, que se usó sin purificación ulterior en la próxima

20 etapa.

P.I.1.b) Etapa 1: Preparación de benzhidrilideno-(2,3-dicloro-bencil)-amina

Una mezcla de 2,3-diclorobencilamina (23,5 g) y benzofenon-imina (26,6 g) en

25 diclorometano (100 mL) se agitó durante la noche a temperatura ambiente y luego se

mantuvo a reflujo durante 4 h. La mezcla se concentró en el vacío, el residuo se trituró en metanol y se filtró dando el compuesto indicado en el título (39, 1 g, 82 % en peso).

5 P.I.1.b) Etapa 2: Preparación de benzhidrilideno-[1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(3-etilisoxazol-5-il)-etil]-amina

Una mezcla de benzhidrilideno-(2,3-dicloro-bencil)-amina (1,50 g), 5-clorometil-3-etilisoxazol (1,28 g), cloruro de benciltriethylamonio (100 mg), hidróxido de sodio (1,06 g), carbonato de potasio (2,44 g) e yoduro de sodio (66 mg) en acetonitrilo (50 mL) se
10 mantuvo a reflujo durante 3 h. A continuación, se diluyó la mezcla con éter dietílico, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró en el vacío. El residuo se purificó cromatográficamente dando el compuesto indicado en el título (1.58 g, 76 % en peso).

15 P.I.1.b) Etapa 3: Preparación de 1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(3-etil-isoxazol-5-yl)-etilamina

Una solución acuosa al 10% de HCl (12 mL) se agregó a una solución de benzhidrilideno-[1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(3-etilisoxazol-5-yl)-etil]-amina (500 mg) en éter dietílico (10 mL) y la mezcla se agitó durante la noche. A continuación, se separaron
20 las fases, se lavó la capa acuosa con acetato de etilo, se reguló a pH 8 con solución saturada de bicarbonato sódico y se extrajo con diclorometano. Los extractos se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron dando el compuesto indicado en el título (270 mg, 81 % en peso).

324

P.I.1.c) Preparación de 1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(4-metil-quinolin-2-il) etilamina

Una solución 1 M de bis(trimetilsilil)amida de litio en tetrahidrofurano (11 mL) se agregó en gotas a una solución de 2,3-diclorobenzaldehído (1,75 g) en

- 5 tetrahidrofurano (25 mL) a 0 °C. La mezcla se agitó durante 15 min a 0 °C y luego durante 1 h a temperatura ambiente. Mientras tanto se agregó en gotas una solución 1,5 M de *n*-butillitio en *n*-hexano (7 mL) a una solución de 2,4-dimetilquinolina (1,57 g) en tetrahidrofurano (12 mL) a -78 °C. Después de haber agitado durante 30 min a -78°C, 30 min a 0 °C y 15 min a temperatura ambiente, se agregó en gotas una
- 10 solución de trimetilsililimina a -78 °C, se agitó la mezcla resultante durante 2,5 h, se vertió en agua helada y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio, se concentraron en el vacío y el residuo se purificó cromatográficamente dando el compuesto indicado en el título (2.54 g, 77 % en peso).

15

P.I.2. Nivel de preparación 2: Derivado de tiourea como compuesto intermedio

P.I.2.a) Preparación de 1-(2-hidroxi-etil)-3-(1-fenil-2-tiofen-2-il-etil) tiourea

- 20 A una solución de tiofosgeno (0,70 g) en diclorometano se agregó una solución de carbonato de potasio (1,70 g) en agua (6 ml). A esta mezcla se agregó una solución de 1-fenil-2-tiofen-2-il-etilamina (1,00 g) en diclorometano en gotas a temperatura ambiente. Después de haber agitado durante 5 h se lavó la mezcla con agua y se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se concentró en el vacío dando isotiocianato
- 25 crudo, que se disolvió en diclorometano (70 ml) y se trató con etanolamina (0,24 g).

325

Esta mezcla de reacción se agitó durante 3 h, luego se concentró en el vacío y el resto se purificó mediante cromatografía de columna dando 0,92 g de 1-(2-hidroxi-etil)-3-(1-fenil-2-tiofen-2-il-etil)-tiourea, p.f. 109-112 °C.

- 5 P.I.3. Nivel de preparación 3: Compuesto de la fórmula I según la invención

P.I.3.a)-1 Preparación de (4,5-dihidro-tiazol-2-il)-(1-fenil-2-tiofen-2-il-etil)-amina
(compuesto del ejemplo 39 de la Tabla C)

- 10 A una solución de 1-(2-hidroxi-etil)-3-(1-fenil-2-tiofen-2-il-etil)-tiourea (0,71 g) y trifenilfosfina (0,91 g) en tetrahidrofurano (24 ml) se agregó en gotas a temperatura ambiente una solución de diisopropylazodicarboxilato (0,60 g) en tetrahidrofurano (7 ml). Después de haber agitado durante 1 h la mezcla de reacción was se concentró en el vacío y el resto se purificó por cromatografía de columna dando 0,45 g del producto.

15

P.I.3.a)-2 Preparación de (4,5-dihidro-tiazol-2-il)-(1-fenil-2-furan-2-il-etil)-amina
(compuesto del ejemplo 38 de la Tabla C)

- A una solución de 1-(2-hidroxi-etil)-3-(1-fenil-2-furan-2-il-etil)-tiourea (0,72 g)
- 20 (preparada análogamente al método descrito para 1-(2-hidroxi-etil)-3-(1-fenil-2-tiofen-2-il-etil)-tiourea) y diisopropiletilamina (0,45 g) en propionitrilo (7 ml) se agregó yoduro de cianometil-trimetil-fosfonio (J. Med. Chem. 2004, 6055-6069). La mezcla de reacción se calentó a 90 °C durante 6 h y se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se agregó acetato de etilo y se lavó con solución diluida de carbonato de

326

potasio (al 5% en peso en agua), agua y se secó sobre sulfato de sodio. El resto se purificó por cromatografía de columna dando el producto en 0,37 g.

P.II. Método B

5

P.II.1. Nivel de preparación 1: Éster terc.-butilico de ácido tiazolidin-3-carboxílico como compuesto intermedio

10

P.II.1. Etapa 1: Preparación de (2,3-dicloro-bencil)-(4,5-dihidro-tiazol-2-il)-amina

15

Una solución de 2-cloroetil isotiocianato (3,45 g) en éter dietílico (20 mL) se agregó en gotas a una solución de 2,3-diclorobencilamina (5,00 g) en éter dietílico (80 mL) a 0 °C y la mezcla se dejó calentar a temperatura ambiente durante 3 h. Se agregó NaOH 1M acuoso (100 mL) y se agitó la mezcla durante 1 h. Entonces, se separaron las capas, se lavó la fase orgánica con agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró en el vacío. El residuo se purificó cromatográficamente dando el compuesto indicado en el título (7,79 g, 94 % en peso).

20

P.II.1. Etapa 2: Preparación de éster *tert*-butilico de ácido 2-(2,3-dicloro-bencilimino)-tiazolidin-3-carboxílico

Di-*tert*-butil dicarbonato (9,77 g) se agregó a una solución de (2,3-dicloro-bencil)-(4,5-dihidro-tiazol-2-il)-amina (7,79 g) en diclorometano (100 mL) a 0 °C y la mezcla se dejó calentar a temperatura ambiente durante la noche. La solución se lavó con agua,

se secó sobre sulfato de sodio, se concentró en el vacío y el residuo se purificó cromatográficamente dando el compuesto indicado en el título (6,84 g, 67 % en peso).

5 P.II.1. Etapa 3: Preparación de éster *terc.*-butilico de ácido 2-[1-(2,3-dicloro-fenil)-2-piridin-3-il-etilimino]-tiazolidin-3-carboxílico

Una solución de *sec*-butillitio 1,3 M en ciclohexano (1,7 mL) se agregó en gotas a una mezcla de *terc*-butóxido de potasio (247 mg) en tetrahidrofurano (6 mL) a -78 °C y la mezcla se agitó durante 15 min. Entonces se agregó en gotas una solución de éster *terc.*-butilico de ácido 2-(2,3-dicloro-bencilimino)-tiazolidin-3-carboxílico (361 mg) en tetrahidrofurano (4 mL) y se agitó la mezcla durante 2 h. Luego se agregó en gotas una solución de 3-clorometil-piridina (281 mg) en tetrahidrofurano (2 mL) y se agitó la mezcla durante 30 min a -78 °C y luego 30 min a -30 °C. Luego se agregó cloruro de amonio saturado acuoso a 0 °C y se extrajo la mezcla con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio, se concentraron y el residuo se purificó cromatográficamente dando el compuesto indicado en el título (380 mg, 75 % en peso).

20 P.II.2. Nivel de preparación 2: Compuesto de la fórmula I según la invención

P.II.2. Preparación de [1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(2,5-dimetil-oxazol-4-il)-etil] 4,5-dihidro-tiazol-2-il)-amina (compuesto del ejemplo 34 de la Tabla C)

25 Ácido trifluoroacético (10 µL) se agregó en gotas a una solución de éster *terc.*-butilico de ácido 2-[1-(2,3-dicloro-fenil)-2-(2,5-dimetil-oxazol-4-il)-etilimino]-tiazolidin-3-

carboxílico (65 mg) (preparado análogamente al método arriba descrito) en tetrahidrofurano (1 mL) a 0 °C y la mezcla se dejó calentar a temperatura ambiente durante 1 h. El compuesto indicado en el título se obtuvo en una pureza de > 80% según HPLC-MS [t_r = 2.56 min, m/z = 370 (M+1)].

5

B. Ejemplos biológicos

Ejemplos de la acción contra pestes

10

La acción de los compuestos I contra pestes es demostrada en los siguientes experimentos:

B.1 Pulgón del algodón (*Aphis gossypii*)

15

Los compuestos activos se formularon en 50:50 acetona : agua y 100 ppm de surfactante KinetiTM.

20

Plantas de algodón en el estadio de las hojas cotiledóneas (variedad 'Delta Pine') se infestaron con aproximadamente 100 pulgones criados en el laboratorio colocando secciones de hoja infestadas sobre las plantas de ensayo. Las secciones de hoja se quitaron después de 24 horas. Las hojas cotiledóneas de las plantas intactas se sumergieron en soluciones gradientes del compuesto de ensayo. Se determinó después de cinco días la mortalidad sobre las plantas tratadas en comparación con la

329

mortalidad de las plantas de control.

En este ensayo, los compuestos de los ejemplos 1,3,4,6,8,9,24,38 y 39 de la Tabla C presentaban con 300 ppm más de un 80% de mortalidad, en comparación con

5 controles no tratados.

B.2 Pulgones verdes del melocotonero (*Myzus persicae*)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 acetona : agua y 100 ppm de

10 surfactante KinetiTM.

Plantas de pimientos en el estadio de segundo par de hojas (variedad 'California Wonder') se infestaron con aproximadamente 40 pulgones criados en el laboratorio colocando secciones de hoja infestadas sobre las plantas de ensayo. Las secciones se

15 hoja se quitaron después de 24 horas. Las hojas de las plantas intactas se sumergieron en soluciones gradientes del compuesto de ensayo. Se determinó después de cinco días la mortalidad sobre las plantas tratadas en comparación con la mortalidad de las plantas de control.

20 En este ensayo, los compuestos de los ejemplos 1,3,4,6,8,9,13,24,38 y 39 de la Tabla C presentaban con 300 ppm más de un 80% de mortalidad, en comparación con controles no tratados.

B.3 Pulgón del caupí (*aphis craccivora*)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 acetona:agua. Plantas de caupí en macetas se colonizaron con 100 - 150 pulgones en diferentes estadios y después de
5 haber registrada la población se pulverizaron. Se registró la reducción de la población después de 24, 72, y 120 horas.

En este ensayo, los compuestos de los ejemplos 1,3,4,6,8,9,23 y 31 de la Tabla C presentaban con 300 ppm más de un 80% de mortalidad, en comparación con
10 controles no tratados.

B.4 Pulgón de la arveja (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos se formularon en 1:3 DMSO : agua. Se colocaron discos de
15 hojas de frijol sobre placas de microtitulación llenadas con 0,8% de agar-agar y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hoja se pulverizaron con 2,5 µl de la solución de ensayo y se colocaron 5 a 8 pulgones adultos sobre las placas de microtitulación y luego se cerraron las placas y se mantuvieron a 22-24°C y 35-45% bajo luz fluorescente durante seis días. La mortalidad se evaluó con base en la cantidad de
20 pulgones vitales, reproducidos. Los ensayos se replicaron dos veces.

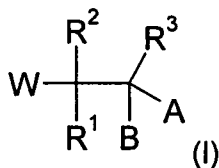
En este ensayo, los compuestos de los ejemplos 1-4,6,8 y 9 de la Tabla C presentaban con 2500 ppm más de un 80% de mortalidad, en comparación con controles no tratados.

331

Reivindicaciones:

1. Compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula general (I):

5



en donde

10

R¹, R², R³

son seleccionados entre hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que

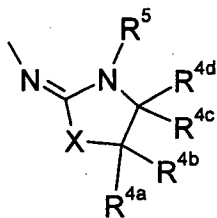
15

comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquilo;

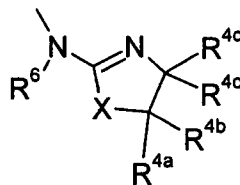
20

fenilo o bencilo, cada uno sustituido o no sustituido con cualquier combinación de uno a cinco grupos de halógeno, uno a tres C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi grupos;

A es un radical de las fórmulas A¹ o A²:



A¹



A²

en donde

5

X es azufre o oxígeno;

R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}, R^{4d} son seleccionados, independientemente entre si, de:

10

hidrógeno, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquilamino, C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados,

15

independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

20

R⁵, R⁶, R⁹ son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{5c} o C(=O)R^{6c} o C(=O)R^{9c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-

C₆-alcoxi)metileno, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de 1, 2 ó 3 radicales, seleccionados,

5 independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

10 $C(O)NR^{5a}R^{5b}$ o $C(O)NR^{6a}R^{6b}$ o $C(O)NR^{9a}R^{9b}$, $(SO_2)NR^{5a}R^{5b}$ o $(SO_2)NR^{6a}R^{6b}$ o $(SO_2)NR^{9a}R^{9b}$,

fenilo, fenilo o bencilo, pudiendo cada uno de los tres últimos radicales mencionados ser no sustituidos o sustituidos con 1 a 5 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: uno a cinco radicales halógeno, uno a tres radicales C₁-C₆-alquilo, uno a tres radicales C₁-C₆-haloalquilo, uno a tres radicales C₁-C₆-alquiltio, uno a tres radicales C₁-C₆-haloalquiltio, uno a tres radicales C₁-C₆-alcoxi y uno a tres radicales C₁-C₆-haloalcoxi; y en donde R^{5a}, R^{6a}, R^{9a}, R^{5b}, R^{6b}, R^{9b}, R^{5c}, R^{6c} y R^{9c} tienen las definiciones abajo indicadas

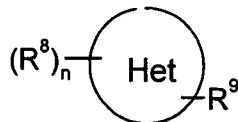
20

B es un sistema de anillo fenilo opcionalmente sustituido

W es un anillo heteroaromático de cinco a seis miembros, que puede contener 1 a 4 heteroátomos seleccionados entre oxígeno, nitrógeno y azufre,

25

donde el anillo heteroaromático puede estar condensado,
 opcionalmente, con un anillo seleccionado entre fenilo y un anillo
 heterocíclico aromático saturado, parcialmente insaturado de 5 a 6
 miembros, que puede contener 1 a 3 heteroátomos seleccionados entre
 5 oxígeno, nitrógeno y azufre,
 y donde el anillo heteroaromático de cinco a seis miembros o los
 respectivos sistemas de anillo condensados pueden ser no sustituidos
 u, opcionalmente, estar sustituidos por R^9 y/o cualquier combinación de
 1 a 4 grupos R^8 :



donde n es 0, 1, 2, 3, o 4;

y R^8 tiene las definiciones abajo indicadas;

y R^9 tiene las definiciones arriba indicadas

y en donde

R^8 es seleccionado entre halógeno, OH, SH, NH_2 , SO_3H , $COOH$,
 20 ciano, azido, nitro, formilo, $CONH_2$, $CSNH_2$, $CH=N-OH$, $CH=N-O-$
 (C_1-C_6) -alquilo, $C(=O)R^{8c}$, $C(=S)R^{8c}$, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -
 alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alquilamino,
 C_2-C_6 -alquenilamino, C_2-C_6 -alquinilamino, $di(C_1-C_6)$ -alquilamino,
 $di(C_2-C_6)$ -alquenilamino, $di(C_2-C_6)$ -alquinilamino, C_1-C_6 -alquiltio,
 25 C_2-C_6 -alqueniltio, C_2-C_6 -alquinitio, C_1-C_6 -alquilsulfonilo, C_2-C_6 -

- alquenilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilsulfonilo, (C₁-C₆-alquil)carbonilo, (C₂-C₆-alquenil)-carbonilo, (C₂-C₆-alquinil)-carbonilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₂-C₆-alqueniloxi)carbonilo, (C₂-C₆-alquiniloxi)-carbonilo, (C₁-C₆-alquil)carboniloxi, (C₂-C₆-alquenil)-carbonil-oxi, (C₂-C₆-alquinil)carboniloxi, (C₁-C₆-alquil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquenil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquinil)carbonil-amino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;
- C(O)NR^{8a}R^{8b}, (SO₂)NR^{8a}R^{8b}; donde R^{8a}, R^{8b} y R^{8c} tienen las definiciones abajo indicadas,
- un radical Y-Ar o un radical Y-Cy, en donde
- Y es un enlace simple, O, S, NH, C₁-C₆-alcanodiilo o C₁-C₆-alcanodiiloxi;
- Ar es fenilo, naftilo o un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, donde Ar no lleva sustituyente o puede llevar cualquier combinación de uno

5 a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

10 Cy es C₃-C₁₂-cicloalquilo, que es no sustituido o sustituido con uno a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

y en donde

15 R^{5a}, R^{6a}, R^{8a} y R^{5b}, R^{6b}, R^{8b} son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alqueno, o C₂-C₆-alquino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende:

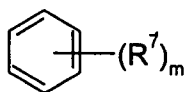
20 halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquinoxilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

25 y R^{5c}, R^{6c}, R^{8c} y R^{9c}

son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C₁-C₆
alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-
alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino,
(C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que
5 puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros,
que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O, S y N

o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos.

- 10 2. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la
reivindicación 1, en donde B es seleccionado entre:



en donde

15

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

R⁷ es seleccionado entre halógeno, OH, SH, NH₂, SO₃H, COOH, ciano,
azido, nitro, formilo, CONH₂, CSNH₂, CH=N-OH, CH=N-O-(C₁-C₆)-
20 alquilo, C(=O)R^{7c}, C(=S)R^{7c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-
alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquilamino, C₂-C₆-alquenilamino, C₂-
C₆-alquinilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, di(C₂-C₆-alquenil)amino, di(C₂-
C₆-alquinil)amino, C₁-C₆-alquiltio, C₂-C₆-alqueniltio, C₂-C₆-alquiniltio, C₁-
C₆-alquilsulfonilo, C₂-C₆-alquenilsulfonilo, C₂-C₆-alquinilsulfonilo, (C₁-C₆-
25 alquil)carbonilo, (C₂-C₆-alquenil)-carbonilo, (C₂-C₆-alquinil)-carbonilo, C₁-

- C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, (C₁-C₆-alcoxi)carbonilo, (C₂-C₆-alqueniloxi)carbonilo, (C₂-C₆-alquiniloxi)-carbonilo, (C₁-C₆-alquil)carboniloxi, (C₂-C₆-alquenil-)carbonil-oxi, (C₂-C₆-alquinil)carboniloxi, (C₁-C₆-alquil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquenil)carbonil-amino, (C₂-C₆-alquinil)carbonil-amino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio; C(O)NR^{7a}R^{7b} o (SO₂)NR^{7a}R^{7b}; donde R^{7a}, R^{7b} y R^{7c} tienen las definiciones abajo indicadas,
- un radical Y-Ar o un radical Y-Cy, en donde
- Y es un enlace simple, O, S, NH, C₁-C₆-alcanodiilo o C₁-C₆-alcanodiiloxi;
- Ar es fenilo, naftilo o un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2 átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno como miembros de anillo, donde Ar no lleva sustituyente o puede llevar cualquier combinación de uno a cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxil, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-

C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi,
C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

Cy es C₃-C₁₂-cicloalquilo, que es no sustituido o sustituido con uno a
cinco radicales, seleccionados, independientemente entre si, del
grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto,
amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-
C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

y en donde el radical R⁷, que es ligado a átomos de carbono vecinos del
anillo fenilo puede formar, opcionalmente, conjuntamente con dichos
átomos de carbono, un anillo benceno condensado, un carbociclo
condensado, saturado o parcialmente insaturado de 5, 6, ó 7 miembros
o un heterociclo condensado de 5, 6 ó 7 miembros, que contiene 1, 2, 3
ó 4 heteroátomos seleccionados entre 1 ó 2 átomos de oxígeno 1 ó 2
átomos de azufre y 1 a 3 átomos de nitrógeno como miembros de anillo,
y donde el anillo condensado no lleva sustituyente o puede llevar 1, 2, 3
ó 4 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo
que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxí, mercapto, amino,
carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-
alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio;

y en donde

R^{7a} y R^{7b} son seleccionados, independientemente entre si, de:
hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-

5

alquenilo, o C₂-C₆-alquinilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxi, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio;

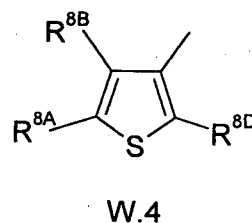
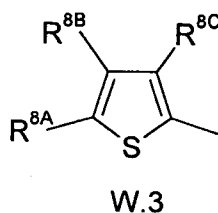
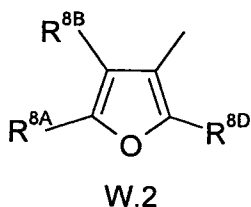
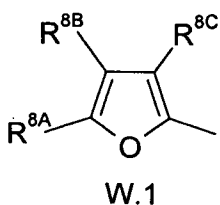
10

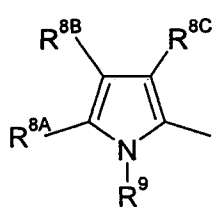
R^{7c}

son seleccionados, independientemente, entre si de: hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O, S y N

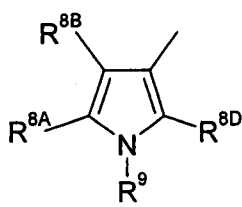
15

- 20 3. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde W es seleccionado entre:

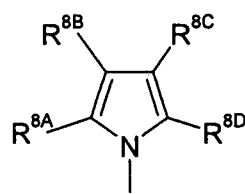




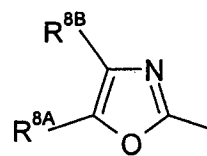
W.5



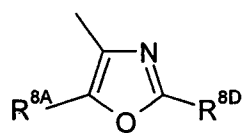
W.6



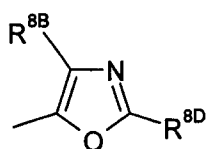
W.7



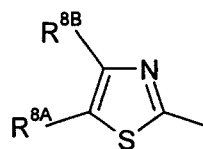
W.8



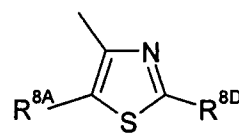
W.9



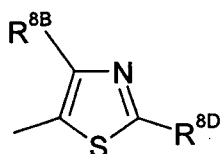
W.10



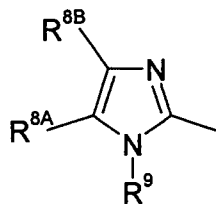
W.11



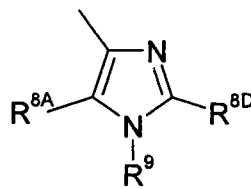
W.12



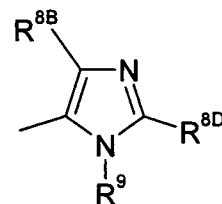
W.13



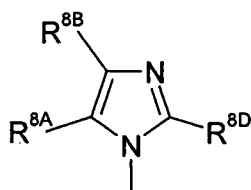
W.14



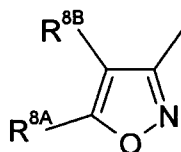
W.15



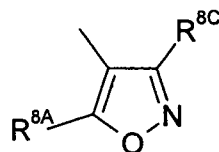
W.16



W.17



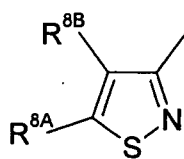
W.18



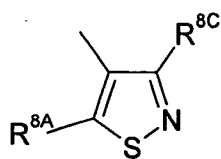
W.19



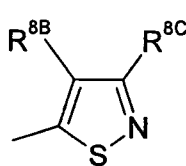
W.20



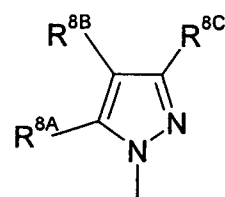
W.21



W.22



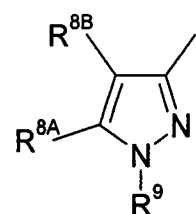
W.23



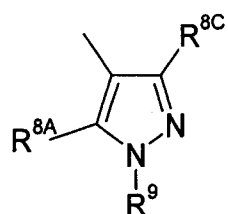
W.24

5

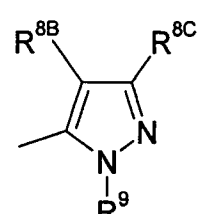
10



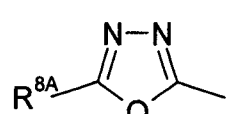
W.25



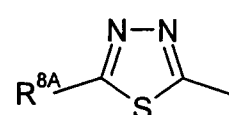
W.26



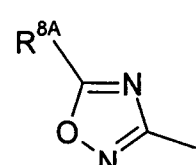
W.27



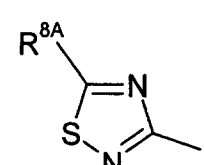
W.28



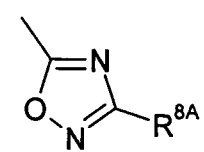
W.29



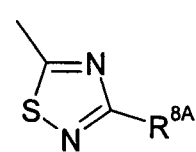
W.30



W.31

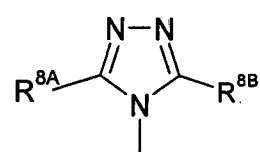


W.32

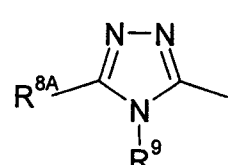


5

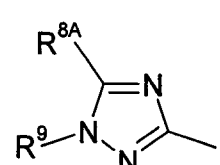
W.33



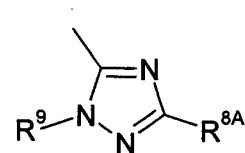
W.34



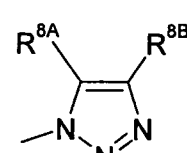
W.35



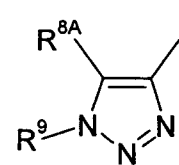
W.36



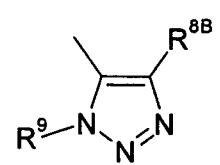
W.37



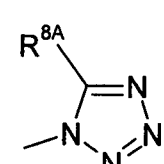
W.38



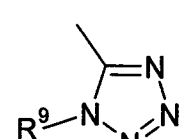
W.39



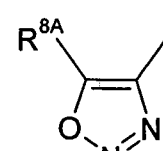
W.40



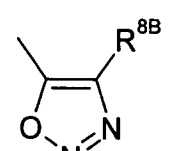
W.41



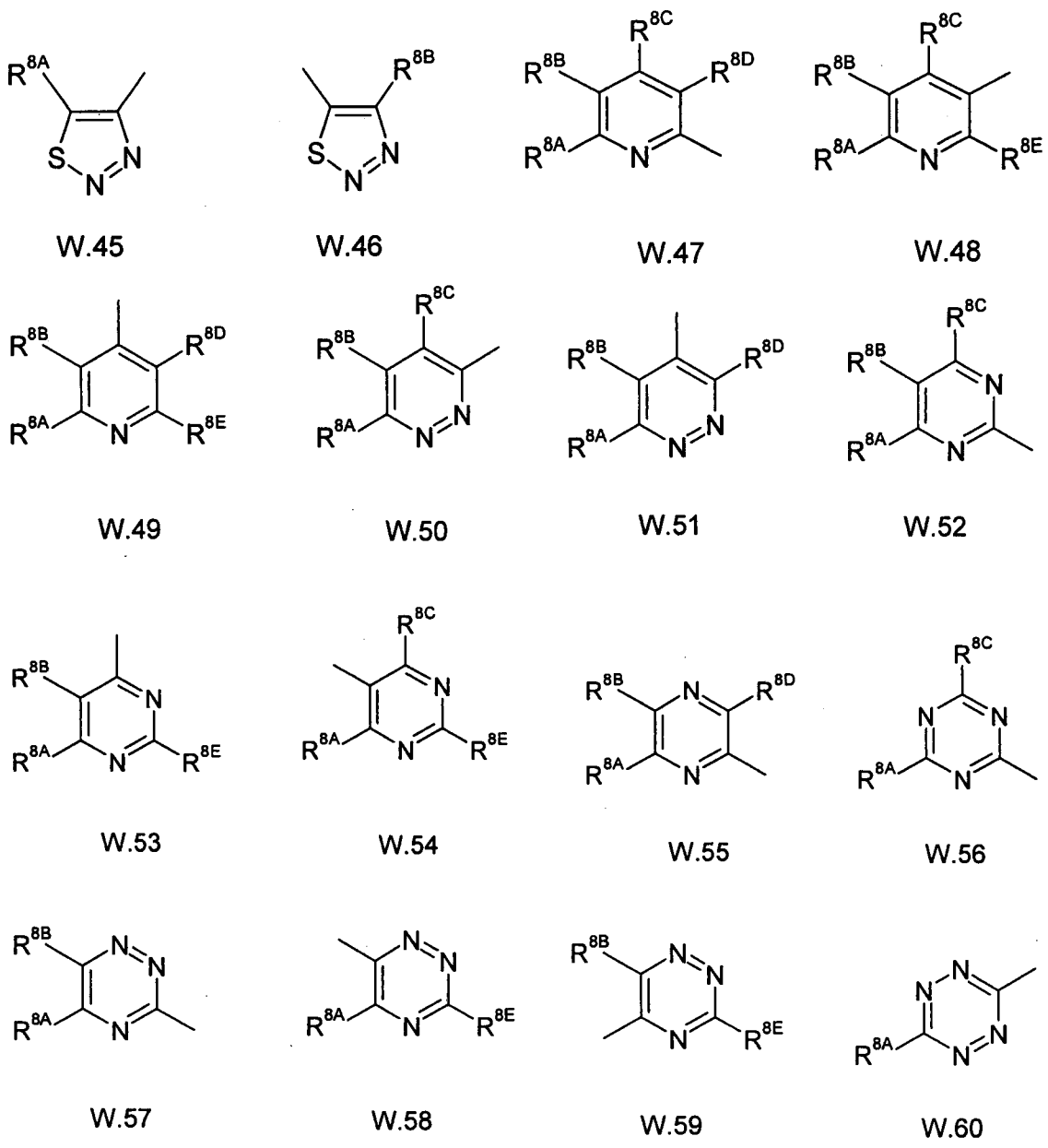
W.42



W.43



W.44



5

10

en donde los enlaces libres representan la posición de enlace en la fórmula I, indicando las letras mayúsculas A, B, C, D y E al lado de R⁸ la posición de R⁸ en el sistema de anillo heteroaromático y teniendo R⁸ la definición indicada en la reivindicación 1.

4. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde W es seleccionado entre las fórmulas W.1, W.2,

W.3, W.4, W.5, W.6, W.8, W.9, W.10, W.11, W.12, W.13, W.14, W.15, W.17, W.18, W.19, W.20, W.21, W.22, W.23, W.25, W.26, W.27, W.28, W.29, W.30, W.31, W.32, W.33, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 y W. 54, tal y como se define en la reivindicación 3.

5

5. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde W es seleccionado entre las fórmulas W.1, W.3, W. 25, W.26, W.27, W. 47, W.48, W.49, W. 52, W.53 y W.54, tal y como se define en la reivindicación 3.

10

6. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde

R¹, R², R³ son seleccionados entre hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-haloalquilo y C₁-C₆-alquiltio.

15

20

7. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R¹, R² y R³ son seleccionados entre hidrógeno y C₁-C₆-alquilo;

25

345

8. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R^1 , R^2 y R^3 significan hidrógeno.
- 5 9. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde
- R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} , R^{4d} son seleccionados, independientemente entre si, de:
hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 -alquilo y C_1 - C_6 -haloalquilo.
- 10 10. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} y R^{4d} significan hidrógeno.
11. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde
- 15 R^5 , R^6 , R^9 son seleccionados, independientemente entre si, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, $C(=O)R^{5c}$, $C(=O)R^{6c}$, $C(=O)R^{9c}$, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, (C_1 - C_6 -alcoxi)metilen, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfenilo o C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los
- 20 grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de 1, 2 ó 3 radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_2 - C_6 -alqueniloxi, C_2 - C_6 -alquiniloxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi y C_1 - C_6 -alquiltio y en donde

346

R^{5c}, R^{6c} y R^{9c}

son seleccionados, independientemente, entre sí de: hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O, S y N.

12. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R⁵, R⁶, R⁹ son seleccionados, independientemente entre sí, de: hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{5c} o C(=O)R^{6c} o C(=O)R^{9c} y C₁-C₆-alquilo y en donde

R^{5c}, R^{6c} y R^{9c}

son seleccionados, independientemente, entre si de:
hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆-alenilo, C₂-C₆-alquinilo,
C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-
alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, hidracino, (C₁-C₆-
alquil)hidracino, di(C₁-C₆-alquil)hidracino, fenilo y
heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático
mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3
ó 4 heteroátomos seleccionados entre O,S y N

25

347

13. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde R^5 , R^6 y R^9 son hidrógeno.

14. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde

R^7 , R^8 son ambos seleccionados independientemente entre si de: halógeno, OH, SH, NH_2 , SO_3H , $COOH$, ciano, $CONH_2$, $C(=O)R^{7c}$, $C(=O)R^{8c}$, C_1-C_6 -alquilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alquilamino, di(C_1-C_6 -alquil)amino, pudiendo los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos arriba mencionados llevar cualquier combinación de uno, dos o tres radicales, seleccionados, independientemente entre si, del grupo que comprende: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_2-C_6 -alqueniloxi, C_2-C_6 -alquiniloxi, C_1-C_6 -haloalcoxi y C_1-C_6 -haloalquilo; y en donde

R^{7c} , R^{8c} son ambos seleccionados independientemente entre si de: hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_2-C_6 -alquenilo, C_2-C_6 -alquinilo, C_3-C_8 -cicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, (C_1-C_6 -alquil)amino, di(C_1-C_6 -alquil)amino, fenilo y heteroarilo, que puede ser un anillo heteroaromático mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre O, S y N.

15. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde
- R^7 , R^8 son ambos seleccionados independientemente entre sí de: halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo y C_1 - C_6 -alcoxi, y en donde los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados.
- 5
16. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde X es azufre.
- 10
17. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde m es 0, 1, 2 ó 3.
18. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde m es 0, 1 ó 2.
- 15
19. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde n es 0, 1, 2 ó 3.
- 20
20. Un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano según la reivindicación 1, en donde n es 0, 1 ó 2.
21. Una composición que comprende por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 o un enantiómero, diastereómero y/o sal de la misma y por lo menos un soporte inerte líquido y/o sólido.
- 25

349

22. Una composición agrícola o veterinaria que comprende por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal útil en la agricultura o veterinaria de la misma y por lo menos un soporte inerte líquido y/o sólido agronómicamente aceptable y, si se desea, por lo menos un surfactante.
23. Un método para usar un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero o an una sal aceptable en la agricultura o veterinaria del mismo, para combatir pestes animales por tratamiento de los pestes con una cantidad activa pesticida del mismo.
24. Un método para combatir pestes animales que comprende contactar los pestes animales o el medio ambiente donde crecen o viven o pueden crecer o vivir los pestes o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios a ser protegidos frente al ataque por el animal o la infestación por los animales, con una cantidad efectiva pesticida de por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero o una sal aceptable en la agricultura o veteriania del mismo.
25. Un método para combatir pestes animales según la reivindicación 24, que comprende contactar los pestes animales, su habitat, áreas de cría, suministro

- de comida, planta, semillas, suelos, áreas, materiales o el medio ambiente donde viven o crecen o pueden vivir o crecer los pestes animales o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios a ser protegidos frente al animal o la infestación por el animal, con una cantidad efectiva
- 5 pesticida de por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero o una sal aceptable en la agricultura o veterinaria del mismo.
- 10 26. El método tal y como se define en la reivindicación 24, en donde the pestes animales are insectos, arácnidos o nemátodos.
27. El método tal y como se define en la reivindicación 24, en donde los pestes animales son insectos, tales como homópteros, lepidópteros o coleópteros o
- 15 arácnidos del orden de Acarina.
28. Un método para proteger cultivos frente al ataque o la infestación por pestes animales, que comprende contactar un cultivo con una cantidad efectiva pesticida de por lo menos un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-
- 20 hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero o una sal aceptable en la agricultura o veterinaria del mismo.
29. Un método para proteger a semillas frente a insectos del suelo y las raíces y
- 25 vástagos de plántulas frente a insectos, que comprende contactar las semillas

antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal aceptable en la agricultura del mismo, en cantidades efectivas
5 pesticidas.

30. El método según la reivindicación a 29, en donde el compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano es aplicado en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas.

31. Un método según las reivindicaciones 29 ó 30, en donde se protegen las raíces y vástagos de las resultantes plantas.

32. Un método según cualquiera de las reivindicaciones 29 a 31, en donde se protegen las raíces y vástagos de las resultantes plantas frente a pulgones.

33. Semillas que comprenden un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal aceptable en la agricultura del mismo.

34. Semillas que comprenden un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal aceptable

en la agricultura del mismo, en una cantidad de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semillas.

35. Un método para usar un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero o una sal aceptable en la agricultura del mismo, para combatir parásitos en y sobre animales, tratando los parásitos con una cantidad efectiva antiparasitaria del mismo.
36. Un método para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección por parásitos, que comprende administrar a los animales una cantidad efectiva antiparasitaria de un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo.
37. Un método según la reivindicación 36 Un método para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección por parásitos, que comprende administrar oral, tópica o parenteralmente o aplicar a los animales una cantidad efectiva antiparasitaria de un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20, o un enantiómero, diastereómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo.

38. Un procedimiento para la obtención de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección por parásitos, que comprende una cantidad efectiva antiparasitaria de un compuesto de 1-(azolin-2-il)-amino-1-fenil-2-hetaril-etano de la fórmula I, tal y como se define en
- 5 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 20 o un enantiómero, diastereómero y/o una sal veterinariamente aceptable del mismo.

354

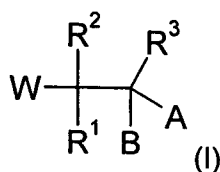
Resumen

La presente invención se refiere a compuestos de 1-(azolin-2-il)-amino-alcano, que son útiles para combatir insectos, arácnidos y nemátodos.

- 5 La presente invención también se refiere a un método para combatir plagas animales seleccionados entre insectos, arácnidos y nemátodos, y a una composición agrícola para combatir plagas animales.

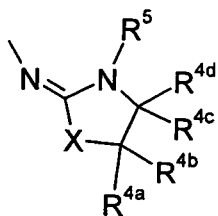
Se ha encontrado que plagas animales pueden combatirse con compuestos de 1-

- 10 (azolin-2-il)-amino-alcano de la fórmula general I:

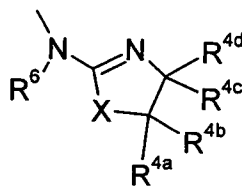


- 15 en donde

A es un radical de las fórmulas A¹ o A²:



A¹



A²

20

y en donde

355

PF 57476

193

X es azufre o oxígeno y W, B y R¹ a R⁶ tienen las definiciones indicadas en la descripción.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/069525

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D417/12

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)
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 2005/063724 A1 (BASF AG [DE]; KORDES MARKUS [DE]; HOFMANN MICHAEL [DE]; PUHL MICHAEL []) 14 July 2005 (2005-07-14) cited in the application abstract; claim 1	1-38
A	JENNINGS K R ET AL: "A BIORATIONALLY SYNTHESIZED OCTOPAMINERGIC INSECTICIDE: 2-(4-CHLORO-O-TOLUIDINO)-2-OXAZOLINE" PESTICIDE BIOCHEMISTRY AND PHYSIOLOGY, ACADEMIC PRESS, US, vol. 30, no. 2, 1988, pages 190-197, XP009046959 ISSN: 0048-3575 Table on p. 193	1-38

☐ 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.

G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

19 March 2007

Date of mailing of the international search report

23/03/2007

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

Wolf, Claudia

357

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2006/069525

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.: 23-27, 35-37
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Although claims 23-27 and 35-37 are directed to a method of treatment of the human/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.

358

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/069525

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005063724 A1	14-07-2005	AR 047342 A1	18-01-2006
		AU 2004309067 A1	14-07-2005
		CA 2548322 A1	14-07-2005
		CN 1898218 A	17-01-2007
		EP 1713786 A1	25-10-2006
		KR 20060123373 A	01-12-2006
		MX PA06006501 A	23-08-2006

359

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE

(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BASF SE
67056 Ludwigshafen
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 11 April 2008 (11.04.2008)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference 0000057476	
International application No. PCT/EP2006/069525	International filing date (day/month/year) 11 December 2006 (11.12.2006)

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:
The above change has also been recorded in respect of the common representative, as indicated in the addressee box at the top of this form.

4. A copy of this notification has been sent to:

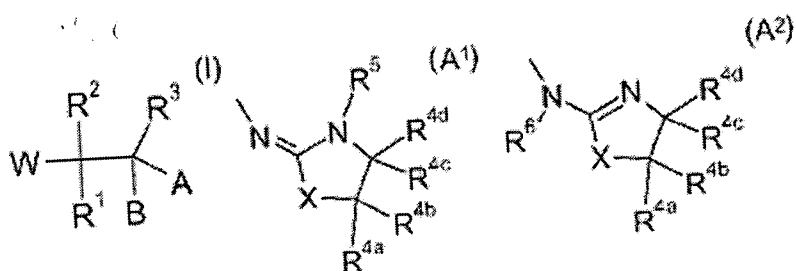
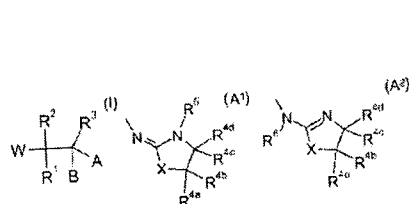
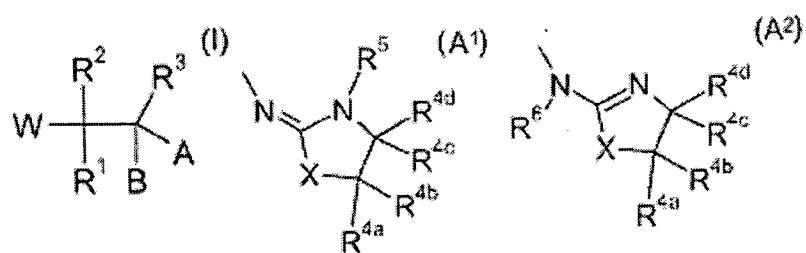
☒ the receiving Office	☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority	☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority	☐ other:

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Nissen Diana e-mail Diana.Nissen@wipo.int Telephone No. +41 22 338 80 54

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Form PCT/IB/306 (October 2005)

I/DMANIIPQ2



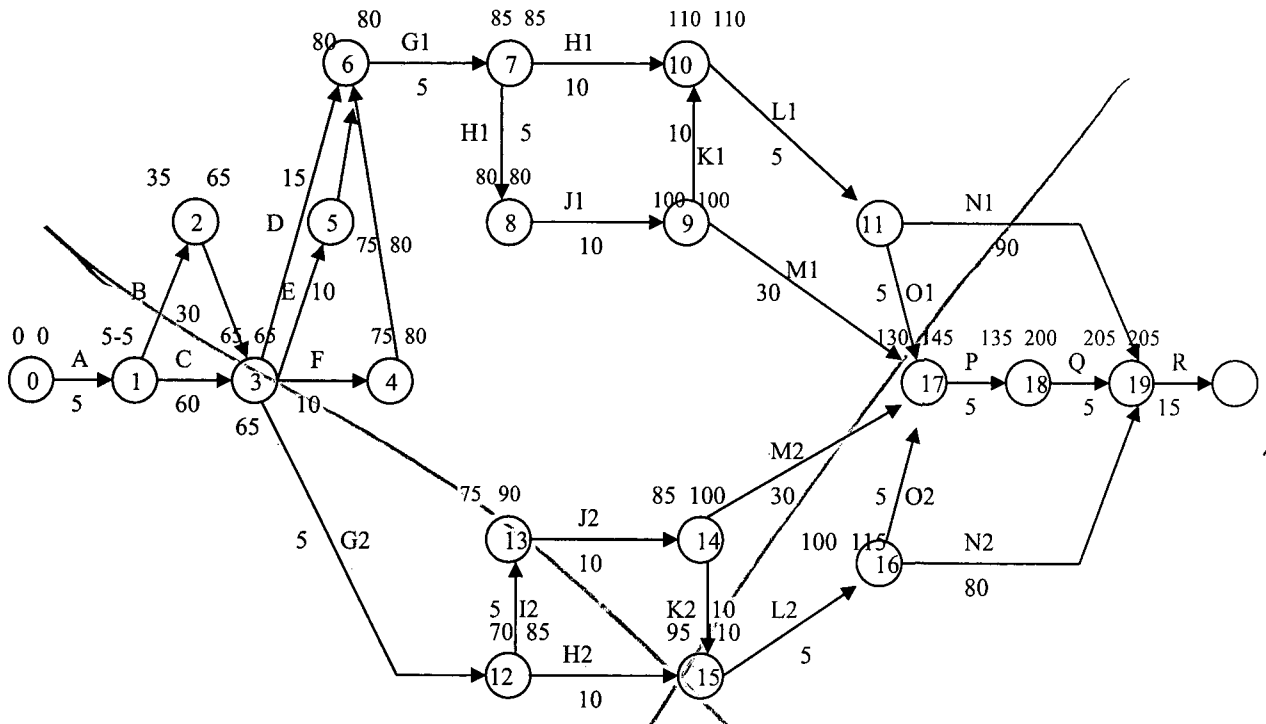


FIG. 11 RUTA CRITICA

362

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075128- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:26:00 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 362

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 56,241
: JULIO 14 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2678330	14/07/2008	20,595,000.00

***** CONCEPTO *****

CNT.	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.

366 16452-841-004-0

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-075128- -00000-0000

Fecha: 2008-07-21 16:26:00 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 362

Industria 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 []

Firma Responsable

Fecha Julio 21-08

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