



CSA295667

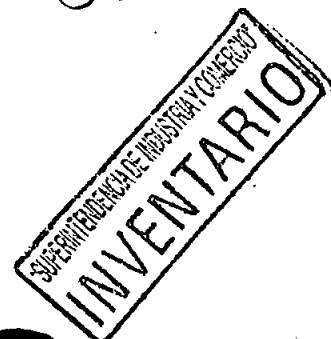


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones



PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

09-25822

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

COMPUESTOS DE QUINOLINILMETILO

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. 09-025822--00000-0000

Fecha: 2009-03-12 16:59:06 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 411 PRESENTACION Folios: 295

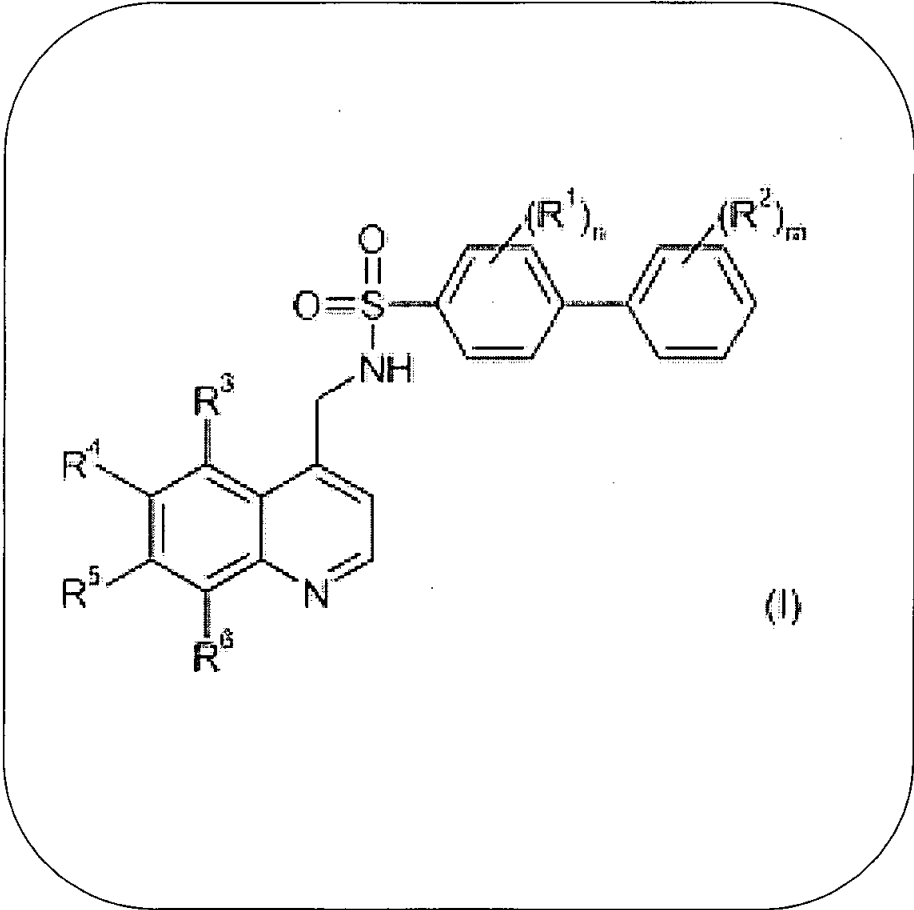
FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

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: clientes@cavelier.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número 438.019 T.P 31.929
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Michael PUHL Bürstädter Strasse 95, 68623 Lampertheim, Alemania 3. Michael RACK Hildastrasse 11/1, 69214 Eppelheim, Alemania 5. Wassilios GRAMMENOS Alexander-Fleming Strasse 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania 7. Jürgen LANGEWALD Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim, Alemania 9. Hassan OLOUMI-SADEGHI 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, Carolina del Norte 27614, Estados Unidos de América 11. Deborah L. CULBERTSON 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, Carolina del Norte 27526 2. Liliana PARRA RAPADO Zeller Strasse 14, 77654 Offenburg, Alemania 4. Jan Klaas LOHMANN Gräfenaustrasse 20, 67063 Ludwigshafen, Alemania 6. Wolfgang VON DEYN An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania 8. Ernst BAUMANN Falkenstrasse 6a, 67373 Dudenhofen, Alemania 10. Douglas D. ANSPAUGH 4007 Winecott Drive, Apex, Carolina del Norte 27502, Estados Unidos de América	

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2007/059538</u> Fecha: <u>11 de septiembre de 2007</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2008/031824 A1</u> Fecha: <u>20 de marzo de 2008</u>		
6	Título (54) <u>COMPUESTOS DE QUINOLINILMETILO</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 215/012</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>US</u>	(32) Fecha <u>12 de septiembre de 2006</u>
			(31) Número de Solicitud <u>60/844,023</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>09-16,805</u> Fecha: <u>2 de marzo de 2009</u> <u>09-16,768</u> <u>2 de marzo de 2009</u> <u>09-12,696</u> <u>16 de febrero de 2009</u> <u>09-12,695</u> <u>16 de febrero de 2009</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 540.000.oo. ☒ Comprobante de pago por 11 reivindicaciones adicionales después de la decimoquinta reivindicación por \$275.000.oo. ☒ 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

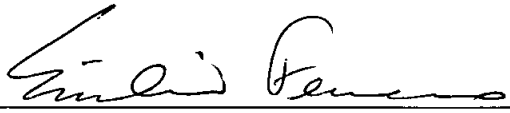
FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA: 
C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

JGG

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2008/031824 A1

Descripción:

Páginas 82 en el idioma original

Páginas 135 en español

Reivindicaciones: Número (s) 26

Figuras: Número (s)

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

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

4. ☒ Extracto de publicación.

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

5

1337

ci
ales
tos
prom
susti
proc
age

ER
JS
SKI
72-35
OMBIA

179

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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER- OF- ATTORNEY

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

16452
6637

BASF SE

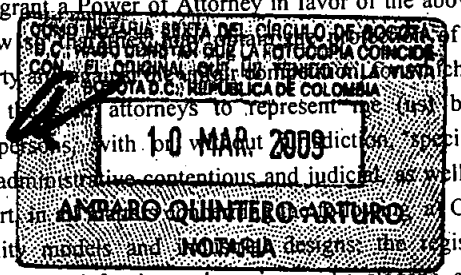
domiciliado (s) en/of 67056 Ludwigshafen, Germany

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 faltare 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 of my (our) industrial property matters with purpose I (we) authorize the attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, especially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court in the 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, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con los derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos muevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan tutelar este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del caso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de antes mencionados.

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

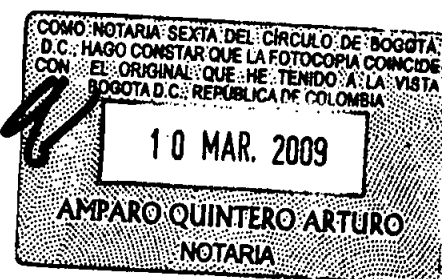


Dr. Thomas Cimniak



Dr. Alexander Wallon

directors



7

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

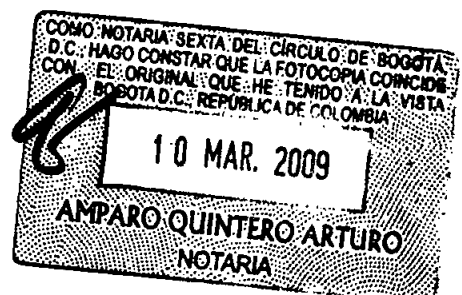
BASF SE (Societas Europaea = European Company), Ludwigshafen/Rhine. I certify that this firm is a legal person duly organized under the laws of the Federal Republic of Germany and under the laws of the EUROPEAN UNION and that it is registered at the District Court of Ludwigshafen/Germany (**HR B 6000**).

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



notary public

Wert: 5.112,92 Euro



APOSTILLE

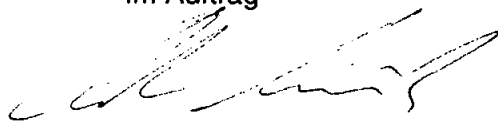
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Bestätigt

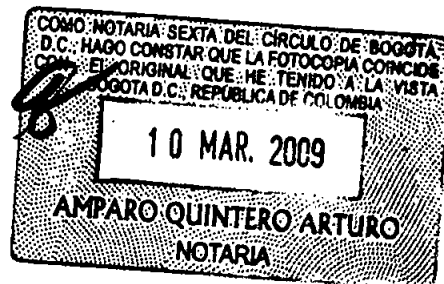
5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 7. April 2008
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 511/08

9. Siegel/Stempel:
10. Unterschrift
Im Auftrag



(Christian Köneke)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,-- €



Beglaubigte Abschrift

Bescheinigung gemäß § 21 BNotO
über die Rechtsnachfolge der
BASF Aktiengesellschaft

1. **BASF Aktiengesellschaft**

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

2. **BASF SE**

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

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

Die BASF SE ist deshalb Rechtsnachfolgerin der BASF Aktiengesellschaft.

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

3. **Nachweis**

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

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



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.

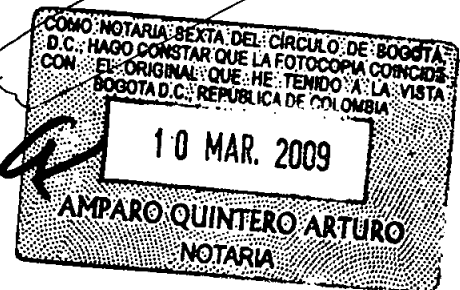
Therefore, BASF SE is the legal successor of BASF Aktiengesellschaft.

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 aforescribed 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



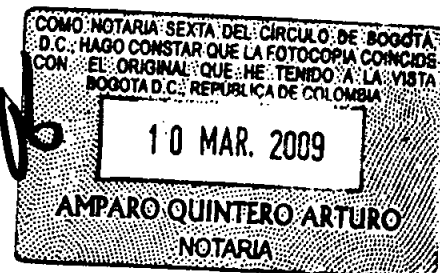
Gebührenwert: 2.000,--EUR

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

Value of fee: 2.000,--EUR



APOSTILLE

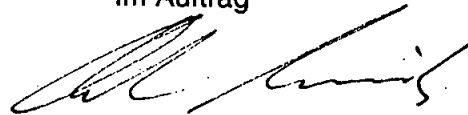
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 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

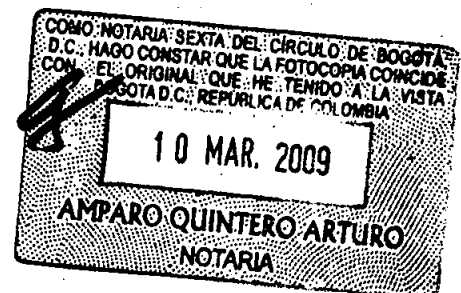
- 5. in Frankenthal (Pfalz)
- 6. am 7. April 2008
- 7. durch den Präsidenten des Landgerichts
- 8. unter Nr. 91 Eb - 512/08

- 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.

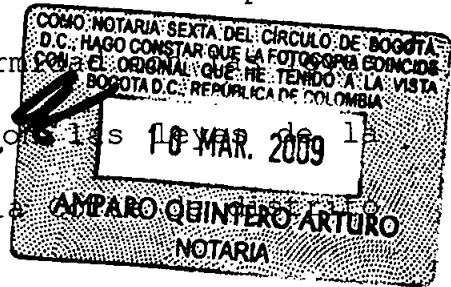
Los químicos graduados, doctores Cimniak y Wallon actúan a nombre de BASF SE en Ludwigshafen/Rhine.

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

de la República Federal de Alemania y con la UNION EUROPEA y que está registrada en la 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 Calado N.

Eduardo Calado N.
•TRADUCTOR OFICIAL
INGLES - ESPAÑOL - INGLÉS
Res. 541 febrero de 1977

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
BOGOTÁ D.C.
12 MAY 12 11:06

760675
Eduardo Calado
BOGOTÁ D.C.
ESTADOS UNIDOS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL FIRME

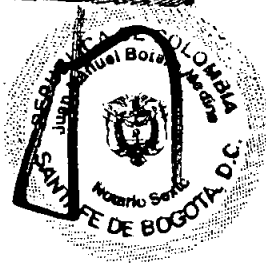
COMO NOTARIA SEXTA DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTÁ D.C. REPÚBLICA DE COLOMBIA
10 MAR. 2009
AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

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

Gerardo Celis
Doguera

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

 A. SOLEZ JORGE CIVILIS



COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

10 MAR. 2009

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

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
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)

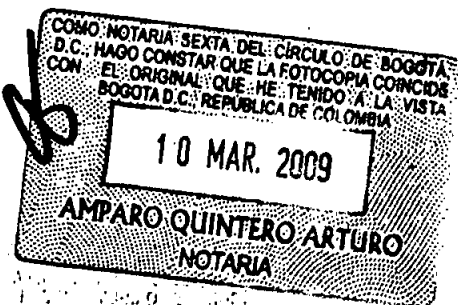
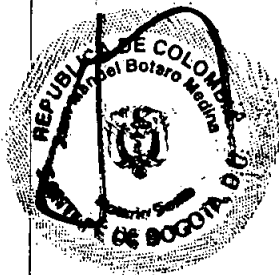
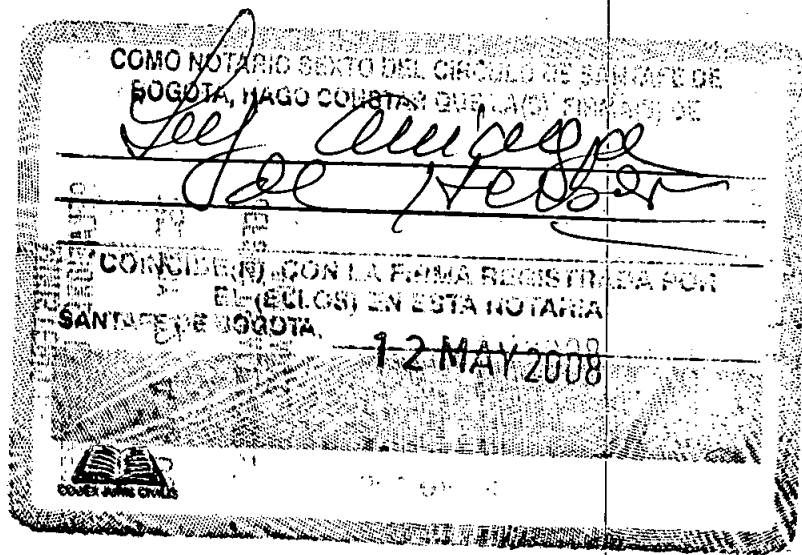
- 10. Firma
p.e. Fdo.: firma ilegible
(Christian Köneke)
Juez del Tribunal Regional

Costas:
COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA DE ESTOS 12,00 €
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

10 MAR. 2009

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

Luz Arriaga de Herber
TRADUCTORA INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. 599 del 6 de marzo 1978



Copia certificada

Certificación según § 21 Reglamento federal notarial (BnotO) sobre la sucesión legal de BASF Aktiengesellschaft.

1. BASF Aktiengesellschaft

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

2 BASF SE

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

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

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

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

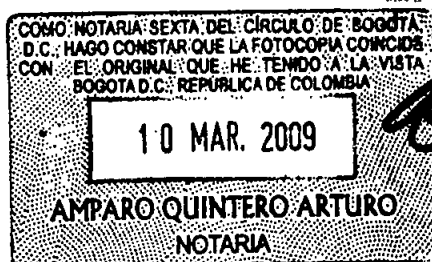
3. Certificación

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

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

Fdo.: firma ilegible
Notario

(sello redondo en tinta)
Ludwig Draxel-Fischer



(dorso)
Se certifica que la copia antecedente coincide con su original.
Ludwigshafen am Rhein
(República Federal de Alemania)
22 de enero de 2008.

Fdo.: firma ilegible
Notario

(sello redondo en tinta)
Ludwig Draxel-Fischer

Derechos: 2.000,-- Euros

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

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

Certificado

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

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

Costas:
Derechos 10,00 €

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
BOGOTÁ D.C.
2009 MAY 12
A 11:06
JEFES DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

BOGOTÁ D.C.
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO
760677
Luz Arriaga

COMO NOTARIA: SEXTA DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTÁ D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA
10 MAR. 2009
AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

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

Luz Arriaga
Traducción a Interprete Oficial
Bogotá, No. 1, 11-11-2008

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

[Handwritten signatures]

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

SANTAFE DE BOGOTA 12 MAY 2008



COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTÁ D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA BOGOTÁ D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

10 MAR. 2009

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

lf
56

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

CESION

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

domiciliado(s) en

ASSIGNMENT

I (we), the undersigned

Michael Puhl
Bürstädter Str. 95, 68623 Lampertheim
Germany
Citizen of Germany

Liliana Parra Rapado
Zeller Str.14, 77654 Offenburg
Germany
Citizen of Spain

Michael Rack
Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim
Germany
Citizen of Germany

Jan Klaas Lohmann
Gräfenaustr. 20, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany

Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece

Wolfgang von Deyn
An der Bleiche 24, 67435 Neustadt
Germany
Citizen of Germany

Jürgen-Langewald
Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

Ernst Baumann
Falkenstr.6a, 67373 Dudenhofen
Germany
Citizen of Germany

Hassan Oloumi-Sadeghi
12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614
United States of America
Citizen of United States of America

Douglas D. Anspaugh
4007 Winecott Drive, Apex, NC 27502
United States of America
Citizen of United States of America

12

domiciliado(s) en

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

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:

Quinolinylmethyl compounds

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

constituída y existente de conformidad con las leyes de

BASF Aktiengesellschaft

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.

28

Dado y firmado hoy

Given and signed this

04. Okt. 2007

Firma

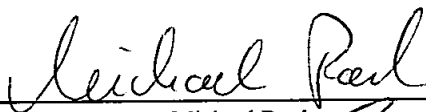
Signature



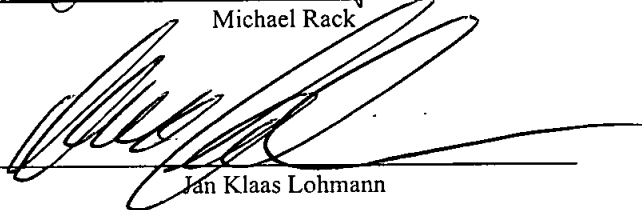
Michael Puhl



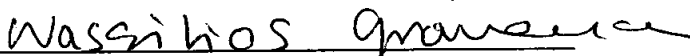
Liliana Parra Rapado



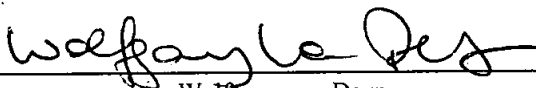
Michael Rack



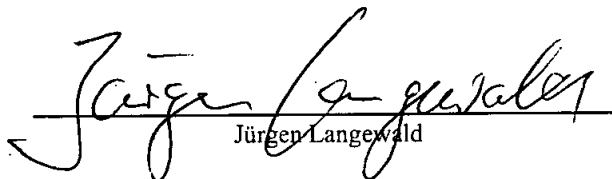
Jan Klaas Lohmann



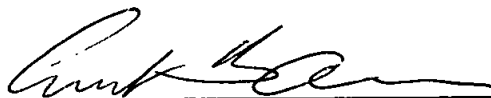
Wassilios Grammenos



Wolfgang von Deyn



Jürgen Langewald



Ernst Baumann

29

Hassan Oloumi-Sadeghi

Douglas D. Anspaugh

Deborah L. Culbertson

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

U.R.Nr. 2272/2007

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

1. Mr. Michael **Puhl**, residing at Bürstädter Str. 95, 68623 Lampertheim, Germany, personally known to me,
2. Mrs. Lilitana **Parra Rapado**, residing at Zeller Str. 14, 77654 Offenburg, Germany, Citizen of Spain, personally known to me,
3. Mr. Michael **Rack**, residing at Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim, Germany, personally known to me,
4. Mr. Jan Klaas **Lohmann**, residing at Gräfenaustraße 20, 67063 Ludwigshafen, Germany, personally known to me,
5. Mr. Wassilios **Grammenos**, residing at Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Germany, Citizen of Greece, personally known to me,
6. Mr. Wolfgang **von Deyn**, residing at An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Germany, personally known to me,
7. Mr. Jürgen **Langewald**, residing at Beethovenstraße 5, 68165 Mannheim, Germany, personally known to me,
8. Mr. Ernst **Baumann**, residing at Falkenstr. 6a, 67373 Dudenhofen, Germany, personally known to me,

are true and valid.

Ludwigshafen/Rhine, this 4th day of October, 2007



notary public

Wert 5.112,92 €

APOSTILLE

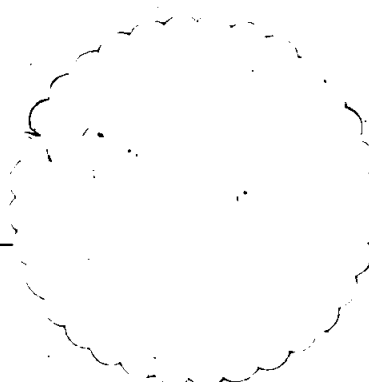
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

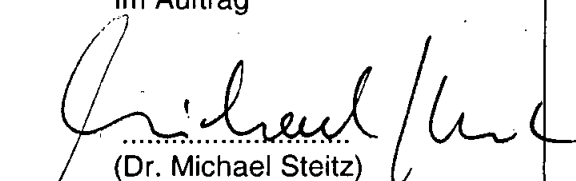
1. Land : Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Notar
D r a x e l - F i s c h e r
3. in seiner Eigenschaft als
öffentlicher Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel
des Notars Ludwig Draxel-Fischer
in Ludwigshafen am Rhein

Bestätigt

5. in Frankenthal (Pfalz)
6. am 8. Oktober 2007
7. durch den Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Eb - 1340/07

- | | |
|--------------------|------------------|
| 9. Siegel/Stempel: | 10. Unterschrift |
| | Im Auftrag |




.....
(Dr. Michael Steitz)
Richter am Landgericht

Kostenvermerk:
Gebühr 12,00 €

STATE OF NORTH CAROLINA



Department of The
Secretary of State

APOSTILLE

(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by NICOLE WISE
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 18TH DAY OF SEPTEMBER, 2007
7. by Secretary of State or Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 21453
9. Seal/Stamp
10. Signature

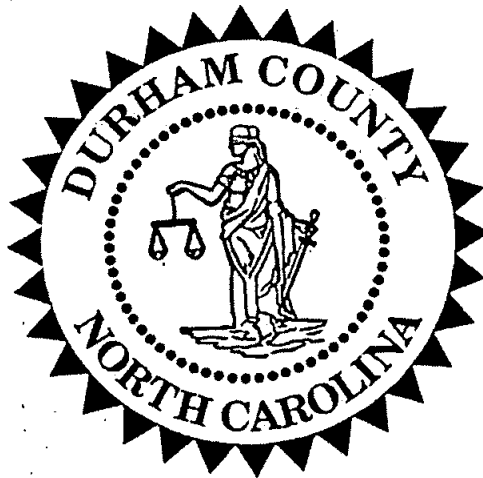


By:

Haley Haynes
Haley Haynes
Deputy Secretary of State

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 12th day of September, 2007.

Willie L. Covington
Register of Deeds

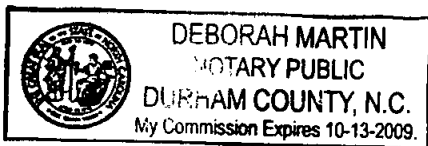
BY Nicole Wise
Nicole Wise, Deputy Register of Deeds



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

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 27th day of August 2007



Deborah Martin
Signature of Notary Public

Name: Deborah Martin

My Commission Expires October 13, 2009

AUTHENTICATION
CERTIFICATE
ATTACHED

STATE OF NORTH CAROLINA



Department of The
Secretary of State

APOSTILLE

(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by NICOLE WISE
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 18TH DAY OF SEPTEMBER, 2007
7. by Secretary of State or Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 21454
9. Seal/Stamp
10. Signature



By:

Haley Haynes
Haley Haynes
Deputy Secretary of State

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 12th day of September, 2007.

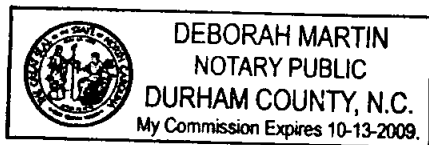
Willie L. Covington
Register of Deeds

BY Nicole Wise
Nicole Wise, Deputy Register of Deeds

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

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

Witness my hand and official seal
this 5th day of September 2007



Deborah Martin
Signature of Notary Public

Name: Deborah Martin

My Commission Expires October 13, 2009.

AUTHENTICATION
CERTIFICATE
ATTACHED

STATE OF NORTH CAROLINA



Department of The
Secretary of State

APOSTILLE

(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by NICOLE WISE
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 18TH DAY OF SEPTEMBER, 2007
7. by Secretary of State or Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 21455
9. Seal/Stamp
10. Signature



By:

Haley Haynes
Haley Haynes
Deputy Secretary of State

Elaine 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 12th day of September, 2007.

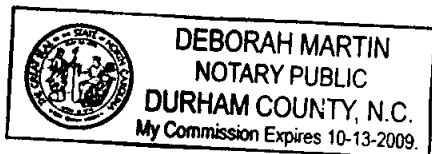
Willie L. Covington
Register of Deeds

BY Nicole Wise
Nicole Wise, Deputy Register of Deeds

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

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

Witness my hand and official seal
this 27th day of August 2007



Deborah Martin
Signature of Notary Public

Name: Deborah Martin

My Commission Expires October 13, 2009.



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

CESION

Yo, (nosotros), abajo firmado(s)

domiciliado(s) en

ASSIGNMENT

I (we), the undersigned

Michael Puhl
Bürstädter Str. 95, 68623 Lampertheim
Germany
Citizen of Germany

Liliana Parra Rapado
Zeller Str.14, 77654 Offenburg
Germany
Citizen of Spain

Michael Rack
Hildastr. 11/1, 69214 Eppenheim
Germany
Citizen of Germany

Jan Klaas Lohmann
Gräfenaustr. 20, 67063 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Germany

Wassilios Grammenos
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen
Germany
Citizen of Greece

Wolfgang von Deyn
An der Bleiche 24, 67435 Neustadt
Germany
Citizen of Germany

Jürgen Langewald
Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim
Germany
Citizen of Germany

Ernst Baumann
Falkenstr.6a, 67373 Dudenhofen
Germany
Citizen of Germany

Hassan Oloumi-Sadeghi
12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614
United States of America
Citizen of United States of America

Douglas D. Anspaugh
4007 Winecott Drive, Apex, NC 27502
United States of America
Citizen of United States of America

domiciliado(s) en

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

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:

Quinolinylmethyl compounds

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.

Dado y firmado hoy

Given and signed this

Firma

Signature

Michael Puhl

Liliana Parra Rapado

Michael Rack

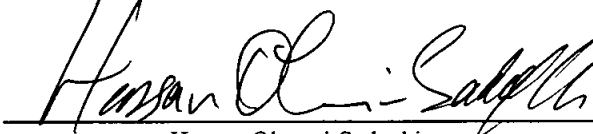
Jan Klaas Lohmann

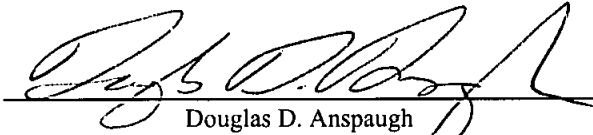
Wassilios Grammenos

Wolfgang von Deyn

Jürgen Langewald

Ernst Baumann


Hassan Oloumi-Sadeghi


Douglas D. Anspaugh


Deborah L. Culbertson

Notarization and legalized by means of Apostille

© CAVELIER ABOGADOS
WPPODERE-343

CO Assignment Form 01 11/98

35

La presente traducción oficial No. 0020/09 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 al Protocolo Notarial No. 2272/2007 en idioma inglés, en un DOCUMENTO DE CESIÓN.

APOSTILLA

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

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

Certificado

5. en Frankenthal (Pfalz)
6. el 8 de octubre de 2007
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No. 91 Eb - 1340/07

9. Sello/timbre

10. Firma

En representación:

(Dr. Michael Steitz)
Juez del Tribunal Regional

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

884683

Hernando Torres
BARRERA

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

SELO: 2009 MAR -6

JEF. DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

Bogotá, D.C., 2 de marzo de 2009

Anotación de Gastos Notariales:
Tasa 12,00 €

PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN FRANKENTHAL (PFALZ) *

Hernando Torres Barrera
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
RES. No. 1305 MINJUSTICIA 1998

TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

EL TEXTO QUE SIGUE ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLES Y FRANCES. LLEVA LA FIRMA Y EL SELLO DE HELENA URIBE DE LEMOINE, TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL, SEGUN RESOLUCION NO. 3618 DEL MINISTERIO DE JUSTICIA DE COLOMBIA, DE FECHA 6 DE SEPTIEMBRE DE 1972.

CESION

Nosotros los abajo firmantes:

MICHAEL PUHL, Bürstädter str. 95, 68623 Lampertheim, Alemania, ciudadano alemán

LILIANA PARRA RAPADO Zeller Str. 14, 77654 Offenburg, Alemania, ciudadana española

MICHAEL RACK, Hildasr. 11/1. 69214 Eppelheim, Alemania, ciudadano Alemán.

JAN KLAAS LOHMANN, Gräfenaustr. 20, 67063 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano alemán

WASSILIOS GRAMMENOS, Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano griego

WOLFGANG VON DEYN, An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania, ciudadano alemán.

JURGEN LANGEWALD, Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim, Alemania, ciudadano alemán

ERNST BAUMANN, Falkenstr. 667373 Dudenhofen, Alemania, ciudadano alemán

HASSAN OLOUMI-SADEGHI, 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614, Estados Unidos de América, ciudadano norteamericano.

DOUGLAS D. ANSPAUGH, 4007 Winecott Drive, Apex, NC 27502, Estados Unidos de América, ciudadano norteamericano.

DEBORAH L. CULBERTSON, 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526, Estados Unidos de América, ciudadana norteamericana.

Declaramos bajo juramento ser los únicos y verdaderos inventores de la invención:

COMPUESTOS DE QUINOLINILMETIL

Declaramos así mismo que cedemos y transferimos sin limitación favor de la sociedad

BASF Aktiengesellschaft



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

Constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención y que la citada Compañía queda facultada para solicitar en su nombre la patente correspondiente en la República de Colombia.

DADOY FIRMADO HOY 4 DE OCTUBRE DE 2007

FIRMADO: MICHAEL PUHL

FIRMADO: LILIANA PARRA RAPADO

FIRMADO: MICHAEL RACK

FIRMADO: JAN KLASS LOHMANN

FIRMADO: WASSILIOS GRAMMENOS

FIRMADO: WOLFGANG VON DEYN

FIRMADO: JURGEN LANGEWALD

FIRMADO: ERNST BAUMANN

UR. NO. 2272/2007

YO, LUDWING DRAXEL-FISCHER, Notario Público en Lwdwigshafen/Rhine, República Federal de Alemania, por medio del presente certifico y confirmo que las anteriores firmas correspondientes a:

1. Señor **MICHAEL PUHL**, residente en Bürstädter Str. 85, 68623 Lampertheim, Alemania, a quien conozco personalmente.
2. Señora **LILIANA PARRA RAPADO**, residente en Zeller Str. 14, 77654 Offenburg, Alemania, Ciudadana española a quien conozco personalmente.
3. Señor **MICHAEL RACK**, residente en HildastraBe 11/1, 69214 Eppelheim, Alemania, a quien conozco personalmente.
4. Señor **JAN KLAAS LOHMANN**, residente en en Gräfenau-straBe 20, 67063 Ludwigshafen, Alemania a quien conozco personalmente.



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

5. Señor **WASSILIOS GRAMMENOS**, residente en Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano Greco, a quien conozco personalmente.
6. Señor **WOLFGANG VON DEYN**, residente en An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania, a quien conozco personalmente.
7. Señor **JURGEN LANGEWALD**, residente en Beethoven-StraBe 5, 68165 Mannheim, Alemania, a quien conozco personalmente
8. Señor **ERNST BAUMANN**, residente en FalkenstraBe 6ª, 67373 Dudenhofen/Alemania, a quien conozco personalmente,

son fidedignas y válidas.

Ludwigshafen/Rhine, 4 de Octubre de de 2007.

FIRMADO: (ILEGIBLE) LUDWIG DRAXEL-FISCHER, NOTARIO PUBLICO.

SIGUE APOSTILLA NUMERO **91 Eb-1340/07** DEL 8 DE OCTUBRE DE 2007 POR MEDIO DE LA CUAL SE AUTENTICA LA FIRMA DEL NOTARIO **LUDWIG DRAXEL-FISCHER**, EFECTUADA POR DR. MICHAEL STEITZ, PRESIDENTE DEL TERRITORIO.

LA TRADUCTORA OFICIAL

Helena Uribe de Lemoine

HELENA URIBE DE LEMOINE



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

CESION

Nosotros los abajo firmantes:

MICHAEL PUHL, Bürstädter str. 95, 68623 Lampertheim, Alemania, ciudadano alemán

LILIANA PARRA RAPADO Zeller Str. 14, 77654 Offenburg, Alemania, ciudadana española

MICHAEL RACK, Hildasr. 11/1. 69214 Eppelheim, Alemania, ciudadano Alemán.

JAN KLAAS LOHMANN, Gräfenaustr. 20, 67063 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano alemán

WASSILIOS GRAMMENOS, Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen, Alemania, ciudadano griego

WOLFGANG VON DEYN, An der Bleiche 24, 67435 Neustadt, Alemania, ciudadano alemán.

JURGEN LANGEWALD, Beethovenstrasse 5, 68165 Mannheim, Alemania, ciudadano alemán

ERNST BAUMANN, Falkenstr. 667373 Dudenhofen, Alemania, ciudadano alemán

HASSAN OLOUMI-SADEGHI, 12105 Pawley's Mill Circle, Raleigh, NC 27614, Estados Unidos de América, ciudadano norteamericano.

DOUGLAS D. ANSPAUGH, 4007 Winecott Drive, Apex, NC 27502, Estados Unidos de América, ciudadano norteamericano.

DEBORAH L. CULBERTSON, 6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526, Estados Unidos de América, ciudadana norteamericana.

Declaramos bajo juramento ser los únicos y verdaderos inventores de la invención:

COMPUESTOS DE QUINOLINILMETIL

Declaramos así mismo que cedemos y transferimos sin limitación favor de la sociedad

BASF Aktiengesellschaft

Constituida y existente de conformidad con las leyes de Alemania, domiciliada en 67056 Ludwigshafen, Alemania,



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

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.

FIRMADO: HASSAN OLOUMI-SADEGHI

FIRMADO: DOUGLAS D. ANSPAUGH

FIRMADO: DEBORAH L. CULBERTSON

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
CONDADO DE DURHAM

YO, **DEBORAH MARTIN**, NOTARIO PUBLICO PARA LA MENCIONADA JURISDICCION, POR MEDIO DEL PRESENTE CERTIFICO QUE **DOUGLAS D. ANSPAUGH** COMPARECIO ANTE MI ESTE DIA Y RECONOCIO LA DEBIDA EJECUCION DEL ANTERIOR DOCUMENTO.

EN TESTIMONIO DE LO ANTERIOR FIRMO Y COLOCO EL SELLO OFICIAL ESTE DIA 5 DE SEPTIEMBRE DE 2007.

FIRMADO: DEBORAH MARTIN, NOTARIO PUBLICO, CON COMISION HASTA EL 13 DE OCTUBRE DE 2009.

HAY SELLO EN RELIEVE DEL NOTARIO.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
CONDADO DE DURHAM
OFICINA DE REGISTRO DE ESCRITURAS
CERTIFICACION DE NOTARIO

YO, **WILLIE L. COVINGTON**, REGISTRADOR DE ESCRITURAS DEL CONDADO Y ESTADOS MENCIONADOS, POR MEDIO DEL PRESENTE CERTIFICO QUE DEBORAH MARTIN ERA EN EL MOMENTO DE FIRMAR ESTE DOCUMENTO **NOTARIO PUBLICO** DEBIDAMENTE COMISIONADO EN Y PARA EL CONDADO DE DURHAM, ESTADO DE CAROLINA DE NORTE.

EN TESTIMONIO DE LO ANTERIOR FIRMO Y COLOCO EL SELLO OFICIAL ESTE DIA 12 DE SEPTIEMBRE DE 2007.

FIRMADO: NICOLE WISE, DELEGADO DEL REGISTRADOR DE ESCRITURAS
HAY SELLO EN RELIEVE DEL CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE.



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
DEPARTAMENTO DEL SECRETARIO DE ESTADO

APOSTILLA

CONVENIO DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961

1. PAIS: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

EL PRESENTE DOCUMENTO PUBLICO

2. HA SIDO FIRMADO POR: **NICOLE WISE**
3. ACTUANDO EN SU CAPACIDAD DE: DELEGADO DEL REGISTRADOR
DE INSTRUMENTOS PUBLICOS
4. LLEVA EL SELLO DE: WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE
INSTRUMENTOS PUBLICOS, CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL
NORTE.

CERTIFICADO

5. EN: RALEIGH, CAROLINA DEL NORTE
6. EL: 18 DE SEPTIEMBRE DE 2007
7. POR: EL SECRETARIO DE ESTADO O EL SECRETARIO DE ESTADO
DELEGADO, DEL ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
8. BAJO EL NO.: **21454**
9. SELLO: SECRETARIO DE ESTADO, ESTADO DE CAROLINA DEL
NORTE
10. POR: ELAINE Z. MARSHALL. SECRETARIO DE ESTADO
HALEY HAYNES, SECRETARIO DE ESTADO DELEGADO

LA TRADUCTORA OFICIAL

Helena Uribe de Lemoine

HELENA URIBE DE LEMOINE



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
CONDADO DE DURHAM

YO, **DEBORAH MARTIN**, NOTARIO PUBLICO PARA LA MENCIONADA JURISDICCION, POR MEDIO DEL PRESENTE CERTIFICO QUE **DEBORAH L. CULBERTSON** COMPARECIO ANTE MI ESTE DIA Y RECONOCIO LA DEBIDA EJECUCION DEL ANTERIOR DOCUMENTO.

EN TESTIMONIO DE LO ANTERIOR FIRMO Y COLOCO EL SELLO OFICIAL ESTE DIA 27 DE AGOSTO DE 2007.

FIRMADO: DEBORAH MARTIN, NOTARIO PUBLICO, CON COMISION HASTA EL 13 DE OCTUBRE DE 2009.

HAY SELLO EN RELIEVE DEL NOTARIO.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
CONDADO DE DURHAM
OFICINA DE REGISTRO DE ESCRITURAS
CERTIFICACION DE NOTARIO

YO, **WILLIE L. COVINGTON**, REGISTRADOR DE ESCRITURAS DEL CONDADO Y ESTADOS MENCIONADOS, POR MEDIO DEL PRESENTE CERTIFICO QUE DEBORAH MARTIN ERA EN EL MOMENTO DE FIRMAR ESTE DOCUMENTO **NOTARIO PUBLICO** DEBIDAMENTE COMISIONADO EN Y PARA EL CONDADO DE DURHAM, ESTADO DE CAROLINA DE NORTE.

EN TESTIMONIO DE LO ANTERIOR FIRMO Y COLOCO EL SELLO OFICIAL ESTE DIA 12 DE SEPTIEMBRE DE 2007.

POR WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE ESCRITURAS

FIRMADO: NICOLE WISE, REGISTRADOR DELEGADO DE ESCRITURAS

HAY SELLO EN RELIEVE DEL CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE.



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
DEPARTAMENTO DEL SECRETARIO DE ESTADO

APOSTILLA

CONVENIO DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961

1. PAIS: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

EL PRESENTE DOCUMENTO PUBLICO

2. HA SIDO FIRMADO POR: **NICOLE WISE**
3. ACTUANDO EN SU CAPACIDAD DE: DELEGADO DEL REGISTRADOR
DE INSTRUMENTOS PUBLICOS
4. LLEVA EL SELLO DE: WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE
INSTRUMENTOS PUBLICOS, CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL
NORTE.

CERTIFICADO

5. EN: RALEIGH, CAROLINA DEL NORTE
6. EL: 18 DE SEPTIEMBRE DE 2007
7. POR: EL SECRETARIO DE ESTADO O EL SECRETARIO DE ESTADO
DELEGADO, DEL ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
8. BAJO EL NO.: **21455**
9. SELLO: SECRETARIO DE ESTADO, ESTADO DE CAROLINA DEL
NORTE
10. POR: ELAINE Z. MARSHALL. SECRETARIO DE ESTADO
FIRMADO: HALEY HAYNES, DELEGADO DEL SECRETARIO DE
ESTADO

LA TRADUCTORA OFICIAL

Helena Uribe de Lemoine

HELENA URIBE DE LEMOINE



TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
CONDADO DE DURHAM
OFICINA DE REGISTRO DE ESCRITURAS
CERTIFICACION DE NOTARIO

YO, **WILLIE L. COVINGTON**, REGISTRADOR DE ESCRITURAS DEL CONDADO Y ESTADOS MENCIONADOS, POR MEDIO DEL PRESENTE CERTIFICO QUE DEBORAH MARTIN ERA EN EL MOMENTO DE FIRMAR ESTE DOCUMENTO **NOTARIO PUBLICO** DEBIDAMENTE COMISIONADO EN Y PARA EL CONDADO DE DURHAM, ESTADO DE CAROLINA DE NORTE.

EN TESTIMONIO DE LO ANTERIOR FIRMO Y COLOCO EL SELLO OFICIAL ESTE DIA 12 DE SEPTIEMBRE DE 2007.

POR WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE ESCRITURAS

FIRMADO: NICOLE WISE, REGISTRADOR DE ESCRITURAS DELEGADO

HAY SELLO EN RELIEVE DEL CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE.



45

TRADUCCIÓN OFICIAL NO. 128/2009-.

MINISTERIO DE
ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
DEPARTAMENTO DEL SECRETARIO DE ESTADO

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO

2009 MAR -6 A 11: 26
APOSTILLA
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

884684
Helena Uribe de Lemoine
CUALQUIER FIRMA EN EL
DOCUMENTO QUE EMPLEA
LAS FUNCIONES INDICADAS

CONVENIO DE LA HAYA DEL 5 DE OCTUBRE DE 1961

1. PAIS: ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

EL PRESENTE DOCUMENTO PUBLICO

2. HA SIDO FIRMADO POR: **NICOLE WISE**
3. ACTUANDO EN SU CAPACIDAD DE: DELEGADO DEL REGISTRADOR DE INSTRUMENTOS PUBLICOS
4. LLEVA EL SELLO DE: WILLIE L. COVINGTON, REGISTRADOR DE INSTRUMENTOS PUBLICOS, CONDADO DE DURHAM, CAROLINA DEL NORTE.

CERTIFICADO

5. EN: RALEIGH, CAROLINA DEL NORTE
6. EL: 18 DE SEPTIEMBRE DE 2007
7. POR: EL SECRETARIO DE ESTADO O EL SECRETARIO DE ESTADO DELEGADO, DEL ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
8. BAJO EL NO.: **21453**
9. SELLO: SECRETARIO DE ESTADO, ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE
10. POR: ELAINE Z. MARSHALL. SECRETARIO DE ESTADO
FIRMADO: HALEY HAYNES, DELEGADO DEL SECRETARIO DE ESTADO

LA TRADUCTORA OFICIAL

Helena Uribe de Lemoine

HELENA URIBE DE LEMOINE



(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
20 March 2008 (20.03.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/031824 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 215/12 (2006.01) C07D 215/20 (2006.01)
C07D 215/18 (2006.01)

Ernst [DE/DE]; Falkenstr. 6a, 67373 Dudenhofen (DE).
OLOUMI-SADEGHI, Hassan [US/US]; 12105 Pawley's
Mill Circle, Raleigh, NC 27614 (US). **ANSPAUGH,**
Douglas, D. [US/US]; 4007 Wincott Drive, Apex, NC
27502 (US). **CULBERTSON, Deborah, L.** [US/US];
6400 Vintage Ridge Lane, Fuquay Varina, NC 27526 (US).

(21) International Application Number:
PCT/EP2007/059538

(22) International Filing Date:
11 September 2007 (11.09.2007)

(74) Agent: **REITSTÖTTER, KINZEBACH & PARTNER;**
Ludwigsplatz 4, 67059 Ludwigshafen (DE).

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/844,023 12 September 2006 (12.09.2006) US

(71) Applicant (for all designated States except US): **BASF**
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Lud-
wigshafen (DE).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, 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, LY, MA, MD, ME, 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.

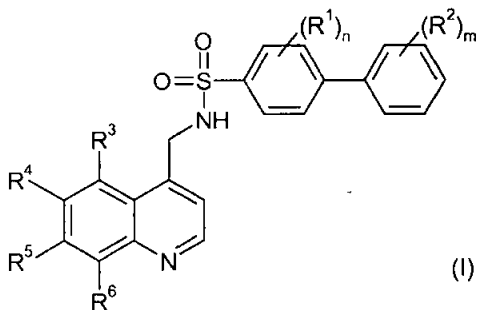
(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **PUHL, Michael**
[DE/DE]; Bürstädter Str. 95, 68623 Lampertheim (DE).
PARRA RAPADO, Liliana [ES/DE]; Zeller Str. 14,
77654 Offenburg (DE). **RACK, Michael** [DE/DE];
Hildastr. 11/1, 69214 Eppelheim (DE). **LOHMANN,**
Jan Klaas [DE/DE]; Gräfenaustr. 20, 67063 Lud-
wigshafen (DE). **GRAMMENOS, Wassilios** [GR/DE];
Alexander-Fleming-Str. 13, 67071 Ludwigshafen (DE).
VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24,
67435 Neustadt (DE). **LANGEWALD, Jürgen** [DE/DE];
Beethovenstr. 5, 68165 Mannheim (DE). **BAUMANN,**

(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, MT, 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

(54) Title: QUINOLINYLMETHYL COMPOUNDS



(57) Abstract: The present invention relates to novel biphenyl-4-sul-
fonicacid (quinolin-4-ylmethyl)- amide compounds of formula (I)
wherein R¹ and R² are halogen, OH, CN, NH₂, NO₂, C₁-C₆-alkyl,
C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₃-C₇-cycloalkyl, C₁-C₆-alkoxy,
C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkyl-
sulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, etc.; R³, R⁴, R⁵, R⁶ are halogen, H,
CN, NH₂, NO₂, OH, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkyl,
C₁-C₆-haloalkoxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkyl-
sulfonyl, etc.; m is 0, 1, 2, 3, 4, or 5; and n is 1 or 2; and the N-oxides
and salts thereof, and their use for combating arthropod pests and
nematodes, and also to compositions comprising such compounds as
active component. The present invention also relates to a method for
controlling arthropod pests or nematode pests.

Quinolinylmethyl compounds

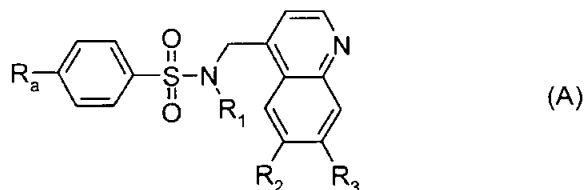
The present invention relates to novel biphenyl-4-sulfonicacid (quinolin-4-ylmethyl)-amide compounds and the N-oxides, and salts thereof and their use for combating arthropod pests and nematodes, and also to compositions comprising such compounds as active component. The present invention also relates to a method for controlling arthropod pests or nematodes.

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

WO 2005/033081 describes fungicidal 4-pyridinylmethylsulfonamide derivatives. Those compounds may carry a benzene ring fused to the pyridine moiety.

WO 2006/097489 (PCT/EP/2006/060753) describes various 4-pyridylmethylamides of biphenylsulfonic acid, wherein the biphenyl moiety may carry substituents at the phenyl ring of the biphenyl moiety at the sulfonamide group. The compounds are used for combating arthropodal pests and for protecting materials against infestation and/or destruction by said pests.

WO 2006/097488 (PCT/EP/2006/060752) inter alia describes arthropodal quinolone compounds of the formula (A),



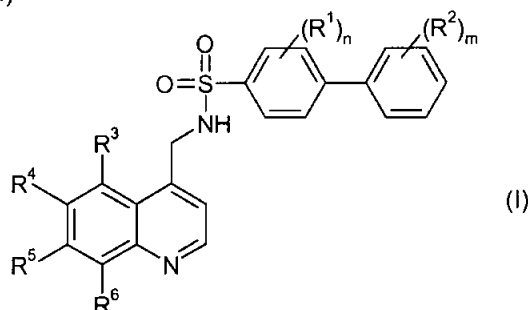
wherein R_2 and R_3 are both hydrogen, halogen, methoxy or trifluoromethoxy, R_1 is hydrogen or methyl and R_a is selected from phenyl which may be unsubstituted or may carry one substituent selected from chloro, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, trifluoromethoxy or phenyl.

US 60/782429 describes specific quinoline methylsulfonamides carrying a biphenyl moiety at the sulfonamide group wherein the phenylene moiety of biphenyl is unsubstituted.

There is an ongoing need to provide compounds which are useful for combating harmful arthropodes such as insects and arachnids. It is desirable that the compounds

have an improved action and/or a broader activity spectrum against harmful arthropodes.

Surprisingly it has been found that this object is achieved by quinoline compounds of formula (I)



5

wherein

- R^1, R^2 are each independently halogen, hydroxy, cyano, amino, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkoxy, $C(OH)(CF_3)_2$, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -haloalkylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfonyl, $C(R^a)=O$ or $C(R^a)=NOR^b$;

- R^a is hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl;
- R^b is hydrogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, or C_2 - C_4 -haloalkenyl;

- R^3, R^4, R^5, R^6 are each independently hydrogen, halogen, cyano, amino, nitro, hydroxy, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -haloalkylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfonyl, or $C(=O)OR^c$;

- R^c is hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, or C_2 - C_6 -alkynyl;
- m is 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- n is 1 or 2;

and the N-oxides or salts thereof.

- Accordingly, the present invention relates to quinoline compounds of the general formula (I) and the N-oxides and salts thereof.

- The compounds of the present invention are also useful for combating arthropod pests and nematode pests. Therefore the present invention also relates to the use of the quinoline compounds of the general formula (I) and their N-oxides and salts for combating arthropod pests or nematode pests.

The present invention furthermore relates to a method for controlling arthropod pests or nematodes, which comprises contacting the insect, arachnid or nematode or their food supply, habitat, breeding ground or their locus with at least one compound of

formula (I) and/or a N-oxide or a salt thereof. Furthermore, the present invention relates to a method for protecting growing plants from attack or infestation by arthropod pests or nematodes, which comprises applying to the plants, or to the soil or water in which they are growing, at least one compound of the formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof. In a preferred embodiment of the above mentioned methods at least one compound of formula (I) and/or N-oxide or the salt thereof or a composition comprising them is applied in an amount of from 5 g/ha to 2000 g/ha, calculated as the compound of formula (I).

Furthermore, the present invention relates to a method for protecting seeds with at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof or a composition containing at least one of these compounds (I) in pesticidally effective amounts. Preferably, at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof or a composition comprising at least one of these compounds is applied in an amount of from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seeds.

Accordingly, a further object of the present invention is seed, comprising at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof, preferably in an amount of from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seeds, calculated as the compound of formula (I).

The present invention also relates to a method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises administering or applying to the animals a parasitically effective amount of at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or a veterinarily acceptable salt thereof.

The present invention also relates to synergistic pesticidal mixtures, comprising a compound of formula (I) and/or a N-oxide or a salt thereof and a pesticide selected from the organo(thio)phosphates, carbamates, pyrethroids, growth regulators, neonicotinoids, nicotinic receptor agonists/antagonists compounds, GABA antagonist compounds, macrocyclic lactone insecticides, METI I, II and III compounds, oxidative phosphorylation inhibitor compounds, moulting disruptor compounds, mixed function oxidase inhibitor compounds, sodium channel blocker compounds, benclothiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, flubendiamide, cyanopyrafen, flupyrazofos, cyflumetofen, amidoflumet, anthranilamides and N-R'-2,2-dihalo-1-R"-cyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')-propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone, wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl.

Depending on the substitution pattern, the compounds of the formula (I) and their N-oxides may have one or more centers of chirality, in which case they are present as pure enantiomers or pure diastereomers or as enantiomer or diastereomer mixtures.

Both, the pure enantiomers or diastereomers and their mixtures are subject matter of the present invention.

Agriculturally useful salts of the compounds (I) encompass especially the salts of those cations or the acid addition salts of those acids whose cations and anions, respectively, have no adverse effect on the pesticidal action of the compounds (I). Suitable cations are thus in particular the ions of the alkali metals, preferably sodium and potassium, of the alkaline earth metals, preferably calcium, magnesium and barium, of the transition metals, preferably manganese, copper, zinc and iron, and also the ammonium ion which, if desired, may carry one to four C₁-C₄-alkyl substituents and/or one phenyl or benzyl substituent, preferably diisopropylammonium, tetramethylammonium, tetrabutylammonium, trimethylbenzylammonium, furthermore phosphonium ions, sulfonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium, and sulfoxonium ions, preferably tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium.

Anions of useful acid addition salts are primarily chloride, bromide, fluoride, hydrogensulfate, sulfate, dihydrogenphosphate, hydrogenphosphate, phosphate, nitrate, bicarbonate, carbonate, hexafluorosilicate, hexafluorophosphate, benzoate, and the anions of C₁-C₄-alkanoic acids, preferably formate, acetate, propionate and butyrate. They can be formed by reacting compounds of formula (I) with an acid of the corresponding anion, preferably of hydrochloric acid, hydrobromic acid, sulfuric acid, phosphoric acid or nitric acid.

Veterinarily acceptable salts of the compounds of formula (I) encompass especially the salts of those cations or the acid addition salts which are known and accepted in the art for the formation of salts for veterinary use. Suitable acid addition salts, e.g. formed by compounds of formula (I) containing a basic nitrogen atom, e.g. an amino group, include salts with inorganic acids, for example hydrochlorids, sulphates, phosphates, and nitrates and salts of organic acids for example acetic acid, maleic acid, e.g. the monoacid salts or diacid salts of maleic acid, dimaleic acid, fumaric acid, e.g. the monoacid salts or diacid salts of fumaric acid, difumaric acid, methane sulfenic acid, methane sulfonic acid, and succinic acid.

In the definitions of the variables given above, collective terms are used which are generally representative for the substituents in question. The term C_n-C_m indicates the number of carbon atoms possible in each case in the substituent or substituent moiety in question.

The term "halogen" as used herein refers to fluoro, chloro, bromo and iodo.

The term "alkyl" as used herein refers to a straight-chained or branched saturated hydrocarbon group having 1 to 6 carbon atoms, for example methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl, 1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl,

4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl and 1-ethyl-2-methylpropyl.

- 5 The term "haloalkyl" as used herein refers to a straight-chained or branched alkyl group having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above), wherein some or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen atoms as mentioned above, for example chloromethyl, bromomethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chlorofluoromethyl, dichlorofluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 1-chloroethyl, 1-bromoethyl, 1-fluoroethyl, 2-fluoroethyl, 10 2,2-difluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-chloro-2-fluoroethyl, 2-chloro-2,2-difluoroethyl, 2,2-dichloro-2-fluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl and pentafluoroethyl, 2-fluoropropyl, 3-fluoropropyl, 2,2-difluoropropyl, 2,3-difluoropropyl, 2-chloropropyl, 3-chloropropyl, 2,3-dichloropropyl, 2-bromopropyl, 3-bromopropyl, 3,3,3-trifluoropropyl, 15 3,3,3-trichloropropyl, $\text{CH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{CF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$, 1-(fluoromethyl)-2-fluoroethyl, 1-(chloromethyl)-2-chloroethyl, 1-(bromomethyl)-2-bromoethyl, 4-fluorobutyl, 4-chlorobutyl, 4-bromobutyl, nonafluorobutyl, 5-fluoro-1-pentyl, 5-chloro-1-pentyl, 5-bromo-1-pentyl, 5-iodo-1-pentyl, 5,5,5-trichloro-1-pentyl, undecafluoropentyl, 6-fluoro-1-hexyl, 6-chloro-1-hexyl, 6-bromo-1-hexyl, 6-iodo-1-hexyl, 6,6,6-trichloro- 20 1-hexyl or dodecafluorohexyl.

- Accordingly "alkoxy" and "alkylthio" as used herein refer to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through an oxygen atom or a sulfur atom respectively, at any position in the alkyl group. Examples include methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, methylthio, ethylthio, 25 propylthio, isopropylthio, and n-butylthio.

Similarly, "alkylsulfinyl" and "alkylsulfonyl" refer to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through a -S(=O)- moiety or a $\text{-S(=O)}_2\text{-}$ moiety, respectively, at any position in the alkyl group. Examples include methylsulfinyl and methylsulfonyl.

- 30 Similarly, "haloalkoxy" and "haloalkylthio" (or haloalkylsulfenyl, respectively) refer to straight-chain or branched alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms (as mentioned above) bonded through an oxygen atom or a sulfur atom, respectively, at any bond in the alkyl group, where some or all of the hydrogen atoms in these groups may be replaced by halogen atoms as mentioned above, for example $\text{C}_1\text{-C}_2\text{-haloalkoxy}$, such as chloromethoxy, bromomethoxy, dichloromethoxy, trichloromethoxy, fluoromethoxy, 35 difluoromethoxy, trifluoromethoxy, chlorofluoromethoxy, dichlorofluoromethoxy, chlorodifluoromethoxy, 1-chloroethoxy, 1-bromoethoxy, 1-fluoroethoxy, 2-fluoroethoxy, 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 and

pentafluoroethoxy, further C₁-C₂-haloalkylthio, such as chloromethylthio, bromomethylthio, dichloromethylthio, trichloromethylthio, fluoromethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, chlorofluoromethylthio, dichlorofluoromethylthio, chlorodifluoromethylthio, 1-chloroethylthio, 1-bromoethylthio, 1-fluoroethylthio, 2-fluoroethylthio, 2,2-difluoroethylthio, 2,2,2-trifluoroethylthio, 2-chloro-2-fluoroethylthio, 2-chloro-2,2-difluoroethylthio, 2,2-dichloro-2-fluoroethylthio, 2,2,2-trichloroethylthio and pentafluoroethylthio and the like.

The term "C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy" as used herein refers to alkoxy having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above), wherein one hydrogen atom of the alkoxy radical is replaced by a C₁-C₄-alkoxy group.

The term "alkenyl" as used herein intends a branched or unbranched unsaturated hydrocarbon group having 2 to 6 carbon atoms and a double bond in any position, such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, 1-methyl-ethenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-1-propenyl, 2-methyl-1-propenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl; 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-1-butenyl, 2-methyl-1-butenyl, 3-methyl-1-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-1-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-1-pentenyl, 2-methyl-1-pentenyl, 3-methyl-1-pentenyl, 4-methyl-1-pentenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 1-methyl-3-pentenyl, 2-methyl-3-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-1-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-1-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-1-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 3,3-dimethyl-1-butenyl, 3,3-dimethyl-2-butenyl, 1-ethyl-1-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-1-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-methyl-1-propenyl and 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl;

The term "alkynyl" as used herein refers to a branched or unbranched unsaturated hydrocarbon group having 2 to 6 carbon atoms and containing at least one triple bond, such as ethynyl, propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, and the like.

Similarly, "alkenyloxy" and "alkynyloxy" refer to straight-chain or branched alkenyl or alkynyl groups, respectively (as mentioned above) bonded through an oxygen atom, at any carbon of the alkenyl group, or at any carbon atom of the alkynyl group, e.g. allyloxy or propargyloxy.

The term "cycloalkyl" as used herein refers to monocyclic 3- to 7-membered saturated carbon atom rings, such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, or cycloheptyl.

The term "C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl" as used herein refers to alkyl having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above), wherein one hydrogen atom of the alkyl radical is replaced by a C₃-C₇-cycloalkyl group.

Similarly, the term "C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₄-alkoxy" as used herein refers to alkoxy having 1 to 4 carbon atoms (as mentioned above), wherein one hydrogen atom of the alkoxy radical is replaced by a C₃-C₇-cycloalkyl group.

With respect to the intended use of the compounds of formula (I), particular preference is given to the following meanings of the substituents R¹ to R⁶ and the variables n and m, in each case on their own or in combination:

Preference is given to compounds of the formula (I), wherein R¹ is selected independently from the group consisting of halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl or C₁-C₆-haloalkylsulfonyl. Particular preference is given to compounds of the formula (I), in which R¹ is selected independently from the group consisting of halogen, in particular F, Cl, Br; C₁-C₂-alkyl, in particular CH₃, C₁-C₂-haloalkyl, especially C₁-C₂-fluoroalkyl, such as CHF₂, CF₃, C₁-C₂-alkoxy, in particular OCH₃, and C₁-C₂-haloalkoxy, especially C₁-C₂-fluoroalkoxy, such as OCHF₂ and OCF₃;

Preference is given to compounds of the formula (I), in which m is 1, 2 or 3;

Preference is given to compounds of the formula (I), in which R² is selected independently of one another from the group consisting of halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl or C₁-C₆-haloalkylsulfonyl. Particular preference is given to compounds of the formula (I), in which R² is selected independently from the group consisting of halogen, in particular F, Cl, Br; C₁-C₂-alkyl, in particular CH₃, C₁-C₃-haloalkyl, especially C₁-C₃-fluoroalkyl, such as CHF₂, CF₃ and CF(CF₃)₂; C₁-C₂-alkoxy, in particular OCH₃, and C₁-C₃-haloalkoxy, especially C₁-C₃-fluoroalkoxy, such as OCHF₂, OCF₃, OCF(CF₃)₂;

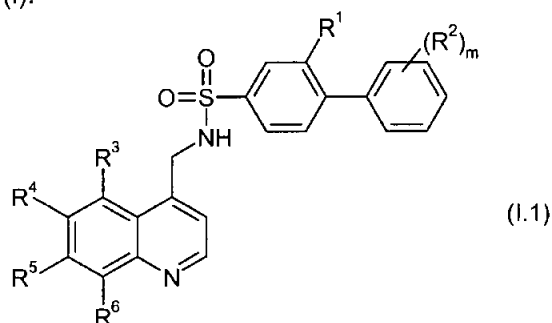
Preference is given to compounds of the formula (I), in which R³, R⁴, R⁵, R⁶ are each independently selected from the group consisting of hydrogen, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, or C₁-C₆-alkylthio.

A very preferred embodiment of the present invention relates to compounds of formula (I), wherein R³, R⁴, R⁵, R⁶ are each hydrogen.

Another preferred embodiment of the present invention relates to compounds of

the formula (I), wherein n is 1.

- A very preferred embodiment of the present invention relates to compounds of formula (I), wherein the substituent R¹ is attached to the phenyl group in meta position relative to the sulfonamid moiety. This compound is also referred to as compound of formula (I.1), wherein the biphenyl moiety has the substitution pattern as in the following scheme, and R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ and m are as defined hereinabove for compounds of formula (I):



- A skilled person will readily understand that the preferences given for R¹ to R⁶ and m in connection with compounds of formula (I) also apply for formulae (I.1) and (I.1a) as defined hereinafter.

In the compounds of formula (I.1) preference is given to those wherein R¹ is selected from the group fluoro, chloro, bromo, methyl, methoxy, trifluoromethyl, methylthio, trifluoromethylthio, and trifluoromethoxy.

- Preferred embodiments of such compounds include:

Compounds of formula (I.1) wherein R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 0;

Compounds of formula (I.1) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 1;

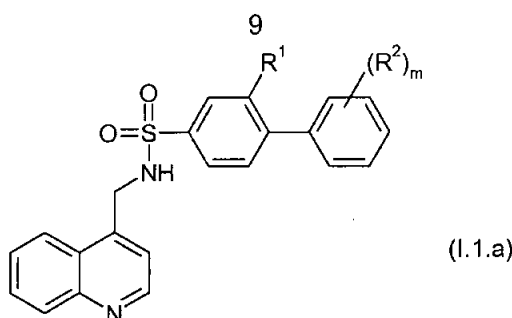
- Compounds of formula (I.1) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 2;

Compounds of formula (I.1) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 3.

- Particular preference is also given to compounds of formula (I.1) wherein R¹ is F, Cl or Br.

Further preference is given to compounds of formula (I.1) wherein R² is selected independently from the group consisting of halogen, cyano, nitro, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl and C₁-C₆-alkoxy.

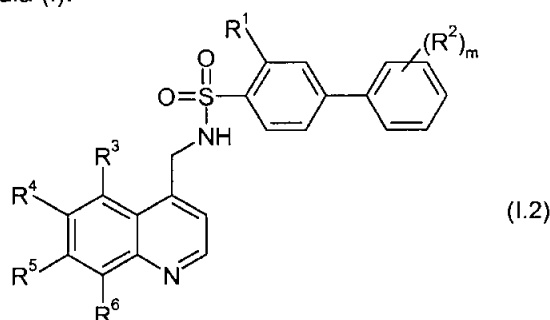
- Among the compounds of formula (I.1), particular preference is given to compounds of formula (I.1), wherein R¹ is attached to the phenyl group in meta position relative to the sulfonamid moiety, n is 1 and R³, R⁴, R⁵, R⁶ are each hydrogen, in the following referred to as quinoline compounds of formula (I.1.a)



wherein

R¹, R² and m have the meanings given above, especially those mentioned as being preferred.

- 5 Another very preferred embodiment of the present invention relates to compounds of formula (I), wherein the substituent R¹ is attached to the phenyl group in ortho position relative to the sulfonamid moiety. This compound is also referred to as compound of formula (I).2, wherein the biphenyl moiety has the substitution pattern as in the following scheme, and R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ and m are as defined hereinabove
- 10 for compounds of formula (I):



A skilled person will readily understand that the preferences given for R¹ to R⁶ and m in connection with compounds of formula (I) also apply for formulae (I.2) and (I.2.a) as defined hereinafter.

- 15 In the compounds of formula (I.2) preference is given to those wherein R¹ is selected from the group fluoro, chloro, bromo, methyl, methoxy, trifluoromethyl, methylthio, trifluoromethylthio, and trifluoromethoxy.

Preferred embodiments of such compounds include:

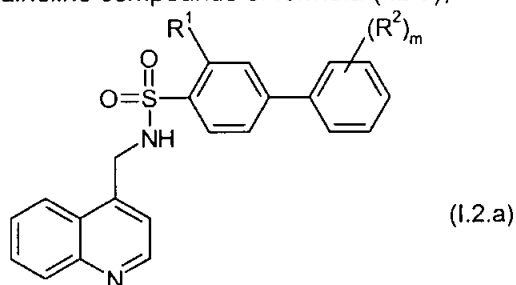
- Compounds of formula (I.2) wherein R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined
- 20 hereinabove and m is 0;
- Compounds of formula (I.2) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 1;
- Compounds of formula (I.2) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 2;
- 25 Compounds of formula (I.2) wherein R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ are as defined hereinabove and m is 3.

Particular preference is also given to compounds of formula (I.2) wherein R¹ is F,

Cl or Br.

Further preference is given to compounds of formula (I.2) wherein R^2 is selected independently from the group consisting of halogen, cyano, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -haloalkyl and C_1 - C_6 -alkoxy.

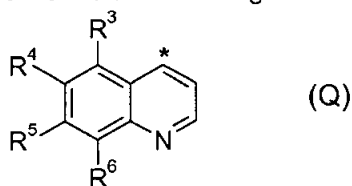
- 5 Among the compounds of formula (I.2), particular preference is given to compounds of formula (I), wherein R^1 is attached to the phenyl group in ortho position relative to the sulfonamid moiety, n is 1 and R^3 , R^4 , R^5 , R^6 are each hydrogen, in the following referred to as quinoline compounds of formula (I.2.a),



- 10 wherein

R^1 , R^2 and m have the meanings given above, especially those mentioned as being preferred.

Examples of suitable quinoline moieties Q are given in the following table A



- 15

In formula (Q) * denotes the bonding site to the backbone.

Table A

Quinoline moiety no.	R^3	R^4	R^5	R^6
Q-1	H	H	H	H
Q-2	F	H	H	H
Q-3	H	F	H	H
Q-4	H	H	F	H
Q-5	H	H	H	F
Q-6	Cl	H	H	H
Q-7	H	Cl	H	H
Q-8	H	H	Cl	H
Q-9	H	H	H	Cl
Q-10	CH ₃	H	H	H

S7

Quinoline moiety no.	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
Q-11	H	CH ₃	H	H
Q-12	H	H	CH ₃	H
Q-13	H	H	H	CH ₃
Q-14	OCH ₃	H	H	H
Q-15	H	OCH ₃	H	H
Q-16	H	H	OCH ₃	H
Q-17	H	H	H	OCH ₃
Q-18	CF ₃	H	H	H
Q-19	H	CF ₃	H	H
Q-20	H	H	CF ₃	H
Q-21	H	H	H	CF ₃
Q-22	OCF ₃	H	H	H
Q-23	H	OCF ₃	H	H
Q-24	H	H	OCF ₃	H
Q-25	H	H	H	OCF ₃
Q-26	Cl	Cl	H	H
Q-27	Cl	H	Cl	H
Q-28	Cl	H	H	Cl
Q-29	H	Cl	Cl	H
Q-30	H	Cl	H	Cl
Q-31	H	H	Cl	Cl
Q-32	F	F	H	H
Q-33	F	H	F	H
Q-34	F	H	H	F
Q-35	H	F	F	H
Q-36	H	F	H	F
Q-37	H	H	F	F
Q-38	CH ₃	CH ₃	H	H
Q-39	CH ₃	H	CH ₃	H
Q-40	CH ₃	H	H	CH ₃
Q-41	H	CH ₃	CH ₃	H
Q-42	H	CH ₃	H	CH ₃
Q-43	H	H	CH ₃	CH ₃
Q-44	OCH ₃	OCH ₃	H	H
Q-45	OCH ₃	H	OCH ₃	H
Q-46	OCH ₃	H	H	OCH ₃

Quinoline moiety no.	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
Q-47	H	OCH ₃	OCH ₃	H
Q-48	H	OCH ₃	H	OCH ₃
Q-49	H	H	OCH ₃	OCH ₃
Q-50	CF ₃	CF ₃	H	H
Q-51	CF ₃	H	CF ₃	H
Q-52	CF ₃	H	H	CF ₃
Q-53	H	CF ₃	CF ₃	H
Q-54	H	CF ₃	H	CF ₃
Q-55	H	H	CF ₃	CF ₃

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

Table 1

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-1 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

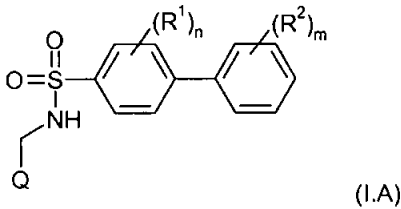


Table B

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1	2-F	—
A-2	2-Cl	—
A-3	2-CH ₃	—
A-4	2-CF ₃	—
A-5	2-OCH ₃	—
A-6	2-OCF ₃	—
A-7	3-F	—
A-8	3-Cl	—

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-9	3-CH ₃	—
A-10	3-CF ₃	—
A-11	3-OCH ₃	—
A-12	3-OCF ₃	—
A-13	2-F	2-CH ₃
A-14	2-Cl	2-CH ₃
A-15	2-CH ₃	2-CH ₃
A-16	2-CF ₃	2-CH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-17	2-OCH ₃	2-CH ₃
A-18	2-OCF ₃	2-CH ₃
A-19	3-F	2-CH ₃
A-20	3-Cl	2-CH ₃
A-21	3-CH ₃	2-CH ₃
A-22	3-CF ₃	2-CH ₃
A-23	3-OCH ₃	2-CH ₃
A-24	3-OCF ₃	2-CH ₃
A-25	2-F	2-CH ₂ CH ₃
A-26	2-Cl	2-CH ₂ CH ₃
A-27	2-CH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-28	2-CF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-29	2-OCH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-30	2-OCF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-31	3-F	2-CH ₂ CH ₃
A-32	3-Cl	2-CH ₂ CH ₃
A-33	3-CH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-34	3-CF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-35	3-OCH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-36	3-OCF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-37	2-F	2-Br
A-38	2-Cl	2-Br
A-39	2-CH ₃	2-Br
A-40	2-CF ₃	2-Br
A-41	2-OCH ₃	2-Br
A-42	2-OCF ₃	2-Br
A-43	3-F	2-Br
A-44	3-Cl	2-Br
A-45	3-CH ₃	2-Br
A-46	3-CF ₃	2-Br

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-47	3-OCH ₃	2-Br
A-48	3-OCF ₃	2-Br
A-49	2-F	2-Cl
A-50	2-Cl	2-Cl
A-51	2-CH ₃	2-Cl
A-52	2-CF ₃	2-Cl
A-53	2-OCH ₃	2-Cl
A-54	2-OCF ₃	2-Cl
A-55	3-F	2-Cl
A-56	3-Cl	2-Cl
A-57	3-CH ₃	2-Cl
A-58	3-CF ₃	2-Cl
A-59	3-OCH ₃	2-Cl
A-60	3-OCF ₃	2-Cl
A-61	2-F	2-F
A-62	2-Cl	2-F
A-63	2-CH ₃	2-F
A-64	2-CF ₃	2-F
A-65	2-OCH ₃	2-F
A-66	2-OCF ₃	2-F
A-67	3-F	2-F
A-68	3-Cl	2-F
A-69	3-CH ₃	2-F
A-70	3-CF ₃	2-F
A-71	3-OCH ₃	2-F
A-72	3-OCF ₃	2-F
A-73	2-F	2-CN
A-74	2-Cl	2-CN
A-75	2-CH ₃	2-CN
A-76	2-CF ₃	2-CN

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-77	2-OCH ₃	2-CN
A-78	2-OCF ₃	2-CN
A-79	3-F	2-CN
A-80	3-Cl	2-CN
A-81	3-CH ₃	2-CN
A-82	3-CF ₃	2-CN
A-83	3-OCH ₃	2-CN
A-84	3-OCF ₃	2-CN
A-85	2-F	2-NO ₂
A-86	2-Cl	2-NO ₂
A-87	2-CH ₃	2-NO ₂
A-88	2-CF ₃	2-NO ₂
A-89	2-OCH ₃	2-NO ₂
A-90	2-OCF ₃	2-NO ₂
A-91	3-F	2-NO ₂
A-92	3-Cl	2-NO ₂
A-93	3-CH ₃	2-NO ₂
A-94	3-CF ₃	2-NO ₂
A-95	3-OCH ₃	2-NO ₂
A-96	3-OCF ₃	2-NO ₂
A-97	2-F	2-OCH ₃
A-98	2-Cl	2-OCH ₃
A-99	2-CH ₃	2-OCH ₃
A-100	2-CF ₃	2-OCH ₃
A-101	2-OCH ₃	2-OCH ₃
A-102	2-OCF ₃	2-OCH ₃
A-103	3-F	2-OCH ₃
A-104	3-Cl	2-OCH ₃
A-105	3-CH ₃	2-OCH ₃
A-106	3-CF ₃	2-OCH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-107	3-OCH ₃	2-OCH ₃
A-108	3-OCF ₃	2-OCH ₃
A-109	2-F	2-CF ₃
A-110	2-Cl	2-CF ₃
A-111	2-CH ₃	2-CF ₃
A-112	2-CF ₃	2-CF ₃
A-113	2-OCH ₃	2-CF ₃
A-114	2-OCF ₃	2-CF ₃
A-115	3-F	2-CF ₃
A-116	3-Cl	2-CF ₃
A-117	3-CH ₃	2-CF ₃
A-118	3-CF ₃	2-CF ₃
A-119	3-OCH ₃	2-CF ₃
A-120	3-OCF ₃	2-CF ₃
A-121	2-F	2-OCF ₃
A-122	2-Cl	2-OCF ₃
A-123	2-CH ₃	2-OCF ₃
A-124	2-CF ₃	2-OCF ₃
A-125	2-OCH ₃	2-OCF ₃
A-126	2-OCF ₃	2-OCF ₃
A-127	3-F	2-OCF ₃
A-128	3-Cl	2-OCF ₃
A-129	3-CH ₃	2-OCF ₃
A-130	3-CF ₃	2-OCF ₃
A-131	3-OCH ₃	2-OCF ₃
A-132	3-OCF ₃	2-OCF ₃
A-133	2-F	2-CF(CF ₃) ₂
A-134	2-Cl	2-CF(CF ₃) ₂
A-135	2-CH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-136	2-CF ₃	2-CF(CF ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-137	2-OCH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-138	2-OCF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-139	3-F	2-CF(CF ₃) ₂
A-140	3-Cl	2-CF(CF ₃) ₂
A-141	3-CH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-142	3-CF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-143	3-OCH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-144	3-OCF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-145	2-F	2-SCH ₃
A-146	2-Cl	2-SCH ₃
A-147	2-CH ₃	2-SCH ₃
A-148	2-CF ₃	2-SCH ₃
A-149	2-OCH ₃	2-SCH ₃
A-150	2-OCF ₃	2-SCH ₃
A-151	3-F	2-SCH ₃
A-152	3-Cl	2-SCH ₃
A-153	3-CH ₃	2-SCH ₃
A-154	3-CF ₃	2-SCH ₃
A-155	3-OCH ₃	2-SCH ₃
A-156	3-OCF ₃	2-SCH ₃
A-157	2-F	3-CH ₃
A-158	2-Cl	3-CH ₃
A-159	2-CH ₃	3-CH ₃
A-160	2-CF ₃	3-CH ₃
A-161	2-OCH ₃	3-CH ₃
A-162	2-OCF ₃	3-CH ₃
A-163	3-F	3-CH ₃
A-164	3-Cl	3-CH ₃
A-165	3-CH ₃	3-CH ₃
A-166	3-CF ₃	3-CH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-167	3-OCH ₃	3-CH ₃
A-168	3-OCF ₃	3-CH ₃
A-169	2-F	3-CH ₂ CH ₃
A-170	2-Cl	3-CH ₂ CH ₃
A-171	2-CH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-172	2-CF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-173	2-OCH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-174	2-OCF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-175	3-F	3-CH ₂ CH ₃
A-176	3-Cl	3-CH ₂ CH ₃
A-177	3-CH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-178	3-CF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-179	3-OCH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-180	3-OCF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-181	2-F	3-Br
A-182	2-Cl	3-Br
A-183	2-CH ₃	3-Br
A-184	2-CF ₃	3-Br
A-185	2-OCH ₃	3-Br
A-186	2-OCF ₃	3-Br
A-187	3-F	3-Br
A-188	3-Cl	3-Br
A-189	3-CH ₃	3-Br
A-190	3-CF ₃	3-Br
A-191	3-OCH ₃	3-Br
A-192	3-OCF ₃	3-Br
A-193	2-F	3-Cl
A-194	2-Cl	3-Cl
A-195	2-CH ₃	3-Cl
A-196	2-CF ₃	3-Cl

62

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-197	2-OCH ₃	3-Cl
A-198	2-OCF ₃	3-Cl
A-199	3-F	3-Cl
A-200	3-Cl	3-Cl
A-201	3-CH ₃	3-Cl
A-202	3-CF ₃	3-Cl
A-203	3-OCH ₃	3-Cl
A-204	3-OCF ₃	3-Cl
A-205	2-F	3-F
A-206	2-Cl	3-F
A-207	2-CH ₃	3-F
A-208	2-CF ₃	3-F
A-209	2-OCH ₃	3-F
A-210	2-OCF ₃	3-F
A-211	3-F	3-F
A-212	3-Cl	3-F
A-213	3-CH ₃	3-F
A-214	3-CF ₃	3-F
A-215	3-OCH ₃	3-F
A-216	3-OCF ₃	3-F
A-217	2-F	3-CN
A-218	2-Cl	3-CN
A-219	2-CH ₃	3-CN
A-220	2-CF ₃	3-CN
A-221	2-OCH ₃	3-CN
A-222	2-OCF ₃	3-CN
A-223	3-F	3-CN
A-224	3-Cl	3-CN
A-225	3-CH ₃	3-CN
A-226	3-CF ₃	3-CN

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-227	3-OCH ₃	3-CN
A-228	3-OCF ₃	3-CN
A-229	2-F	3-NO ₂
A-230	2-Cl	3-NO ₂
A-231	2-CH ₃	3-NO ₂
A-232	2-CF ₃	3-NO ₂
A-233	2-OCH ₃	3-NO ₂
A-234	2-OCF ₃	3-NO ₂
A-235	3-F	3-NO ₂
A-236	3-Cl	3-NO ₂
A-237	3-CH ₃	3-NO ₂
A-238	3-CF ₃	3-NO ₂
A-239	3-OCH ₃	3-NO ₂
A-240	3-OCF ₃	3-NO ₂
A-241	2-F	3-OCH ₃
A-242	2-Cl	3-OCH ₃
A-243	2-CH ₃	3-OCH ₃
A-244	2-CF ₃	3-OCH ₃
A-245	2-OCH ₃	3-OCH ₃
A-246	2-OCF ₃	3-OCH ₃
A-247	3-F	3-OCH ₃
A-248	3-Cl	3-OCH ₃
A-249	3-CH ₃	3-OCH ₃
A-250	3-CF ₃	3-OCH ₃
A-251	3-OCH ₃	3-OCH ₃
A-252	3-OCF ₃	3-OCH ₃
A-253	2-F	3-CF ₃
A-254	2-Cl	3-CF ₃
A-255	2-CH ₃	3-CF ₃
A-256	2-CF ₃	3-CF ₃

63

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-257	2-OCH ₃	3-CF ₃
A-258	2-OCF ₃	3-CF ₃
A-259	3-F	3-CF ₃
A-260	3-Cl	3-CF ₃
A-261	3-CH ₃	3-CF ₃
A-262	3-CF ₃	3-CF ₃
A-263	3-OCH ₃	3-CF ₃
A-264	3-OCF ₃	3-CF ₃
A-265	2-Cl	3-OCF ₃
A-266	2-CH ₃	3-OCF ₃
A-267	2-CF ₃	3-OCF ₃
A-268	2-OCH ₃	3-OCF ₃
A-269	2-OCF ₃	3-OCF ₃
A-270	3-F	3-OCF ₃
A-271	3-Cl	3-OCF ₃
A-272	3-CH ₃	3-OCF ₃
A-273	3-CF ₃	3-OCF ₃
A-274	3-OCH ₃	3-OCF ₃
A-275	3-OCF ₃	3-OCF ₃
A-276	2-F	3-CF(CF ₃) ₂
A-277	2-Cl	3-CF(CF ₃) ₂
A-278	2-CH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-279	2-CF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-280	2-OCH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-281	2-OCF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-282	3-F	3-CF(CF ₃) ₂
A-283	3-Cl	3-CF(CF ₃) ₂
A-284	3-CH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-285	3-CF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-286	3-OCH ₃	3-CF(CF ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-287	3-OCF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-288	2-Cl	3-SCH ₃
A-289	2-CH ₃	3-SCH ₃
A-290	2-CF ₃	3-SCH ₃
A-291	2-OCH ₃	3-SCH ₃
A-292	2-OCF ₃	3-SCH ₃
A-293	3-F	3-SCH ₃
A-294	3-Cl	3-SCH ₃
A-295	3-CH ₃	3-SCH ₃
A-296	3-CF ₃	3-SCH ₃
A-297	3-OCH ₃	3-SCH ₃
A-298	3-OCF ₃	3-SCH ₃
A-299	2-F	3-C(=O)CH ₃
A-300	2-Cl	3-C(=O)CH ₃
A-301	2-CH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-302	2-CF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-303	2-OCH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-304	2-OCF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-305	3-F	3-C(=O)CH ₃
A-306	3-Cl	3-C(=O)CH ₃
A-307	3-CH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-308	3-CF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-309	3-OCH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-310	3-OCF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-311	2-F	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-312	2-Cl	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-313	2-CH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-314	2-CF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-315	2-OCH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-316	2-OCF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃

64

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-317	3-F	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-318	3-Cl	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-319	3-CH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-320	3-CF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-321	3-OCH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-322	3-OCF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-323	2-F	4-CH ₃
A-324	2-Cl	4-CH ₃
A-325	2-CH ₃	4-CH ₃
A-326	2-CF ₃	4-CH ₃
A-327	2-OCH ₃	4-CH ₃
A-328	2-OCF ₃	4-CH ₃
A-329	3-F	4-CH ₃
A-330	3-Cl	4-CH ₃
A-331	3-CH ₃	4-CH ₃
A-332	3-CF ₃	4-CH ₃
A-333	3-OCH ₃	4-CH ₃
A-334	3-OCF ₃	4-CH ₃
A-335	2-F	4-CH ₂ CH ₃
A-336	2-Cl	4-CH ₂ CH ₃
A-337	2-CH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-338	2-CF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-339	2-OCH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-340	2-OCF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-341	3-F	4-CH ₂ CH ₃
A-342	3-Cl	4-CH ₂ CH ₃
A-343	3-CH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-344	3-CF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-345	3-OCH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-346	3-OCF ₃	4-CH ₂ CH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-347	2-F	4-Br
A-348	2-Cl	4-Br
A-349	2-CH ₃	4-Br
A-350	2-CF ₃	4-Br
A-351	2-OCH ₃	4-Br
A-352	2-OCF ₃	4-Br
A-353	3-F	4-Br
A-354	3-Cl	4-Br
A-355	3-CH ₃	4-Br
A-356	3-CF ₃	4-Br
A-357	3-OCH ₃	4-Br
A-358	3-OCF ₃	4-Br
A-359	2-F	4-Cl
A-360	2-Cl	4-Cl
A-361	2-CH ₃	4-Cl
A-362	2-CF ₃	4-Cl
A-363	2-OCH ₃	4-Cl
A-364	2-OCF ₃	4-Cl
A-365	3-F	4-Cl
A-366	3-Cl	4-Cl
A-367	3-CH ₃	4-Cl
A-368	3-CF ₃	4-Cl
A-369	3-OCH ₃	4-Cl
A-370	3-OCF ₃	4-Cl
A-371	2-F	4-F
A-372	2-Cl	4-F
A-373	2-CH ₃	4-F
A-374	2-CF ₃	4-F
A-375	2-OCH ₃	4-F
A-376	2-OCF ₃	4-F

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-377	3-F	4-F
A-378	3-Cl	4-F
A-379	3-CH ₃	4-F
A-380	3-CF ₃	4-F
A-381	3-OCH ₃	4-F
A-382	3-OCF ₃	4-F
A-383	2-F	4-CN
A-384	2-Cl	4-CN
A-385	2-CH ₃	4-CN
A-386	2-CF ₃	4-CN
A-387	2-OCH ₃	4-CN
A-388	2-OCF ₃	4-CN
A-389	3-F	4-CN
A-390	3-Cl	4-CN
A-391	3-CH ₃	4-CN
A-392	3-CF ₃	4-CN
A-393	3-OCH ₃	4-CN
A-394	3-OCF ₃	4-CN
A-395	2-F	4-NO ₂
A-396	2-Cl	4-NO ₂
A-397	2-CH ₃	4-NO ₂
A-398	2-CF ₃	4-NO ₂
A-399	2-OCH ₃	4-NO ₂
A-400	2-OCF ₃	4-NO ₂
A-401	3-F	4-NO ₂
A-402	3-Cl	4-NO ₂
A-403	3-CH ₃	4-NO ₂
A-404	3-CF ₃	4-NO ₂
A-405	3-OCH ₃	4-NO ₂
A-406	3-OCF ₃	4-NO ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-407	2-F	4-OCH ₃
A-408	2-Cl	4-OCH ₃
A-409	2-CH ₃	4-OCH ₃
A-410	2-CF ₃	4-OCH ₃
A-411	2-OCH ₃	4-OCH ₃
A-412	2-OCF ₃	4-OCH ₃
A-413	3-F	4-OCH ₃
A-414	3-Cl	4-OCH ₃
A-415	3-CH ₃	4-OCH ₃
A-416	3-CF ₃	4-OCH ₃
A-417	3-OCH ₃	4-OCH ₃
A-418	3-OCF ₃	4-OCH ₃
A-419	2-F	4-OCH ₂ CH ₃
A-420	2-Cl	4-OCH ₂ CH ₃
A-421	2-CH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-422	2-CF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-423	2-OCH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-424	2-OCF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-425	3-F	4-OCH ₂ CH ₃
A-426	3-Cl	4-OCH ₂ CH ₃
A-427	3-CH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-428	3-CF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-429	3-OCH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-430	3-OCF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-431	2-F	4-OCH(CH ₃) ₂
A-432	2-Cl	4-OCH(CH ₃) ₂
A-433	2-CH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-434	2-CF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-435	2-OCH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-436	2-OCF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-437	3-F	4-OCH(CH ₃) ₂
A-438	3-Cl	4-OCH(CH ₃) ₂
A-439	3-CH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-440	3-CF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-441	3-OCH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-442	3-OCF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-443	2-F	4-OC(CH ₃) ₃
A-444	2-Cl	4-OC(CH ₃) ₃
A-445	2-CH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-446	2-CF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-447	2-OCH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-448	2-OCF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-449	3-F	4-OC(CH ₃) ₃
A-450	3-Cl	4-OC(CH ₃) ₃
A-451	3-CH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-452	3-CF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-453	3-OCH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-454	3-OCF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-455	2-F	4-CF ₃
A-456	2-Cl	4-CF ₃
A-457	2-CH ₃	4-CF ₃
A-458	2-CF ₃	4-CF ₃
A-459	2-OCH ₃	4-CF ₃
A-460	2-OCF ₃	4-CF ₃
A-461	3-F	4-CF ₃
A-462	3-Cl	4-CF ₃
A-463	3-CH ₃	4-CF ₃
A-464	3-CF ₃	4-CF ₃
A-465	3-OCH ₃	4-CF ₃
A-466	3-OCF ₃	4-CF ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-467	2-F	4-OCF ₃
A-468	2-Cl	4-OCF ₃
A-469	2-CH ₃	4-OCF ₃
A-470	2-CF ₃	4-OCF ₃
A-471	2-OCH ₃	4-OCF ₃
A-472	2-OCF ₃	4-OCF ₃
A-473	3-F	4-OCF ₃
A-474	3-Cl	4-OCF ₃
A-475	3-CH ₃	4-OCF ₃
A-476	3-CF ₃	4-OCF ₃
A-477	3-OCH ₃	4-OCF ₃
A-478	3-OCF ₃	4-OCF ₃
A-479	2-F	4-SCH ₃
A-480	2-Cl	4-SCH ₃
A-481	2-CH ₃	4-SCH ₃
A-482	2-CF ₃	4-SCH ₃
A-483	2-OCH ₃	4-SCH ₃
A-484	2-OCF ₃	4-SCH ₃
A-485	3-F	4-SCH ₃
A-486	3-Cl	4-SCH ₃
A-487	3-CH ₃	4-SCH ₃
A-488	3-CF ₃	4-SCH ₃
A-489	3-OCH ₃	4-SCH ₃
A-490	3-OCF ₃	4-SCH ₃
A-491	2-F	4-C(=O)CH ₃
A-492	2-Cl	4-C(=O)CH ₃
A-493	2-CH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-494	2-CF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-495	2-OCH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-496	2-OCF ₃	4-C(=O)CH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-497	3-F	4-C(=O)CH ₃
A-498	3-Cl	4-C(=O)CH ₃
A-499	3-CH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-500	3-CF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-501	3-OCH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-502	3-OCF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-503	2-F	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-504	2-Cl	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-505	2-CH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-506	2-CF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-507	2-OCH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-508	2-OCF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-509	3-F	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-510	3-Cl	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-511	3-CH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-512	3-CF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-513	3-OCH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-514	3-OCF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-515	2-F	4-CF(CF ₃) ₂
A-516	2-Cl	4-CF(CF ₃) ₂
A-517	2-CH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-518	2-CF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-519	2-OCH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-520	2-OCF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-521	3-F	4-CF(CF ₃) ₂
A-522	3-Cl	4-CF(CF ₃) ₂
A-523	3-CH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-524	3-CF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-525	3-OCH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-526	3-OCF ₃	4-CF(CF ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-527	2-F	2,4-(CH ₃) ₂
A-528	2-Cl	2,4-(CH ₃) ₂
A-529	2-CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-530	2-CF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-531	2-OCH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-532	2-OCF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-533	3-F	2,4-(CH ₃) ₂
A-534	3-Cl	2,4-(CH ₃) ₂
A-535	3-CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-536	3-CF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-537	3-OCH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-538	3-OCF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-539	2-F	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-540	2-Cl	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-541	2-CH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-542	2-CF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-543	2-OCH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-544	2-OCF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-545	3-F	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-546	3-Cl	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-547	3-CH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-548	3-CF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-549	3-OCH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-550	3-OCF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-551	2-F	2,4-Br ₂
A-552	2-Cl	2,4-Br ₂
A-553	2-CH ₃	2,4-Br ₂
A-554	2-CF ₃	2,4-Br ₂
A-555	2-OCH ₃	2,4-Br ₂
A-556	2-OCF ₃	2,4-Br ₂

68

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-557	3-F	2,4-Br ₂
A-558	3-Cl	2,4-Br ₂
A-559	3-CH ₃	2,4-Br ₂
A-560	3-CF ₃	2,4-Br ₂
A-561	3-OCH ₃	2,4-Br ₂
A-562	3-OCF ₃	2,4-Br ₂
A-563	2-F	2,4-Cl ₂
A-564	2-Cl	2,4-Cl ₂
A-565	2-CH ₃	2,4-Cl ₂
A-566	2-CF ₃	2,4-Cl ₂
A-567	2-OCH ₃	2,4-Cl ₂
A-568	2-OCF ₃	2,4-Cl ₂
A-569	3-F	2,4-Cl ₂
A-570	3-Cl	2,4-Cl ₂
A-571	3-CH ₃	2,4-Cl ₂
A-572	3-CF ₃	2,4-Cl ₂
A-573	3-OCH ₃	2,4-Cl ₂
A-574	3-OCF ₃	2,4-Cl ₂
A-575	2-F	2,4-F ₂
A-576	2-Cl	2,4-F ₂
A-577	2-CH ₃	2,4-F ₂
A-578	2-CF ₃	2,4-F ₂
A-579	2-OCH ₃	2,4-F ₂
A-580	2-OCF ₃	2,4-F ₂
A-581	3-F	2,4-F ₂
A-582	3-Cl	2,4-F ₂
A-583	3-CH ₃	2,4-F ₂
A-584	3-CF ₃	2,4-F ₂
A-585	3-OCH ₃	2,4-F ₂
A-586	3-OCF ₃	2,4-F ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-587	2-F	2,4-(OCH ₃) ₂
A-588	2-Cl	2,4-(OCH ₃) ₂
A-589	2-CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-590	2-CF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-591	2-OCH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-592	2-OCF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-593	3-F	2,4-(OCH ₃) ₂
A-594	3-Cl	2,4-(OCH ₃) ₂
A-595	3-CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-596	3-CF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-597	3-OCH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-598	3-OCF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-599	2-F	2,4-(CF ₃) ₂
A-600	2-Cl	2,4-(CF ₃) ₂
A-601	2-CH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-602	2-CF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-603	2-OCH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-604	2-OCF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-605	3-F	2,4-(CF ₃) ₂
A-606	3-Cl	2,4-(CF ₃) ₂
A-607	3-CH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-608	3-CF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-609	3-OCH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-610	3-OCF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-611	2-F	2,4-(OCF ₃) ₂
A-612	2-Cl	2,4-(OCF ₃) ₂
A-613	2-CH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-614	2-CF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-615	2-OCH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-616	2-OCF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-617	3-F	2,4-(OCF ₃) ₂
A-618	3-Cl	2,4-(OCF ₃) ₂
A-619	3-CH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-620	3-CF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-621	3-OCH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-622	3-OCF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-623	2-F	2,5-(CH ₃) ₂
A-624	2-Cl	2,5-(CH ₃) ₂
A-625	2-CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-626	2-CF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-627	2-OCH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-628	2-OCF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-629	3-F	2,5-(CH ₃) ₂
A-630	3-Cl	2,5-(CH ₃) ₂
A-631	3-CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-632	3-CF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-633	3-OCH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-634	3-OCF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-635	2-F	2,5-Cl ₂
A-636	2-Cl	2,5-Cl ₂
A-637	2-CH ₃	2,5-Cl ₂
A-638	2-CF ₃	2,5-Cl ₂
A-639	2-OCH ₃	2,5-Cl ₂
A-640	2-OCF ₃	2,5-Cl ₂
A-641	3-F	2,5-Cl ₂
A-642	3-Cl	2,5-Cl ₂
A-643	3-CH ₃	2,5-Cl ₂
A-644	3-CF ₃	2,5-Cl ₂
A-645	3-OCH ₃	2,5-Cl ₂
A-646	3-OCF ₃	2,5-Cl ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-647	2-F	2,5-F ₂
A-648	2-Cl	2,5-F ₂
A-649	2-CH ₃	2,5-F ₂
A-650	2-CF ₃	2,5-F ₂
A-651	2-OCH ₃	2,5-F ₂
A-652	2-OCF ₃	2,5-F ₂
A-653	3-F	2,5-F ₂
A-654	3-Cl	2,5-F ₂
A-655	3-CH ₃	2,5-F ₂
A-656	3-CF ₃	2,5-F ₂
A-657	3-OCH ₃	2,5-F ₂
A-658	3-OCF ₃	2,5-F ₂
A-659	2-F	2,5-(OCH ₃) ₂
A-660	2-Cl	2,5-(OCH ₃) ₂
A-661	2-CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-662	2-CF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-663	2-OCH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-664	2-OCF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-665	3-F	2,5-(OCH ₃) ₂
A-666	3-Cl	2,5-(OCH ₃) ₂
A-667	3-CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-668	3-CF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-669	3-OCH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-670	3-OCF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-671	2-F	2,5-(CF ₃) ₂
A-672	2-Cl	2,5-(CF ₃) ₂
A-673	2-CH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-674	2-CF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-675	2-OCH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-676	2-OCF ₃	2,5-(CF ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-677	3-F	2,5-(CF ₃) ₂
A-678	3-Cl	2,5-(CF ₃) ₂
A-679	3-CH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-680	3-CF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-681	3-OCH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-682	3-OCF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-683	2-F	2,5-(OCF ₃) ₂
A-684	2-Cl	2,5-(OCF ₃) ₂
A-685	2-CH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-686	2-CF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-687	2-OCH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-688	2-OCF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-689	3-F	2,5-(OCF ₃) ₂
A-690	3-Cl	2,5-(OCF ₃) ₂
A-691	3-CH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-692	3-CF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-693	3-OCH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-694	3-OCF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-695	2-F	2,5-(SCH ₃) ₂
A-696	2-Cl	2,5-(SCH ₃) ₂
A-697	2-CH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-698	2-CF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-699	2-OCH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-700	2-OCF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-701	3-F	2,5-(SCH ₃) ₂
A-702	3-Cl	2,5-(SCH ₃) ₂
A-703	3-CH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-704	3-CF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-705	3-OCH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-706	3-OCF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-707	2-F	2,6-(CH ₃) ₂
A-708	2-Cl	2,6-(CH ₃) ₂
A-709	2-CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-710	2-CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-711	2-OCH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-712	2-OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-713	3-F	2,6-(CH ₃) ₂
A-714	3-Cl	2,6-(CH ₃) ₂
A-715	3-CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-716	3-CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-717	3-OCH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-718	3-OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-719	2-F	3,5-(CH ₃) ₂
A-720	2-Cl	3,5-(CH ₃) ₂
A-721	2-CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-722	2-CF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-723	2-OCH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-724	2-OCF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-725	3-F	3,5-(CH ₃) ₂
A-726	3-Cl	3,5-(CH ₃) ₂
A-727	3-CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-728	3-CF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-729	3-OCH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-730	3-OCF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-731	2-F	3,5-(CF ₃) ₂
A-732	2-Cl	3,5-(CF ₃) ₂
A-733	2-CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-734	2-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-735	2-OCH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-736	2-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂

72

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-737	3-F	3,5-(CF ₃) ₂
A-738	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂
A-739	3-CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-740	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-741	3-OCH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-742	3-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-743	2-F	3,5-(OCF ₃) ₂
A-744	2-Cl	3,5-(OCF ₃) ₂
A-745	2-CH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-746	2-CF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-747	2-OCH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-748	2-OCF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-749	3-F	3,5-(OCF ₃) ₂
A-750	3-Cl	3,5-(OCF ₃) ₂
A-751	3-CH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-752	3-CF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-753	3-OCH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-754	3-OCF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-755	2-F	3-Cl, 4-F
A-756	2-Cl	3-Cl, 4-F
A-757	2-CH ₃	3-Cl, 4-F
A-758	2-CF ₃	3-Cl, 4-F
A-759	2-OCH ₃	3-Cl, 4-F
A-760	2-OCF ₃	3-Cl, 4-F
A-761	3-F	3-Cl, 4-F
A-762	3-Cl	3-Cl, 4-F
A-763	3-CH ₃	3-Cl, 4-F
A-764	3-CF ₃	3-Cl, 4-F
A-765	3-OCH ₃	3-Cl, 4-F
A-766	3-OCF ₃	3-Cl, 4-F

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-767	2-F	3-CH ₃ , 4-F
A-768	2-Cl	3-CH ₃ , 4-F
A-769	2-CH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-770	2-CF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-771	2-OCH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-772	2-OCF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-773	3-F	3-CH ₃ , 4-F
A-774	3-Cl	3-CH ₃ , 4-F
A-775	3-CH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-776	3-CF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-777	3-OCH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-778	3-OCF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-779	2-F	2-Cl, 4-F
A-780	2-Cl	2-Cl, 4-F
A-781	2-CH ₃	2-Cl, 4-F
A-782	2-CF ₃	2-Cl, 4-F
A-783	2-OCH ₃	2-Cl, 4-F
A-784	2-OCF ₃	2-Cl, 4-F
A-785	3-F	2-Cl, 4-F
A-786	3-Cl	2-Cl, 4-F
A-787	3-CH ₃	2-Cl, 4-F
A-788	3-CF ₃	2-Cl, 4-F
A-789	3-OCH ₃	2-Cl, 4-F
A-790	3-OCF ₃	2-Cl, 4-F
A-791	2-F	2-Cl, 4-OCH ₃
A-792	2-Cl	2-Cl, 4-OCH ₃
A-793	2-CH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-794	2-CF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-795	2-OCH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-796	2-OCF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃

72

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-797	3-F	2-Cl, 4-OCH ₃
A-798	3-Cl	2-Cl, 4-OCH ₃
A-799	3-CH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-800	3-CF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-801	3-OCH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-802	3-OCF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-803	2-F	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-804	2-Cl	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-805	2-CH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-806	2-CF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-807	2-OCH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-808	2-OCF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-809	3-F	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-810	3-Cl	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-811	3-CH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-812	3-CF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-813	3-OCH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-814	3-OCF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-815	2-F	2-F, 4-Cl
A-816	2-Cl	2-F, 4-Cl
A-817	2-CH ₃	2-F, 4-Cl
A-818	2-CF ₃	2-F, 4-Cl
A-819	2-OCH ₃	2-F, 4-Cl
A-820	2-OCF ₃	2-F, 4-Cl
A-821	3-F	2-F, 4-Cl
A-822	3-Cl	2-F, 4-Cl
A-823	3-CH ₃	2-F, 4-Cl
A-824	3-CF ₃	2-F, 4-Cl
A-825	3-OCH ₃	2-F, 4-Cl
A-826	3-OCF ₃	2-F, 4-Cl

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-827	2-F	2-F, 4-Br
A-828	2-Cl	2-F, 4-Br
A-829	2-CH ₃	2-F, 4-Br
A-830	2-CF ₃	2-F, 4-Br
A-831	2-OCH ₃	2-F, 4-Br
A-832	2-OCF ₃	2-F, 4-Br
A-833	3-F	2-F, 4-Br
A-834	3-Cl	2-F, 4-Br
A-835	3-CH ₃	2-F, 4-Br
A-836	3-CF ₃	2-F, 4-Br
A-837	3-OCH ₃	2-F, 4-Br
A-838	3-OCF ₃	2-F, 4-Br
A-839	2-F	2-F, 4-CH ₃
A-840	2-Cl	2-F, 4-CH ₃
A-841	2-CH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-842	2-CF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-843	2-OCH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-844	2-OCF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-845	3-F	2-F, 4-CH ₃
A-846	3-Cl	2-F, 4-CH ₃
A-847	3-CH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-848	3-CF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-849	3-OCH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-850	3-OCF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-851	2-F	2-F, 4-CF ₃
A-852	2-Cl	2-F, 4-CF ₃
A-853	2-CH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-854	2-CF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-855	2-OCH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-856	2-OCF ₃	2-F, 4-CF ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-857	3-F	2-F, 4-CF ₃
A-858	3-Cl	2-F, 4-CF ₃
A-859	3-CH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-860	3-CF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-861	3-OCH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-862	3-OCF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-863	2-F	2-F, 4-OCH ₃
A-864	2-Cl	2-F, 4-OCH ₃
A-865	2-CH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-866	2-CF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-867	2-OCH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-868	2-OCF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-869	3-F	2-F, 4-OCH ₃
A-870	3-Cl	2-F, 4-OCH ₃
A-871	3-CH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-872	3-CF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-873	3-OCH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-874	3-OCF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-875	2-Cl	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-876	2-CH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-877	2-CF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-878	2-OCH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-879	2-OCF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-880	3-F	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-881	3-Cl	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-882	3-CH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-883	3-CF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-884	3-OCH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-885	3-OCF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-886	2-F	2-CH ₃ , 4-OCH ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-887	2-Cl	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-888	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-889	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-890	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-891	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-892	3-F	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-893	3-Cl	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-894	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-895	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-896	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-897	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-898	2-F	2-CH ₃ , 4-Cl
A-899	2-Cl	2-CH ₃ , 4-Cl
A-900	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-901	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-902	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-903	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-904	3-F	2-CH ₃ , 4-Cl
A-905	3-Cl	2-CH ₃ , 4-Cl
A-906	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-907	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-908	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-909	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-910	2-F	2-CH ₃ , 4-F
A-911	2-Cl	2-CH ₃ , 4-F
A-912	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-913	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-914	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-915	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-916	3-F	2-CH ₃ , 4-F

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-917	3-Cl	2-CH ₃ , 4-F
A-918	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-919	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-920	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-921	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-922	2-F	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-923	2-Cl	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-924	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-925	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-926	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-927	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-928	3-F	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-929	3-Cl	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-930	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-931	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-932	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-933	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-934	2-F	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-935	2-Cl	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-936	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-937	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-938	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-939	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-940	3-F	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-941	3-Cl	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-942	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-943	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-944	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-945	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-946	2-F	2-OCH ₃ , 4-F

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-947	2-Cl	2-OCH ₃ , 4-F
A-948	2-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-949	2-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-950	2-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-951	2-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-952	3-F	2-OCH ₃ , 4-F
A-953	3-Cl	2-OCH ₃ , 4-F
A-954	3-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-955	3-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-956	3-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-957	3-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-958	2-F	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-959	2-Cl	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-960	2-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-961	2-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-962	2-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-963	2-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-964	3-F	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-965	3-Cl	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-966	3-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-967	3-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-968	3-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-969	3-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-970	2-F	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-971	2-Cl	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-972	2-CH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-973	2-CF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-974	2-OCH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-975	2-OCF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-976	3-F	3-NO ₂ , 4-CH ₃

FS

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-977	3-Cl	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-978	3-CH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-979	3-CF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-980	3-OCH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-981	3-OCF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-982	3-F	2-CF ₃ , 4-Cl
A-983	3-Cl	2-CF ₃ , 4-Cl
A-984	3-CH ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-985	3-CF ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-986	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-987	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-988	3-F	2-Cl, 4-CF ₃
A-989	3-Cl	2-Cl, 4-CF ₃
A-990	3-CH ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-991	3-CF ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-992	3-OCH ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-993	3-OCF ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-994	3-F	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-995	3-Cl	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-996	3-CH ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-997	3-CF ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-998	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-999	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-1000	3-F	3-Cl, 4-CF ₃
A-1001	3-Cl	3-Cl, 4-CF ₃
A-1002	3-CH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1003	3-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1004	3-OCH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1005	3-OCF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1006	3-F	2-CF ₃ , 5-F

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1007	3-Cl	2-CF ₃ , 5-F
A-1008	3-CH ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1009	3-CF ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1010	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1011	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1012	3-F	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1013	3-Cl	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1014	3-CH ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1015	3-CF ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1016	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1017	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1018	3-F	2-Cl, 5-CF ₃
A-1019	3-Cl	2-Cl, 5-CF ₃
A-1020	3-CH ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1021	3-CF ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1022	3-OCH ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1023	3-OCF ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1024	3-F	2-F, 5-CF ₃
A-1025	3-Cl	2-F, 5-CF ₃
A-1026	3-CH ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1027	3-CF ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1028	3-OCH ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1029	3-OCF ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1030	3-F	3-F, 4-CF ₃
A-1031	3-Cl	3-F, 4-CF ₃
A-1032	3-CH ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1033	3-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1034	3-OCH ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1035	3-OCF ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1036	3-F	3-Cl, 4-CF ₃

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1037	3-Cl	3-Cl, 4-CF ₃
A-1038	3-CH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1039	3-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1040	3-OCH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1041	3-OCF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1042	3-F	3-Cl, 4-Cl
A-1043	3-Cl	3-Cl, 4-Cl
A-1044	3-CH ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1045	3-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1046	3-OCH ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1047	3-OCF ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1048	3-F	3-F, 4-Cl

No.	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1049	3-Cl	3-F, 4-Cl
A-1050	3-CH ₃	3-F, 4-Cl
A-1051	3-CF ₃	3-F, 4-Cl
A-1052	3-OCH ₃	3-F, 4-Cl
A-1053	3-OCF ₃	3-F, 4-Cl
A-1054	3-F	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1055	3-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1056	3-CH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1057	3-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1058	3-OCH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1059	3-OCF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl

Table 2

- Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-2 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 3

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-3 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 4

- Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-4 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 5

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-5 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

- Table 6

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-6 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 7

- Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-7 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 8

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-8 and the combination of (R¹)_n and (R²)_m in each case corresponds to one line of Table B.

Table 9

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-9 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 10

5 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-10 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 11

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-11 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 12

10 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-12 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 13

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-13 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

15 Table 14

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-14 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 15

20 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-15 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 16

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-16 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 17

25 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-17 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 18

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-18 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

30 Table 19

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-19 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 20

35 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-20 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 21

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-21 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 22

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-22 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 23

5 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-23 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 24

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-24 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 25

10 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-25 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 26

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-26 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

15 Table 27

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-27 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 28

20 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-28 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 29

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-29 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 30

25 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-30 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 31

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-31 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

30 Table 32

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-32 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 33

35 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-33 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 34

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-34 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 35

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-35 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 36

- 5 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-36 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 37

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-37 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

- 10 Table 38

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-38 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 39

- 15 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-39 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 40

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-40 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 41

- 20 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-41 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 42

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-42 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

- 25 Table 43

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-43 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 44

- 30 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-44 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 45

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-45 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 46

- 35 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-46 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 47

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-47 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 48

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-48 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 49

- 5 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-49 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 50

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-50 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

- 10 Table 51

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-51 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 52

- 15 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-52 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 53

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-53 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

Table 54

- 20 Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-54 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

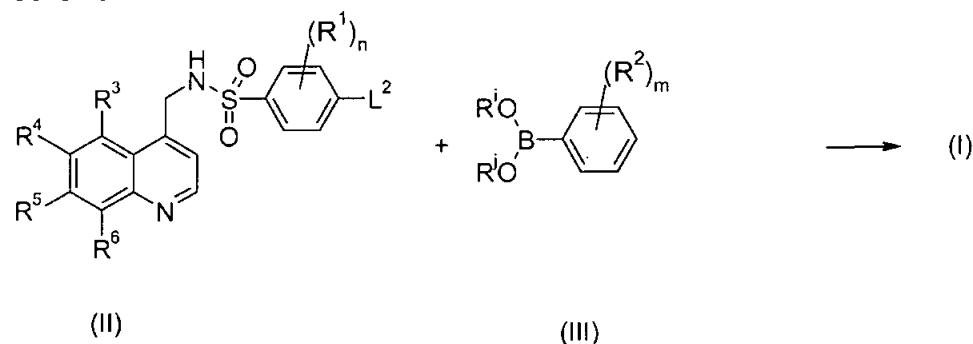
Table 55

Compounds of the formula (I.A) wherein Q denotes Q-55 and the combination of $(R^1)_n$ and $(R^2)_m$ in each case corresponds to one line of Table B.

- 25 The compounds of the formula (I) according to the present invention can be prepared by various routes in analogy to prior art processes known per se for preparing biphenyl compounds. Advantageously, they can be obtained as outlined in schemes 1 and 2.

- 30 Generally, quinoline compounds of formula (I) can be prepared by reaction of a compound of formula (II) with a boronic acid derivative of the formula (III) by a Suzuki coupling as shown in scheme 1.

Scheme 1:



In scheme 1, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n and m are as defined above, R^i and R^j are each independently hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl, or R^i and R^j together form an 1,2-ethylene or 1,2-propylene moiety the carbon atoms of which may be unsubstituted or may all or in part be substituted by methyl groups, and L^2 is a suitable leaving group.

Suitable leaving groups L^2 are halogen, preferably chlorine, bromine or iodine, alkylcarboxylate, benzoate, alkylsulfonate, haloalkylsulfonate or arylsulfonate, most preferably chlorine or bromine.

The reaction is usually carried out in the presence of a base and a catalyst, in particular a palladium catalyst, such as for example described in the following literature: Synth. Commun. Vol. 11, p. 513 (1981); Acc. Chem. Res. Vol. 15, pp. 178-184 (1982); Chem. Rev. Vol. 95, pp. 2457-2483 (1995); Organic Letters Vol. 6 (16), p. 2808 (2004); "Metal catalyzed cross coupling reactions", 2nd Edition, Wiley, VCH 2005 (Eds. De Meijere, Diederich); "Handbook of organopalladium chemistry for organic synthesis" (Eds Negishi), Wiley, Interscience, New York, 2002; "Handbook of functionalized organometallics", (Ed. P. Knochel), Wiley, VCH, 2005.

Suitable catalysts are in tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0); bis(triphenylphosphine)palladium(II) chloride; bis(acetonitrile)palladium(II) chloride; [1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene]-palladium(II) chloride/methylene chloride (1:1) complex; bis[bis-(1,2-diphenylphosphino)ethane]palladium(0); bis(bis-(1,2-diphenylphosphino)butane)-palladium(II) chloride; palladium(II) acetate; palladium(II) chloride; and palladium(II) acetate/tri-*o*-tolylphosphine complex or mixtures of phosphines and Pd salts or phosphines and Pd-complexes e.g. dibenzylideneacetone-palladium and tri-*tert*-butylphosphine (or its tetrafluoroborate), triscyclohexylphosphine; or a polymer-bound Pd-triphenylphosphine catalyst system.

Suitable bases are, in general, inorganic compounds, such as alkali metal and alkaline earth metal oxides, such as lithium oxide, sodium oxide, calcium oxide and magnesium oxide, alkali metal and alkaline earth metal carbonates, such as lithium carbonate, sodium carbonate, potassium carbonate, caesium carbonate and calcium carbonate, and also alkali metal bicarbonates, such as sodium bicarbonate, alkali metal and alkaline earth metal alkoxides, such as sodium methoxide, sodium ethoxide,

potassium ethoxide and potassium tert.-butoxide, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, diisopropylethylamine and N-methylpiperidine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines. Particular preference is given to

5 bases such as sodium carbonate, potassium carbonate, caesium carbonate, triethylamine and sodium bicarbonate.

The base is used in a 1:1 to 1:10, preferably a 1:1.5 to 5 molar ratio relative to 1 mole of compounds (II), the boronic acid is used in a 1:1 to 1: 5 ratio, preferably a 1:1 to 1:2.5 molar ratio relative to 1 mole of compounds (II). In some cases it may be

10 beneficial for easy purification to use the boronic acid in a substoichiometric amount of from 0.7:1 to 0.99:1, relative to 1 mole of compounds (II).

The reaction is usually carried out in an inert organic organic solvent. Suitable solvents are aliphatic hydrocarbons, such as pentane, hexane, cyclohexane and petroleum ether, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, ethers,

15 such as diisopropyl ether, tert.-butyl methyl ether, dioxane, anisole and tetrahydrofuran and dimethoxyethane, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, diethyl ketone and tert.-butyl methyl ketone, and also dimethyl sulfoxide, dimethylformamide and dimethylacetamide, particularly preferably ethers, such as tetrahydrofuran, dioxane and dimethoxyethane. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned, or

20 mixtures with water.

The reaction is usually carried out at temperatures of from 20°C to 180°C, preferably from 40°C to 120°C.

After completion of the reaction, the compounds of formula (I) can be isolated by employing conventional methods such as adding the reaction mixture to water,

25 extracting with an organic solvent, concentrating the extract an the like. The isolated compounds (I) can be purified by a technique such as chromatography, recrystallization and the like, if necessary.

It is also possible to add a scavenger to the reaction mixtures to remove byproducts or unreacted starting materials by binding to those and simple filtration. For

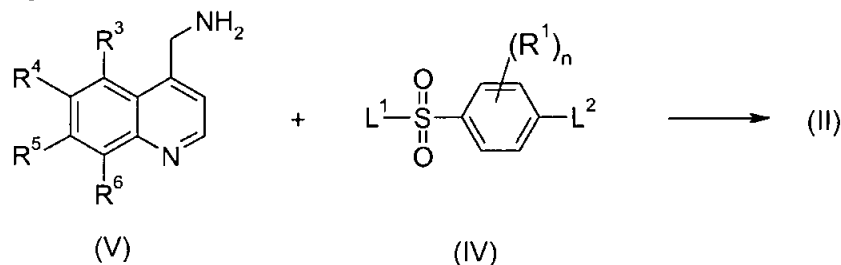
30 details see "Synthesis and purification catalog", Argonaut, 2003 and literature cited therein.

Boronic acids or esters (III) are commercially available or can be prepared according to "Science of Synthesis" Vol. 6, Thieme, 2005; WO 02/042275; Synlett 2003, (8) p.1204; J. Org. Chem., 2003, 68, p. 3729, Synthesis, 2000, p.442, J. Org.

35 Chem., 1995, 60, p. 750; or "Handbook of functionalized organometallics", (Ed. P. Knochel), Wiley, VCH, 2005.

Compounds (II) can be obtained by reaction of sulfonylchlorides (IV) with quinolines (V) as shown in scheme 2.

Scheme 2



In scheme 2, L², R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, n and m are as defined above, and L¹ is a leaving group such as hydroxy or halogen, preferably chlorine.

The reaction of a sulfonylchloride (IV) with a quinoline (V) can be performed in accordance with standard methods of organic chemistry, see for example, Lieb. Ann. Chem. P. 641, 1990, or WO 2005/033081

This reaction is usually carried out in an inert organic solvent. Suitable solvents are aliphatic hydrocarbons, such as pentane, hexane, cyclohexane and petroleum ether, aromatic hydrocarbons, such as toluene, o-, m- and p-xylene, halogenated hydrocarbons, such as dichloromethane, chloroform and chlorobenzene, ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, tert.-butyl methyl ether, dioxane, anisole and tetrahydrofuran, nitriles, such as acetonitrile and propionitrile, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, diethyl ketone and tert.-butyl methyl ketone, and also dimethyl sulfoxide, dimethylformamide and dimethylacetamide, preferably tetrahydrofuran, methyl tert-butyl ether, methylene chloride, chloroform, acetonitrile, toluene or dimethylformamide. It is also possible to use mixtures of the solvents mentioned.

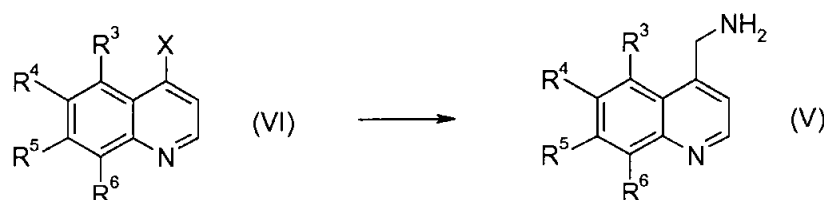
It may be advantageous to carry out the reaction in the presence of a base. Suitable bases are, in general, inorganic compounds, such as alkali metal and alkaline earth metal hydroxides, such as lithium hydroxide, sodium hydroxide, potassium hydroxide and calcium hydroxide, alkali metal and alkaline earth metal oxides, such as lithium oxide, sodium oxide, calcium oxide and magnesium oxide, alkali metal and alkaline earth metal hydrides, such as lithium hydride, sodium hydride, potassium hydride and calcium hydride, alkali metal and alkaline earth metal carbonates, such as lithium carbonate, potassium carbonate and calcium carbonate, and also alkali metal bicarbonates, such as sodium bicarbonate, moreover organic bases, for example tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, diisopropylethylamine and N-methylpiperidine, pyridine, substituted pyridines, such as collidine, lutidine and 4-dimethylaminopyridine, and also bicyclic amines. Particular preference is given to pyridine, triethylamine and potassium carbonate. The bases are generally employed in equimolar amounts, in excess or, if appropriate, as solvent. The excess of base is typically 0.5 to 5 molar equivalents relative to 1 mole of compounds (V).

Generally, the reaction is carried out at temperatures of from -30°C to 120°C, preferably from -10°C to 100°C.

The starting materials are generally reacted with one another in equimolar amounts.

- 5 If sulfonylchlorides (IV) are not commercially available, they can be obtained according to procedures known in the art.

Quinolines (V) are known from the literature or are commercially available (e.g.: 4-methylenaminoquinoline: CAS-Nr 5632-13-3; 6-chloro-4-methylenaminoquinoline: CAS-Nr 859814-05-5; 6-methoxy-4-methylenaminoquinoline: CAS-Nr 708261-71-6; 10 8-hydroxy-4-methylenaminoquinoline: CAS-Nr 33976-91-9; 6-methoxy-8-chloro-4-methylenaminoquinoline: CAS-Nr 857207-07-9), or they can be prepared from quinoline precursors (VI) wherein X is as defined in the following scheme by reduction:



VIa: X = CH=N-OH

VIb: X = CN

VIc: X = C(=O)NH₂

- 15 Methods of this reduction can be found in the literature e.g. in Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968; Band 11/2, 1957; Band E5, 1985; J. Heterocycl. Chem., 1997, 34 (6), pp. 1661-1667; J. Chem. Soc. 1954, p. 1165; Heterocycles, 41(4), pp. 675-688, 1995; J. Org. Chem., 1982, 47, p. 3153; Heterocycles, 1996, 43 (9), pp.1893-1900; J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8), pp. 695-697, 1994; or are known to
20 those skilled in the art.

The oxims (VIa) can be prepared from either the respective aldehyd (X=CHO; compounds (VI d)) or the methyl derivative (X=CH₃; compounds (VI e)), as described in Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968; Band 11/2, 1957; Band E5, 1985; J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8), pp. 695-697, 1994; Tetrahedron Lett. 42(39), pp.6815-
25 6818, 2001; or Heterocycles, 29(9), pp.1741-1760, 1989.

The aldehyds (VI d) are commercially available (e.g 6-chloro-4-quinolinecarb-aldehyde, 7-methoxy-4-quinolinecarb-aldehyde, quinoline-4-carbaldehyde) or can be synthesized from a 4-methylquinoline as outlined in J. Org. Chem. 51(4), pp. 536-537, 1986, or from a haloderivative (X= halogen, compounds (VI f)) as shown in Eur. J. Org.
30 Chem., 2003, (8), pp. 1576-1588; Tetrahedron Lett. 1999, 40 (19), pp. 3719-3722; Tetrahedron, 1999, 55 (41), pp. 12149-12156.

85

The methyl derivatives (VIe) are commercially available (e.g. 6-chloro 4-methylquinoline; 6,8-dimethoxy-quinoline) or can be synthesized according to "Science of Synthesis", Vol 15, Thieme, Stuttgart, 2005.

- 5 The nitriles (VIb) can be prepared either from the respective halogen derivative (VIc) (X=halogen, preferably chlorine, bromine or iodine,) by reaction with a cyanide source with or without additional catalysts, as described e.g. in Tetrahedron Lett. 42(38), pp. 6707-6710, 2001; Chem. Eur. J., 2003, 9 (8), pp. 1828-1836; Chem. Commun. (Cambridge), 2004, (12), pp. 1388-1389; J. Organomet. Chem. 2004, 689 (24), pp. 4576-4583; or J. Chem. Soc. Perk. T., 1 (16), pp. 2323-2326, 1999.
- 10 Alternatively, the amide or oxime may be dehydrated to the corresponding nitrile (VIb) as outlined in "Synthesis", Stuttgart, (10), pp. 943-944, 1992; or literature cited therein; or Heterocycl. Chem. 1997, 34 (6), pp. 1661-1667.

- The 4-halogeno quinolines (VIc) are either commercially available or can be synthesized according to "Science of Synthesis", Vol 15, Thieme, Stuttgart, 2005 or
- 15 e.g. according to the following literature or citations therein: 4-chloro-6,7-dimethoxy-quinoline: Journal Med. Chem. 48(5), p. 1359, 2005; 4-chloro-5,7-dichloro-quinoline: Indian, 187817, 29 Jun 2002; 4-chloro-7-chloro-quinoline: Tetrahedron, 60 (13), p. 3017, 2004; 4-chloro-7-trifluoromethyl-quinoline; Tetrahedron lett., 31(8), p. 1093, 1990; 4-chloro-7,8-dimethoxy-quinoline: Tetrahedron, 41 (15), p.3033, 1985; 4-chloro-
- 20 8-methoxy quinoline: Chem. Berichte 118(4), p.1556, 1985; 4-chloro-(6 or 7 or 8)-iodo quinoline, 4-bromo-(6 or 7 or 8)-iodo-quinoline, 4-iodo-(6 or 7 or 8)-iodo-quinoline: J. Med. Chem., 21(3), p. 268, 1978.

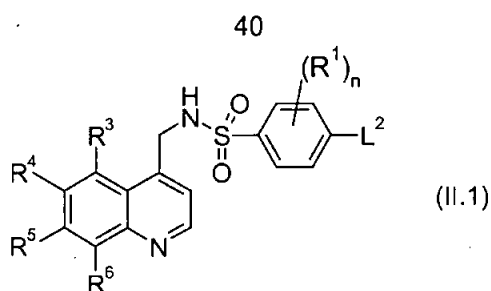
- Further methods to build up appropriate precursors or modify substitution pattern can be found in "Synthesis", Stuttgart (1), pp. 31-32, 1993; Tetrahedron, 1993, 49 (24),
- 25 pp. 5315-5326; "Methods in Science of Synthesis", Band 15, and literature cited therein; Bioorg. Med. Chem. Lett. 1997, 7 (23), pp. 2935-2940; J. Am. Chem. Soc., 1946, 68, p. 1264; or Org. Synth.1955, III, p. 272.

- The N-oxides may be prepared from the compounds (I) according to conventional oxidation methods, for example by treating a compound (I) with an organic peracid
- 30 such as metachloroperbenzoic acid [Journal of Medicinal Chemistry, 38(11), 1892-1903 (1995); WO 03/64572] or with inorganic oxidizing agents such as hydrogen peroxide, [see Journal of Heterocyclic Chemistry, 18(7), 1305-8 (1981)] or oxone, see Journal of the American Chemical Society, 123(25), 5962-5973 (2001).

- In some cases it can be beneficial in terms of ease of work up or purification to
- 35 perform the reduction of compounds (VI) to compounds (V) and the reaction of the amine (V) with the compound (IV) in one pot without isolating compounds (V).

Some of the intermediates of formula (II) are novel. These are also subject of this invention.

Especially, the intermediates of formula (II.1) are subject of the present invention:



wherein

L^2 is chlorine, bromine or iodine, and

n , R^1 , R^3 , R^4 , R^5 and R^6 have the meanings as defined above for compounds of

5 formula (I), especially those given as preferred ones.

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

10 The preparation of the compounds of formula (I) may lead to them being obtained as isomer mixtures (stereoisomers, enantiomers). If desired, these can be resolved by the methods customary for this purpose, such as crystallization or chromatography, also on optically active adsorbate, to give the pure isomers.

Due to their excellent activity, the compounds of the general formula (I) as well as the N-oxides and salts thereof may be used for controlling animal pests, selected from
15 harmful insects, arachnids and nematodes.

Accordingly, the invention further relates to agriculturally composition for combating such animal pests, which comprises such an amount of at least one compound of the general formula (I), an N-oxide or an agronomically acceptable salt thereof, and at least one inert liquid and/or solid agronomically acceptable carrier that
20 has a pesticidal action and, if desired, at least one surfactant.

Such a composition may contain a single active compound of the formula (I), an N-oxide or an agronomically acceptable salt thereof, or a mixture of several active compounds of the formula (I), N-oxides or agronomically acceptable salts thereof according to the present invention.

25 The compounds of the formula (I) as well as N-oxides or agronomically acceptable salts thereof and the pesticidal compositions comprising them are effective agents for controlling arthropod pests and nematodes. Animal pests controlled by the compounds of formula (I) include for example

30 Insects from the order of the lepidopterans (Lepidoptera), for example *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia*

- ambiguella, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*,
5 *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*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella*
10 *xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula 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*
15 *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*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica*
20 *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*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*,
25 *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* and *Sitophilus granaria*;
dipterans (Diptera), for example *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya*
30 *hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*,
35 *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* and *Tipula paludosa*;

thrips (Thysanoptera), e.g. *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*;

- 5 hymenopterans (Hymenoptera), e.g. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* and *Solenopsis invicta*;

- 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*;

- homopterans (Homoptera), e.g. *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus*
 15 *helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*,
 20 *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *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*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis*
 25 *mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, and *Viteus vitifolii*;

termites (Isoptera), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* und *Termes natalensis*;

- 30 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*
 35 *asynamorus* ;

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*,

- 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 Phytanemus pallidus and Polyphagotarsonemus latus; Tenuipalpidae spp. such as Brevipalpus phoenicis; Tetranychidae spp. such as Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius and Tetranychus urticae, Panonychus ulmi, Panonychus citri, and oligonychus pratensis ;
- Siphonatera, e.g. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp.;
- 10 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;
- cyst-forming nematodes, Globodera rostochiensis and other Globodera species;
- 15 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 other Bursaphelenchus species; Ring nematodes, Criconema species, Criconemella species, Criconemoides species, Mesocriconema species; Stem and bulb nematodes,
- 20 Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci and other Ditylenchus species; Awl nematodes, Dolichodorus species; Spiral nematodes, Helicotylenchus multicinctus and other Helicotylenchus species; Sheath and sheathoid nematodes, Hemicycliophora species and Hemicriconemoides species; Hirshmanniella species; Lance nematodes,
- 25 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;
- 30 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
- 35 plant parasitic nematode species.

In a preferred embodiment of the invention the compounds of formula (I), their N-oxides or their agronomically acceptable salts are used for controlling arthropodes, such as 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)

96

according to the present invention are particularly useful for controlling insects of the order Thysanoptera and Homoptera.

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

The compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts, can be converted into the customary formulations, for example solutions,
10 emulsions, suspensions, dusts, powders, pastes and granules. The use form depends on the particular intended purpose; in each case, it should ensure a fine and even distribution of the compound according to the invention.

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",
15 Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th
20 Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), for example by
25 extending the active compound with auxiliaries suitable for the formulation of agrochemicals, such as solvents and/or carriers, if desired emulsifiers, surfactants and dispersants, preservatives, antifoaming agents, anti-freezing agents, for seed treatment formulation also optionally colorants and/or binders and/or gelling agents.

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

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.

92

Suitable surfactants used are alkali metal, alkaline earth metal and ammonium salts of lignosulfonic acid, naphthalenesulfonic acid, phenolsulfonic acid, dibutyl naphthalene-sulfonic acid, alkylarylsulfonates, alkyl sulfates, alkylsulfonates, fatty alcohol sulfates, fatty acids and sulfated fatty alcohol glycol ethers, furthermore

5 condensates of sulfonated naphthalene and naphthalene derivatives with formaldehyde, condensates of naphthalene or of naphthalenesulfonic acid with phenol and formaldehyde, polyoxyethylene octylphenol ether, ethoxylated isooctylphenol, octylphenol, nonylphenol, alkylphenol polyglycol ethers, tributylphenyl polyglycol ether, tristearylphenyl polyglycol ether, alkylaryl polyether alcohols, alcohol and fatty alcohol

10 ethylene oxide condensates, ethoxylated castor oil, polyoxyethylene alkyl ethers, ethoxylated polyoxypropyl-ene, lauryl alcohol polyglycol ether acetal, sorbitol esters, lignosulfite waste liquors and methylcellulose.

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

15 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, highly polar solvents, for example dimethyl sulfoxide, N-methylpyrrolidone or water.

20 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 magnesium stearate.

A suitable preservative is e.g. dichlorophen.

25 Seed treatment formulations may additionally comprise binders and optionally colorants.

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 polyvinylalcohol, polyvinylpyrrolidones, polyacrylates, polymethacrylates,

30 polybutenes, polyisobutylenes, polystyrene, polyethyleneamines, polyethyleneamides, polyethyleneimines (Lupasol®, Polymin®), polyethers, polyurethans, polyvinylacetate, tylose and copolymers derived from these polymers.

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.

35 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.

Example of a gelling agent is carrageen (Satiagel®).

5 Powders, materials for spreading and dustable products 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 compounds to solid carriers.

10 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.

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

20 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.

25 The compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts, 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 compound(s) according to the invention.

30 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. However, it is also possible to prepare concentrates composed of active substance, wetter, tackifier, dispersant or emulsifier and, if appropriate, solvent or oil, and such concentrates are suitable for dilution with water.

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

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

The following are examples of formulations:

- 5 1. Products for dilution with water for foliar applications. For seed treatment purposes, such products may be applied to the seed diluted or undiluted.
- A) Water-soluble concentrates (SL, LS)
- 10 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 90 parts by weight of water or a water-soluble solvent. As an alternative, wetters or other auxiliaries are added. The active compound(s) dissolves upon dilution with water, whereby a
- 10 formulation with 10% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- B) Dispersible concentrates (DC)
- 20 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 70 parts by weight of cyclohexanone with addition of 10 parts by weight of a dispersant, for example
- 15 polyvi-nylpyrrolidone. Dilution with water gives a dispersion, whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- C) Emulsifiable concentrates (EC)
- 15 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 7 parts by weight of xy-lene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate (in
- 20 each case 5 parts by weight). Dilution with water gives an emulsion, whereby a formulation with 15% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- D) Emulsions (EW, EO, ES)
- 25 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 35 parts by weight of xylene with addition of calcium dodecylbenzenesulfonate and castor oil ethoxylate
- 25 (in each case 5 parts by weight). This mixture is introduced into 30 parts by weight of wa-ter by means of an emulsifier machine (e.g. Ultraturrax) and made into a homogeneous emulsion. Dilution with water gives an emulsion, whereby a formulation with 25% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- E) Suspensions (SC, OD, FS)
- 30 In an agitated ball mill, 20 parts by weight of the active compound(s) are comminuted with addition of 10 parts by weight of dispersants, wetters and 70 parts by weight of water or of an organic solvent to give a fine active compound(s) suspension. Dilution with water gives a stable suspension of the active compound(s), whereby a formulation with 20% (w/w) of active compound(s) is obtained.
- 35 F) Water-dispersible granules and water-soluble granules (WG, SG)
- 50 parts by weight of the active compound(s) are ground finely with addition of 50 parts by weight of dispersants and wetters and made as water-dispersible or water-soluble granules by means of technical appliances (for example extrusion, spray tower, fluidized bed). Dilution with water gives a stable dispersion or solution of the active

com-pound(s), whereby a formulation with 50% (w/w) of active compound(s) is obtained.

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

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

H) Gel-Formulation (GF)

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

15 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)

5 parts by weight of the active compound(s) are ground finely and mixed
intimately with 95 parts by weight of finely divided kaolin. This gives a dustable product
20 having 5% (w/w) of active compound(s)

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

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

K) ULV solutions (UL)

10 parts by weight of the active compound(s) are dissolved in 90 parts by weight
of an organic solvent, for example xylene. This gives a product having 10% (w/w) of
active compound(s), which is applied undiluted for foliar use.

30 The compounds of formula (I) are also suitable for the treatment of seeds.
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. Application to
35 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 of surfactant, 0

to 200 g/l of 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.

Other preferred FS formulations of compounds of formula (I) for seed treatment comprise from 0.5 to 80 wt% of the active ingredient, from 0,05 to 5 wt% of a wetter, from 0.5 to 15 wt% of a dispersing agent, from 0,1 to 5 wt% of a thickener, from 5 to 20 wt% of an anti-freeze agent, from 0,1 to 2 wt% of an anti-foam agent, from 1 to 20 wt% of a pigment and/or a dye, from 0 to 15 wt% of a sticker /adhesion agent, from 0 to 75 wt% of a filler/vehicle, and from 0,01 to 1 wt% of a preservative.

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

The compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts, are effective through both contact (via soil, glass, wall, bed net, carpet, plant parts or animal parts), and ingestion (bait, or plant part).

For use against ants, termites, wasps, flies, mosquitos, crickets, or cockroaches, compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts are preferably used in a bait composition.

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 characteristics.

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. 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), their N-oxides and their agronomically acceptable salts, such as aerosols (e.g in spray cans), oil sprays or pump sprays are highly suitable for the non-professional user for controlling pests such as flies, fleas, ticks, mosquitos or cockroaches. Aerosol recipes are preferably composed of the active

96

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 (DMSO), aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene, water, furthermore auxiliaries such as emulsifiers such as sorbitol monooleate, oleyl ethoxylate having 3-7 mol of ethylene oxide, fatty alcohol ethoxylate, perfume oils such as ethereal oils, esters of medium fatty acids with lower alcohols, aromatic carbonyl compounds, if appropriate stabilizers such as sodium benzoate, amphoteric surfactants, lower epoxides, triethyl orthoformate and, if required, propellants such as propane, butane, nitrogen, compressed air, dimethyl ether, carbon dioxide, nitrous oxide, or mixtures of these gases.

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

The compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts and their 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.

Methods to control infectious diseases transmitted by insects (e.g. malaria, dengue and yellow fever, lymphatic filariasis, and leishmaniasis) with compounds of formula (I), their N-oxides and their agronomically acceptable salts 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-cyclohexen-1-yl-carbonyl)-2-methylpiperine, (2-hydroxymethylcyclohexyl) acetic acid lactone, 2-ethyl-1,3-hexandiol, indalone, 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.

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.

The compounds of formula (I), their N-oxides and their or veterinarily acceptable salts thereof are in particular also suitable for being used for combating parasites in
5 and on animals.

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
10 object of the invention is to provide pesticides for animals, which provide a long residual control of the parasites.

The invention also relates to compositions containing a parasitically effective amount of compounds of formula (I), their N-oxides or veterinarily acceptable salts thereof and an acceptable carrier, for combating parasites in and on animals.

15 The present invention also relates to 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 effective amount of a compound of formula (I), the N-oxide or veterinarily acceptable salts thereof or a composition comprising it.

20 The invention also relates to 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), the N-oxide or veterinarily acceptable salts thereof or a composition comprising it.

Activity of compounds against agricultural pests does not suggest their suitability
25 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.

Surprisingly, it has now been found that compounds of formula (I), their N-oxides and the veterinarily acceptable salts thereof are suitable for combating endo- and
30 ectoparasites in and on animals.

Compounds of formula (I), the N-oxides 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
35 infections in mammals such as cattle, sheep, swine, camels, deer, horses, pigs, poultry, rabbits, goats, dogs and cats, water buffalo, donkeys, fallow deer and reindeer, and also in fur-bearing animals such as mink, chinchilla and raccoon, birds such as hens, geese, turkeys and ducks and fish such as fresh- and salt-water fish such as trout, carp and eels.

Compounds of formula (I), the N-oxide thereof 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.

- 5 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.

- 10 The compounds of formula (I), the N-oxides 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), the N-oxides or veterinarily acceptable salts thereof are especially useful for combating ectoparasites.

- 15 The compounds of formula (I), the N-oxides or veterinarily acceptable salts thereof are especially useful for combating parasites of the following orders and species, respectively:

- fleas (Siphonaptera), e.g. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, and *Nosopsyllus fasciatus*,
cockroaches (Blattaria - Blattodea), e.g. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*,
20 *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, and *Blatta orientalis*,
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*
25 *bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*,
Chrysops silacea, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*,
30 *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*
35 sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, and *Tabanus similis*,
lice (Phthiraptera), e.g. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus euryternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*,

Bovicola bovis, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* and *Solenopotes capillatus*.

- ticks and parasitic mites (Parasitiformes): ticks (Ixodida), e.g. *Ixodes scapularis*,
 5 *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*;
- Actiniedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) e.g. *Acarapis* spp.,
 10 *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;
- 15 Bugs (Heteropterida): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. and *Arilus critatus*,
 Anoplurida, e.g. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., and *Solenopotes* spp;
- Mallophagida (suborders Amblycerina and Ischnocerina), e.g. *Trimenopon* spp.,
 20 *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., and *Felicola* spp;
- Roundworms Nematoda:
 Wipeworms and Trichinosis (Trichosyringida), e.g. *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp;
- 25 *Rhabditida*, e.g. *Rhabditis* spp., *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp;
 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.,
 30 *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 *Diectophyma renal*;
- Intestinal roundworms (Ascaridida), e.g. *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*,
 35 *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., and *Oxyuris equi*;
 Camallanida, e.g. *Dracunculus medinensis* (guinea worm);

Spirurida, e.g. Thelazia spp. Wuchereria spp., Brugia spp., Onchocerca spp., Dirofilaria spp., Dipetalonema spp., Setaria spp., Elaeophora spp., Spirocerca lupi, and Habronema spp.;

Thorny headed worms (Acanthocephala), e.g. Acanthocephalus spp.,

5 Macracanthorhynchus hirudinaceus and Oncicola spp.;

Planarians (Plathelminthes):

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

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

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

Moreover, the use of the compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof and compositions containing them for combating mosquitoes is especially preferred.

The use of the compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof and compositions containing them for combating flies is a further preferred embodiment of
20 the present invention.

Furthermore, the use of the compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof and compositions containing them for combating fleas is especially preferred.

The use of the compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof and compositions containing them for combating ticks is a further preferred embodiment of
25 the present invention.

The compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof also are especially useful for combating endoparasites (roundworms nematoda, thorny headed worms and planarians).

Administration can be carried out both prophylactically and therapeutically.

30 Administration of the active compounds is carried out directly or in the form of suitable preparations, orally, topically/dermally or parenterally.

For oral administration to warm-blooded animals, the compounds of formula (I), the N-oxides or veterinary salts thereof may be formulated as animal feeds, animal feed premixes, animal feed concentrates, pills, solutions, pastes, suspensions,
35 drenches, gels, tablets, boluses and capsules. In addition, the compounds of formula (I) the N-oxides or veterinary acceptable salts thereof may be administered to the animals in their drinking water. For oral administration, the dosage form chosen should provide the animal with 0.01 mg/kg to 100 mg/kg of animal body weight per day of the

formula (I) compound, preferably with 0.5 mg/kg to 100 mg/kg of animal body weight per day.

Alternatively, the compounds of formula (I) may be administered to animals parenterally, for example, by intraruminal, intramuscular, intravenous or subcutaneous injection. The compounds of formula (I) may be dispersed or dissolved in a physiologically acceptable carrier for subcutaneous injection. Alternatively, the compounds of formula (I) may be formulated into an implant for subcutaneous administration. In addition the compounds of formula (I) 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 compound of formula (I).

The compounds of formula (I) 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 compounds of formula (I). In addition, the compounds of formula (I) may be formulated as ear tags for animals, particularly quadrupeds such as cattle and sheep.

Suitable preparations are:

Solutions such as oral solutions, concentrates for oral administration after dilution, solutions for use on the skin or in body cavities, pouring-on formulations, gels;

Emulsions and suspensions for oral or dermal administration; semi-solid preparations;

Formulations in which the active compound is processed in an ointment base or in an oil-in-water or water-in-oil emulsion base;

Solid preparations such as powders, premixes or concentrates, granules, pellets, 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, 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.

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.

Suitable preservatives are benzyl alcohol, trichlorobutanol, p-hydroxybenzoic acid esters, and n-butanol.

- 5 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.

- 10 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 being necessary.

- 15 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. dipropylene glycol monomethyl ether, ketones such as acetone, methyl ethyl ketone, aromatic hydrocarbons, vegetable and synthetic oils, dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide, transcitol, solketal, propylenecarbonate, and mixtures thereof.

- 20 It may be advantageous to add thickeners during preparation. Suitable thickeners are inorganic thickeners such as bentonites, colloidal silicic acid, aluminium monostearate, organic thickeners such as cellulose derivatives, polyvinyl alcohols and their copolymers, acrylates and methacrylates.

- 25 Gels are applied to or spread on the skin or introduced into body cavities. Gels are 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.

- 30 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.

- 35 Suitable solvents 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 monobutyl ether, ketones such as acetone, methyl

L03

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-oxy-methylene-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 triglyceride, triglyceride 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 glycol pelargonate, 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 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, sorbitol and mixtures thereof.

Suitable emulsifiers are:

- 5 non-ionic surfactants, e.g. polyethoxylated castor oil, polyethoxylated sorbitan monooleate, sorbitan monostearate, glycerol monostearate, polyoxyethyl stearate, 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,
- 10 mono/dialkyl polyglycol ether orthophosphoric acid ester monoethanolamine salt;
- cation-active surfactants, such as cetyltrimethylammonium chloride.

- 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,
- 15 polyvinylpyrrolidone, polyvinyl alcohol, copolymers of methyl vinyl ether and maleic anhydride, polyethylene glycols, waxes, colloidal silicic acid or mixtures of the 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
- 20 of 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.

Other auxiliaries which may be mentioned are those given above.

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

- For the production of solid preparations, the active compound is mixed with suitable excipients, if appropriate with addition of auxiliaries, and brought into the
- 30 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
- 35 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.

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.

5 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
10 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.

The compositions which can be used in the invention can comprise generally from about 0.001 to 95% of the compound of formula (I) or of the N-oxide or salt
15 thereof.

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.

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

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

25 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 percent by weight, very particularly preferably of 0.005 to 0.25 percent by weight.

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

30 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
35 200 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.

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

These 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 of pesticides together with which the compounds of formula (I) can be used, is intended to illustrate the possible combinations, but not to impose any limitation:

Organo(thio)phosphates: acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-methyl, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorfenvinphos, coumaphos, cyanophos, demeton-S-methyl, diazinon, dichlorvos/ DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fosthiazate, heptenophos, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, methyl-parathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, paraoxon, parathion, parathion-methyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phorate, phoxim, pirimiphos, pirimiphos-methyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, sulprophos, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon, vamidothion;

Carbamates: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofoncarb, fenobucarb, fenoxycarb, formethanat, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazemate, trimethacarb, XMC, xylylcarb;

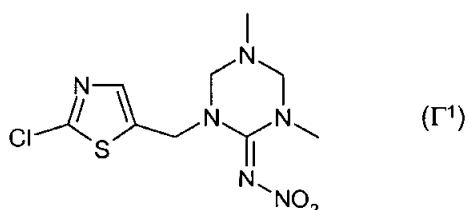
Pyrethroids: acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-cyclopentenyl, bioresmethrin, cycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cyphenothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-

- cypermethrin, deltamethrin, empenethrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, permethrin, phenothrin, prallethrin, profluthrin, pyrethrin I and II, resmethrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin,
- 5 dimefluthrin, ZXI 8901;

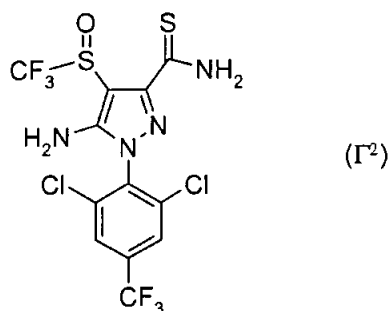
- Growth regulators: a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas; bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucyclohexuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazole, clofentezine; b) ecdysone antagonists: chlormafenozone, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide, azadirachtin; c) juvenoids: pyriproxyfen, hydroprene, kinoprene, methoprene, fenoxycarb; d) lipid biosynthesis inhibitors: spirotetramat, spiromesifen, spirotetramat;
- 10

- Nicotinic receptor agonists/antagonists compounds: acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, thiacloprid, thiamethoxam, nicotine, bensultap, cartap hydrochloride, thiocyclam, thiosultap-sodium;
- 15

the thiazol compound of formula (Γ^1)



- GABA antagonist compounds: acetoprole, chlordane, endosulfan, ethiprole, gamma-HCH (lindane), fipronil, vanilprole, pyrafluprole, pyriprole, vanilprole, the phenylpyrazole compound of formula Γ^2
- 20



Macrocyclic lactone insecticides: abamectin, emamectin, emamectin benzoate, milbemectin, lepimectin, spinosad.

- METI I compounds: fenazaquin, fenpyroximate, flufenimer, pyridaben, pyrimidifen, rotenone, tebufenpyrad, tolfenpyrad;
- 25

METI II and III compounds: acequinocyl, fluacryprim, hydramethylnon;

Uncoupler compounds: chlorfenapyr, DNOC;

208

Oxidative phosphorylation inhibitor compounds: azocyclotin, cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxide, propargite, tetradifon;

Moulting disruptor compounds: cyromazine;

Mixed Function Oxidase inhibitor compounds: piperonyl butoxide;

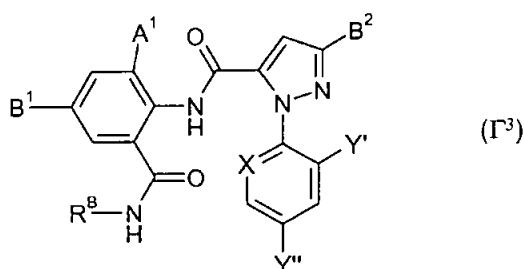
5 Sodium channel blocker compounds: indoxacarb, metaflumizone;

Inorganic compounds: aluminium phosphide, borax, cryolite, cyanide, sulfuryl fluoride, phosphine;

Microbial disruptors of insect midgut membranes: bacillus thuringiensis subsp. israelensis, bacillus sphaericus, bacillus thuringiensis subsp. aizawai, bacillus thuringiensis subsp. kurstaki, bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis;

Various: amitraz, benclothiaz, benzoximat, bifenazate, bromopropylate, cartap, chinomethionat, chloropicrin, flonicamid, methyl bromide, pyridalyl, pymetrozine, rynaxypursulfur, tartar emetic, thiocyclam, tribufosflubendiamide, cyenopyrafen, flupyrzofos, cyflumetofen, amidoflumet, NNI-0101;

15 N-R'-2,2-dihalo-1-R''-cyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')-propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone, wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl, anthranilamide compounds of formula Γ^3



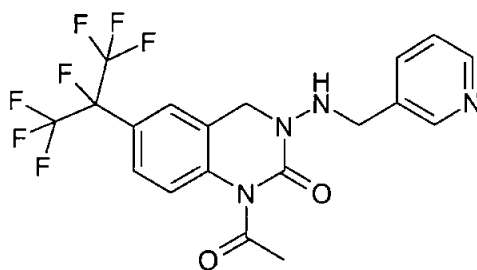
20

wherein A¹ is CH₃, Cl, Br, I, X is C-H, C-Cl, C-F or N, Y' is F, Cl, or Br, Y'' is F, Cl, CF₃, B¹ is hydrogen, Cl, Br, I, CN, B² is Cl, Br, CF₃, OCH₂CF₃, OCF₂H, and R^B is hydrogen, CH₃ or CH(CH₃)₂, and malononitrile compounds as described in JP 2002 284608,

25 WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, or JP 2004 99597.

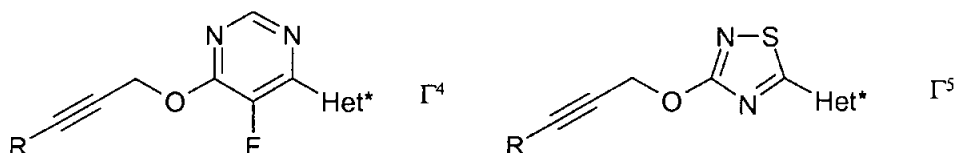
The compounds of formula (I) of the present invention may also be combined with a fluorinated quinazolinone compound as:

63



1-acetyl-3-[(pyridin-3-ylmethyl)-amino]-6-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluoromethyl-ethyl)-3,4-dihydro-1H-quinazolin-2-one.

- 5 The compounds of formula (I) of the present invention also be combined with a pyrimidinyl alkynylether compounds Γ^4 or thiadiazolyl alkynylether compounds Γ^5 :



- 10 wherein R is methyl or ethyl and Het* is 3,3-dimethylpyrrolidin-1-yl, 3-methylpiperidin-1-yl, 3,5-dimethylpiperidin-1-yl, 4-methylpiperidin-1-yl, hexahydroazepin-1-yl, 2,6-dimethylhexahydroazepin-1-yl or 2,6-dimethylmorpholin-4-yl. These compounds are described e.g. in JP 2006131529.

- 15 The afore-mentioned mixing partners are commercially available and may be found in The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003) among other publications.

Thiamides of formula Γ^2 and their preparation have been described in WO 98/28279.

- 20 Lepimection is known from Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004. 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.
- 30 Cyflumetofen and its preparation have been described in WO 04/080180.

Anthranilamide compounds of formula I³ and their preparation 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.

- 5 Fungicidal mixing partners are those selected from the group consisting of acylalanines such as benalaxyl, metalaxyl, ofurace, oxadixyl, amine derivatives such as aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph, anilinopyrimidines such as pyrimethanil, mepanipyrim or cyrodinyl, antibiotics such as cycloheximid, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin
- 10 or streptomycin, azoles such as bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazole,
- 15 flutriafol, dicarboximides such as iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin, dithiocarbamates such as ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb, heterocyclic compounds such as anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim,
- 20 carboxin, oxycarboxin, cyazofamid, dazomet, dithianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, silthiofam, thiabendazole, thifluzamid, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole, triforine, copper fungicides such as Bordeaux mixture, copper acetate, copper oxychloride,
- 25 basic copper sulfate, nitrophenyl derivatives such as binapacryl, dinocap, dinobuton, nitrophthalisopropyl, phenylpyrroles such as fenpiclonil or fludioxonil, sulfur,
- 30 other fungicides such as acibenzolar-S-methyl, benthiavalicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezin, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenzene, metrafenon, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-methyl, quintozone, zoxamid,
- 35 strobilurins such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin or trifloxystrobin, sulfenic acid derivatives such as captan, dichlofluanid, folpet, tolylfluanid, cinnemamides and analogs such as dimethomorph, flumetover or flumorph.

P 1 1

The animal pest, i.e. arthropodes and nematodes, the plant, soil or water in which the plant is growing can be contacted with the present compound(s) (I), the N-oxides or salts thereof or composition(s) containing them by any application method known in the art. As such, "contacting" includes both direct contact (applying the

5 compounds/compositions directly on the animal pest or plant - typically to the foliage, stem or roots of the plant) and indirect contact (applying the compounds/compositions to the locus of the animal pest or plant).

Moreover, animal pests may be controlled by contacting the target pest, its food supply, habitat, breeding ground or its locus with a pesticidally effective amount of

10 compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof. As such, the application may be carried out before or after the infection of the locus, growing crops, or harvested crops by the pest.

"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

20 effective amount of the compositions will also vary according to the prevailing conditions such as desired pesticidal effect and duration, weather, target species, locus, mode of application, and the like.

The compounds of formula (I) the N-oxides or salts thereof and compositions comprising them can be used for protecting wooden materials such as trees, board

25 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

30 into the under-floor soil in order to protect 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 case of application against ants doing harm to crops or

35 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.

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

112

The compounds of formula (I), the N-oxides or salts thereof 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).

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.

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 % by weight, preferably from 0.1 to 45% by weight, and more preferably from 1 to 25% by weight of at least one repellent and / or insecticide.

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

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

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.

In the treatment of seed, the application rates of the mixture 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, in particular from 1 g to 200 g per 100 kg of seed.

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

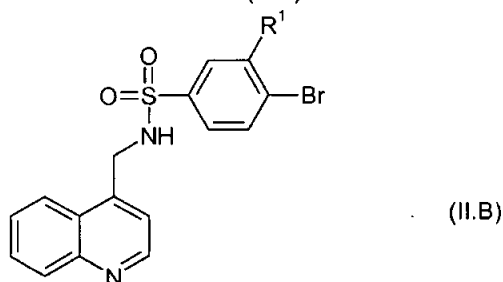
I. Experimental procedures

With due modification of the starting compounds, the protocols shown in the synthesis example below were used for obtaining further compounds (I). The resulting compounds, together with physical data, are listed below in the table C.

The products were characterized by coupled High Performance Liquid Chromatography/ mass spectrometry (HPLC/MS), by ¹H-NMR (400 MHz) in CDCl₃ or d₆-DMSO 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 in a ratio of from 5:95 to 95:5 in 5 minutes at 40°C. MS: Quadrupol electrospray ionisation, 80 V (positiv modus).

113

I.1.1 Preparation of bromosulfonamides (II.B)

5 I.1.1.a) Preparation of 4-bromo-3-fluoro-N-[(quinolin-4-yl)methyl]benzene-sulfonamide (R¹ = F)

A solution of quinolinemethylamine (61 g, 0.023 mol) in triethylamine (3.81 ml, 0.027 mol) was added a solution of 3-fluoro-4-bromo-sulphonic acid chloride (6.24 g, 0.023 mol). The mixture was allowed to stir at ambient temperature for 16 h. Water (20 ml) was added; the precipitate was filtered off, rinsed subsequently with water and methyl-tert-butylether and dried to yield the title compound (4.92 g) as a colourless solid. ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.8 (m, 1 h), 8.6 (m, 1 h), 8.1-7.8 (m, 3 H), 7.8.-7.4 (m, 5 h), 4.6 ppm (s, 2 H).

15 I.1.1.b) Preparation of 4-bromo-3-trifluoromethyl-N-[(quinolin-4-yl)methyl]-benzene-sulfonamide (R¹ = CF₃)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.8 (m, 2 H), 8.1 (m, 8 H), 4.6 ppm (s, 2 H).

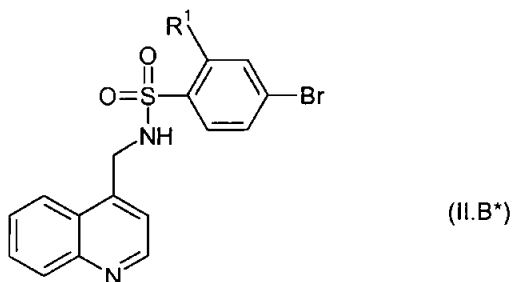
25 I.1.1.c) Preparation of 4-bromo-3-methyl-N-[(quinolin-4-yl)methyl]benzene-sulfonamide (R¹ = CH₃)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.8 (m, 1 H), 8.5 (t, 1 H), 8.2-8.0 (m, 2 H), 7.8-7.5 (m, 6 H), 4.6 (d, 2 H), 2.4 ppm (s, 3 H).

30 I.1.1.d) Preparation of 4-bromo-3-chloro-N-[(quinolin-4-yl)methyl]benzene-sulfonamide (R¹ = Cl)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.8 (m, 1 H), 8.6 (t, 1 H), 8.1-7.6 (m, 8 H), 4.6 ppm (d, 2 H).

5 I.1.2 Preparation of bromosulfonamides (II.B*)



10 I.1.2.a Preparation of 4-bromo-2-fluoro-N[(quinolin-4-yl)methyl]-benzenesulfonamide (R¹ = F)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-THF) δ = 8.6 (m, 1 H), 8.1 (m, 1 H), 8.0 (m, 1 H), 7.6-7.4 (m, 5 H), 7.2 (m, 2 H), 4.5 (d, 2 H).

15 I.1.2.b Preparation of 4-bromo-2-methyl-N[(quinolin-4-yl)methyl]-benzenesulfonamide (R¹ = CH₃)

20 This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) δ = 8.8 (m, 1 H), 8.6 (m, 1 H), 8.1-8.0 (m, 2 H), 7.8-7.4 (m, 6 H), 7.2 (m, 2 H), 4.5 (d, 2 H), 2.5 (s, 3H).

25 I.1.2.c Preparation of 4-bromo-2-trifluoromethoxy-N[(quinolin-4-yl)methyl]-benzenesulfonamide (R¹ = OCF₃)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 MHz, d₆-DMSO) δ = 8.8 (m, 1 H), 8.1-8.0 (m, 2 H), 7.8-7.4 (m, 7 H), 7.2 (m, 2 H), 4.5 (d, 2 H).

30 I.1.2.d Preparation of 4-bromo-2-chloro-N[(quinolin-4-yl)methyl]benzenesulfonamide (R¹ = Cl)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 Mhz, d₆-DMSO) δ = 8.8 (br, 2 H), 8.1-7.9 (m, 2 H), 7.8-7.4 (m, 6 H), 7.2 (m, 2 H), 4.6 (d, 2 H).

- 5 I.1.2.e) Preparation of 4-bromo-2-trifluoromethyl-N[(quinolin-4-yl)methyl]-benzenesulfonamide (R¹ = CF₃)

This compound has been prepared using a method in analogy to the method described under 1.1.1.a). ¹H-NMR (400 Mhz, d₆-DMSO) δ = 8.8 (m, 2 H), 8.2-7.6 (m, 5 H), 7.7 (m, 1 H), 7.6 (m, 1 H), 7.4 (m, 1 H), 4.5 (d, 2 H).

I.2 General procedure for the preparation of compounds (I)

A mixture of a suitable sulfonamide of general formula (II) (0.48 mmol) as described above, Cs₂CO₃ (200 mg), polystyrene-triphenylphosphine-Pd (400 mg, Argonaut) and boronic acid (0.6 mmol) in tetrahydrofuran (3 ml) and water (0.5 ml) was reacted at 75°C. After 20 h the mixture was cooled to ambient temperature and treated with Polystyrene-diethanolamine (100 mg, Novabiochem) for 6 h. The immobilized reactants were filtered off and rinsed with tetrahydrofuran (10 ml). The filtrate was collected and the volatiles were removed in vacuo. The residue was subjected to column chromatography (SiO₂, cyclohexane/ethyl acetate).

Analytical data of representative compounds are given in the table C and in the table D.

- 25 According to the procedure described above compounds of formula (I.B) listed in table C have been prepared.

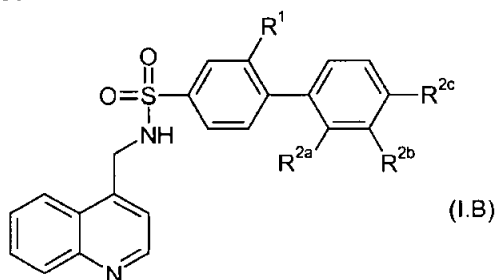


Table C

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B1	CH ₃	Cl	H	Cl	456.9	3.20
B2	CH ₃	H	CH ₃	H	402.5	2.91

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B3	CH ₃	H	H	CF ₃	457.4	3.13
B4	CH ₃	H	F	H	406.5	2.77
B5	CH ₃	Cl	H	H	422.9	2.86
B6	CH ₃	F	H	H	406.5	2.68
B7	CH ₃	H	H	OCF ₃	473.4	3.21
B8	Cl	H	F	H	426.9	2.81
B9	F	Cl	H	Cl	461.3	3.08
B10	F	H	CH ₃	H	406.5	2.88
B11	F	H	H	CF ₃	460.4	3.07
B12	F	H	F	H	410.4	2.76
B13	F	F	H	H	410.4	2.70
B14	F	H	H	OCF ₃	476.4	3.15
B15	CF ₃	H	CH ₃	H	456.5	3.06
B16	CF ₃	H	H	CF ₃	510.5	3.23
B17	CF ₃	H	F	H	460.5	2.96
B18	CF ₃	H	H	OCF ₃	526.5	3.32
B19	CF ₃	H	H	CN	467.5	2.76
B20	CF ₃	H	H	O-CF=CF ₂	538.5	3.36
B21	Cl	CF ₃	H	CF ₃	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.2 m, 8.1 m, 8.0 m, 7.9 m, 7.8-7.7 m, 7.6 m, 7.4 m, 7.2 m, 4.8 d
B22	Cl	Cl	H	Cl	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.1 m, 8.1 m, 7.9 m, 7.8 m, 7.6 m, 7.5 m, 7.4 m, 7.2 m, 7.1 m, 5.2 t, 4.8 d
B23	Cl	Cl	H	CF ₃	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.1 m, 8.1 m, 7.9 m, 7.8 m, 7.6 m, 7.5 m, 7.4 m, 7.2 m, 7.1 m, 5.2 t, 4.8 d
B24	Cl	H	H	CF ₃	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.2 m, 8.0 m, 7.8-7.6 m, 7.5 m,

117

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
						7.4 m, 7.3 m, 7.2 m, 5.2 t, 4.8 d
B25	Cl	H	H	OCH ₃	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.2 m, 7.9 m, 7.9-7.6 m; 7.3 m, 7.1 m, 7.0 m, 5.2 t, 4.8 d
B26	Cl	F	H	H	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.2 m, 7.9 m, 7.7 m, 7.6 m, 7.5-7.1 m, 5.2 t, 4.8 d
B27	Cl	CH ₃	H	OCH ₃	n.d. ^{c)}	8.8 m, 8.2 m, 8.0 m, 7.7 m, 7.6 m, 7.3 m, 7.2 m, 7.0 m, 6.8 m, 5.2 t, 4.8 d
B28	CH ₃	H	Cl	H	422.9	2.94
B29	CH ₃	F	H	Br	485.4	3.04
B30	CH ₃	H	H	CN	414.0	2.6
B31	CH ₃	F	H	Cl	440.9	2.97
B32	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490.9	3.19
B33	CH ₃	H	CF ₃	Cl	490.9	3.23
B34	CH ₃	F	H	OCH ₃	436.5	2.34
B35	Cl	H	Cl	H	443.4	3.00
B36	Cl	H	H	CN	433.9	2.63
B37	Cl	F	H	Cl	461.3	3.03
B38	Cl	H	CF ₃	Cl	511.3	3.31
B39	Cl	F	H	OCH ₃	456.9	2.52
B40	F	H	Cl	H	426.9	2.94
B41	F	H	H	CN	417.5	2.55
B42	F	F	H	Cl	444.9	2.97
B43	F	Cl	H	CF ₃	494.9	3.19
B44	F	H	CF ₃	Cl	494.9	3.23
B45	F	F	H	OCH ₃	440.5	2.41
B46	CH ₃	H	H	O-CF=CF ₂	484.5	3.22

118

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B47	Cl	H	H	O-CF=CF ₂	504.9	3.26
B48	F	H	H	O-CF=CF ₂	488.5	3.20
B49	Cl	F	H	Br	5058	3.11
B50	CF ₃	H	Cl	H	476.9	3.13
B51	CF ₃	F	H	H	460.4	2.88
B52	CF ₃	F	H	Cl	494.9	3.15
B53	CF ₃	H	CF ₃	Cl	544.9	3.40

a) retention time for the method described above

b) δ [ppm] , (CDCl₃,400 MHz)

c) not determined

5 According to the procedure described above compounds of formula (I.B*) listed in table D have been prepared.

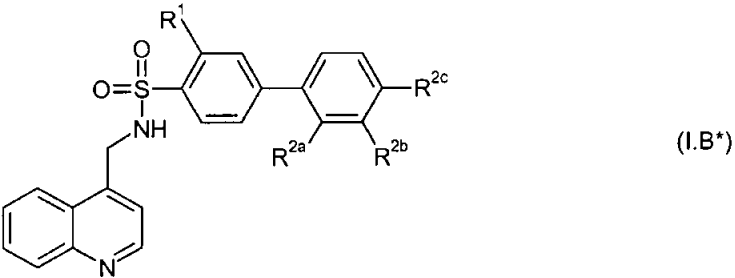


Table D

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B54	OCF ₃	H	H	Cl	492.9	3.16
B55	CF ₃	H	H	Cl	476.9	3.1
B56	CH ₃	H	H	Cl	422.9	2.93
B57	F	H	H	Cl	426.9	2.86
B58	OCF ₃	H	H	CF ₃	526.9	3.25
B59	CF ₃	H	H	CF ₃	510.5	3.21
B60	CH ₃	H	H	CF ₃	456.6	3.06
B61	Cl	H	H	CF ₃	476.9	3.04

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B62	F	H	H	CF ₃	460.4	2.96
B63	CF ₃	H	H	CN	467.5	2.70
B64	CH ₃	H	H	CN	413.2	2.52
B65	Cl	H	H	CN	433.9	2.48
B66	OCF ₃	H	H	OCF ₃	542.5	3.31
B67	CF ₃	H	H	OCF ₃	526.5	3.27
B68	CH ₃	H	H	OCF ₃	472.5	3.12
B69	Cl	H	H	OCF ₃	492.9	3.09
B70	F	H	H	OCF ₃	476.4	3.04
B71	OCF ₃	Cl	H	Cl	527.3	n.d. ^{c)}
B72	CF ₃	Cl	H	Cl	511.3	n.d. ^{c)}
B73	CH ₃	Cl	H	Cl	457.4	n.d. ^{c)}
B74	Cl	Cl	H	Cl	477.8	n.d. ^{c)}
B75	F	Cl	H	Cl	461.3	n.d. ^{c)}
B76	OCF ₃	Cl	H	Cl	594.5	n.d. ^{c)}
B77	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	578.5	n.d. ^{c)}
B78	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	524.5	3.33
B79	Cl	CF ₃	H	CF ₃	544.9	n.d. ^{c)}
B80	F	CF ₃	H	CF ₃	528.4	n.d. ^{c)}
B81	OCF ₃	Cl	H	CF ₃	560.9	3.52
B82	CF ₃	Cl	H	CF ₃	544.9	n.d. ^{c)}
B83	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490.9	n.d. ^{c)}
B84	Cl	Cl	H	CF ₃	511.3	3.27
B85	F	Cl	H	CF ₃	494.9	3.24
B86	OCF ₃	CF ₃	H	H	526.4	n.d. ^{c)}
B87	CF ₃	CF ₃	H	H	510.5	3.14
B88	CH ₃	CF ₃	H	H	456.5	3.04
B89	Cl	CF ₃	H	H	476.9	n.d. ^{c)}

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B90	F	CF ₃	H	H	460.4	2.95
B91	OCF ₃	Cl	H	H	492.9	3.16
B92	CF ₃	Cl	H	H	476.9	3.08
B93	CH ₃	Cl	H	H	422.9	n.d. ^{c)}
B94	Cl	Cl	H	H	443.4	n.d. ^{c)}
B95	F	Cl	H	H	426.9	2.88
B96	OCF ₃	CF ₃	H	Cl	560.9	3.44
B97	CF ₃	CF ₃	H	Cl	544.9	3.38
B98	CH ₃	CF ₃	H	Cl	490.9	3.3
B99	Cl	CF ₃	H	Cl	511.3	3.3
B100	F	CF ₃	H	Cl	494.9	3.21
B101	OCF ₃	F	H	F	494.9	3.1
B102	CF ₃	F	H	F	478.4	3.05
B103	CH ₃	F	H	F	424.5	2.85
B104	Cl	F	H	F	444.9	2.83
B105	F	F	H	F	428.4	n.d. ^{c)}
B106	OCF ₃	F	H	H	476.4	3.06
B107	CF ₃	F	H	H	460.4	3.01
B108	CH ₃	F	H	H	406.5	n.d. ^{c)}
B109	Cl	F	H	H	426.9	2.74
B110	F	F	H	H	410.4	2.74
B111	OCF ₃	H	H	CN	483.5	2.78
B112	CH ₃	H	H	CN	413.2	2.56
B113	OCF ₃	Cl	H	Cl	527.3	n.d. ^{c)}
B114	CF ₃	Cl	H	Cl	511.3	3.34
B115	CH ₃	Cl	H	Cl	457.4	3.17
B116	Cl	Cl	H	Cl	477.8	3.18
B117	F	Cl	H	Cl	461.3	3.10

122

75

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} or ¹ H-NMR ^{b)}
B118	CF ₃	Cl	H	CF ₃	544.9	n.d. ^{c)}
B119	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490.93	n.d. ^{c)}
B120	Cl	CF ₃	H	H	476.9	2.96
B121	CH ₃	Cl	H	H	422.9	2.88
B122	Cl	Cl	H	H	443.4	2.88
B123	F	F	H	F	428.4	2.73
B124	CH ₃	F	H	H	406.5	2.75

a) retention time for the method described above

b) δ [ppm], (CDCl₃, 400 MHz)

c) not determined

5 In analogous way comparative examples of formula (I.B) listed in table E have been prepared.

Table E

Compound	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	HPLC, ¹ H-NMR
C1	H	H	H	OCF ₃	n.d. ^{c)}
C2	H	H	H	CF ₃	n.d. ^{c)}

c) not determined

10 II. Assessment of the biological activity

II.1 Activity against cotton aphid (*aphis gossypii*), mixed life stages

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic® surfactant.

15 Cotton plants at the cotyledon stage were infested prior to treatment by placing a heavily infested leaf from the main aphid colony on top of each cotyledon. The aphids were allowed to transfer overnight and the host leaf was removed. The infested cotyledons were then dipped and agitated in the test solution for 3 seconds and
20 allowed to dry in a fume hood. Test plants were maintained under fluorescent lighting in a 24 h photoperiod at 25°C and 20-40% relative humidity. Aphid mortality on the treated plants, relative to mortality on untreated check plants, was determined after 5 days.

922

In this test, the compounds B1, B3, B7, B12, B14, B27, B45, B56, B59, B85, B90, B115, B117 and B123 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

5 II.2 Activity against green peach aphid (*Myzus persicae*)

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

10 Pepper plants in the 2nd leaf-pair stage (variety California Wonder) were infested with approximately 40 laboratory-reared aphids by placing infested leaf sections on top of the test plants. The leaf sections were removed after 24 hr. The leaves of the intact plants were dipped into gradient solutions of the test compound and allowed to dry. Test plants were maintained under fluorescent light (24 hour photoperiod) at about 25°C and 20-40% relative humidity. Aphid mortality on the treated plants, relative to 15 mortality on check plants, was determined after 5 days.

In this test, the compounds B1, B3, B9, B14, B27, B31, B56 and B85 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

20 II.3 Activity against southern armyworm (*spodoptera eridania*), 2nd-3rd instar larvae

The active compounds were formulated as a 10.000 ppm solution in a mixture of 35% acetone and water, which was diluted with water, if needed.

25 Sieva lima bean foliage, expanded to the first true leaves, were dipped and agitated in the test solution for 3 seconds and then allowed to dry in a fume hood. The treated plant was then placed in 25-cm plastic perforated zip enclosure bags, ten 2nd-instar larvae were added, and the bags sealed. After 4 days, observations were made of mortality, plant feeding, and of any interference with larval growth.

30 In this test, the compounds B1, B3, B8, B10, B12, B26, B31, B32, B45, B60, B84, B90, B98 and B103 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

 II.4 Activity against Colorado potato beetle (*Leptinotarsa decemlineata*)

35 Potato plants were utilized for bioassays. Excised plant leaves were dipped into 1:1 acetone/water dilutions of the active compounds. After the leaves had dried, they were individually placed onto water-moistened filter paper on the bottoms of Petri dishes. Each dish was infested with 5 – 7 larvae and covered with a lid. Each treatment dilution was replicated 4 times. Test dishes were held at approximately 27°C

and 60% humidity. Numbers of live and morbid larvae were assessed in each dish at 5 days after treatment application, and percent mortality was calculated.

In this test, the compounds B2, B16, B32, B68, B84, B121 and B122 at 2500 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

5

II.5 Activity against diamond back moth (*plutella xylostella*)

The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 0.1 % (vol/vol) Alkamuls EL 620 surfactant. A 6 cm leaf disk of cabbage leaves was dipped in the test solution for 3 seconds and allowed to air dry in a Petri plate lined with moist filter paper. The leaf disk was inoculated with 10 third instar larvae and kept at 25-27°C and 50-60% humidity for 3 days. Mortality was assessed after 72 h of treatment.

10

In this test, the compounds B1, B3, B12, B23, B27 and B115 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

15

II.6 Activity against two-spotted spider mite (*tetranychus urticae*, OP-resistant strain)

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

20

Sieva lima bean plants with primary leaves expanded to 7-12 cm are infested by placing on each a small piece from an infested leaf (with about 100 mites) taken from the main colony. This is done at about 2 hours before treatment to allow the mites to move over to the test plant to lay eggs. The piece of leaf used to transfer the mites is removed. The newly-infested plants are dipped in the test solution and allowed to dry. The test plants are kept under fluorescent light (24 hour photoperiod) at about 25°C and 20-40% relative humidity. After 5 days, one leaf is removed and mortality counts are made.

25

In this test, the compounds B1 and B7 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

30

II.7 Activity against brown planthopper (*nilaparvata lugens*)

The active compounds were formulated as a 20:80 acetone:water solution. Surfactant (Alkamuls EL 620) was added at the rate of 0.1% (vol/vol).

35

Potted rice plants of 3-4 weeks of age are sprayed with 10 ml of the test solution using air driven hand atomizer (Devillbis atomizer) at 1.7 bar. The treated plants are allowed to dry for about 1 hour and covered with Mylar cages. The plants are inoculated with 10 adults of the specie (5 male and 5 females) and kept at 25-27°C and 50-60% humidity for 3 days. Mortality is assed after 24, 48 and 72 hours after

40

124

78

treatment. Dead insects are usually found in the water surface. Each treatment is replicated once.

In this test, compounds B16 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

5

II.8 Activity against Boll weevil (*Anthonomus grandis*)

The active compounds were formulated in 1:3 DMSO:water. 10 to 15 eggs were placed into microtiterplates filled with 2% agar-agar in water and 300 ppm formaline.

10 The eggs were sprayed with 20 µl of the test solution, the plates were sealed with pierced foils and kept at 24-26°C and 75-85% humidity with a day/night cycle for 3 to 5 days. Mortality was assessed on the basis of the remaining unhatched eggs or larvae on the agar surface and/or quantity and depth of the digging channels caused by the hatched larvae. Tests were replicated 2 times.

15 In this test, compounds B68, B116 and B117 at 2500 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

II.9 Activity against Mediterranean fruitfly (*Ceratitis capitata*)

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

25 times.

In this test, compounds B85 and B98 at 2500 ppm showed at least 75% mortality.

II.10 Activity against Tobacco budworm (*Heliothis virescens*)

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

35 In this test, compounds at 2500 ppm showed at least 75% mortality.

II.11 Activity against Vetch aphid (*Megoura viciae*)

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

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

- 5 In this test, compound at 2500 ppm showed at least 75% mortality compared to 0% mortality of untreated controls.

II.12 Activity against tobacco budworm (*Heliothis virescens*)

- 10 Two-leaf cotton plants are utilized for bioassays. Excised plant leaves are dipped into 1:1 acetone/water dilutions of the active compounds. After the leaves have dried, they are individually placed onto water-moistened filter paper on the bottoms of Petri dishes. Each dish is infested with 5 – 7 larvae and covered with a lid. Each treatment dilution is replicated 4 times. Test dishes are held at approximately 27°C and 60%
15 humidity. Numbers of live and morbid larvae are assessed in each dish at 5 days after treatment application, and percent mortality is calculated.

II.13 Activity against silverleaf whitefly (*Bemisia argentifolii*)

- 20 The active compounds were formulated in 50:50 acetone:water and 100 ppm Kinetic™ surfactant.
- Selected cotton plants were grown to the cotyledon state (one plant per pot). The cotyledons were dipped into the test solution to provide complete coverage of the foliage and placed in a well-vented area to dry. Each pot with treated seedling was
25 placed in a plastic cup and 10 to 12 whitefly adults (approximately 3-5 day old) were introduced. The insects were collected using an aspirator and an 0.6 cm, non-toxic Tygon tubing connected to a barrier pipette tip. The tip, containing the collected insects, was then gently inserted into the soil containing the treated plant, allowing insects to crawl out of the tip to reach the foliage for feeding. The cups were covered
30 with a re-usable screened lid (150 micron mesh polyester screen PeCap from Tetko Inc). Test plants were maintained in the holding room at about 25 °C and 20-40% relative humidity for 3 days avoiding direct exposure to the fluorescent light (24 hour photoperiod) to prevent trapping of heat inside the cup. Mortality was assessed 3 days after treatment of the plants.
- 35 In this test, the compounds B56, B84, B85, B115 and B117 at 300 ppm showed a mortality of at least 70% in comparison with untreated controls.

II.14 Activity against cowpea aphid (*Aphis craccivora*)

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.

- 5 In this test, the compounds at 300 ppm showed a mortality of at least 80% in comparison with untreated controls.

II.15 Activity against yellowfever mosquitos (*Aedes aegypti*)

- 10 The test compound (1 vol% in acetone) was applied to water in glass dishes containing 4th instar *aedes aegypti*. The test dishes were maintained at about 25°C and observed daily for mortality. Each test was replicated in 3 test dishes.

In this test, the compounds at 300 ppm after 6 days showed over 90% mortality compared to untreated controls.

15

II.16 Activity against eastern subterranean termites (*Reticulitermes flavipes*)

- 20 Toxicant treatments (1.0% test compound w/w) are applied to 4.25 cm (diam.) filter papers in acetone solution. Treatment levels (% test compound) are calculated on basis of a mean weight per filter paper of 106.5 mg. Treatment solutions are adjusted to provide the quantity of toxicant (mg) required per paper in 213 ml of acetone. Acetone only is applied for untreated controls. Treated papers are vented to evaporate the acetone, moistened with 0.25 ml water, and enclosed in 50x9 mm Petri dishes with tight-fit lids.

- 25 Termite bioassays are conducted in 100x15 mm Petri dishes with 10 g fine sand spread in a thin layer over the bottom of each dish. An additional 2.5 g sand is piled against the side of each dish. The sand is moistened with 2.8 ml water applied to the piled sand. Water is added to dishes as needed over the course of the bioassays to maintain high moisture content. Bioassays are done with one treated filter (inside enclosure) and 30 termite workers per test dish. Each treatment level is replicated in 2 test dishes. Test dishes are maintained at about 25°C and 85% humidity for 12 days and observed daily for mortality.

30

II.17 Activity against orchid thrips (*dichromothrips corbetti*)

35

Dichromothrips corbetti adults used for bioassay are obtained from a colony maintained continuously under laboratory conditions. For testing purposes, the test compound is diluted to a concentration of 500 ppm (wt compound: vol diluent) in a 1:1 mixture of acetone:water, plus 0.01% Kinetic surfactant.

Thrips potency of each compound is evaluated by using a floral-immersion technique. Plastic petri dishes are used as test arenas. All petals of individual, intact orchid flowers are dipped into treatment solution for approximately 3 seconds and allowed to dry for 2 hours. Treated flowers are placed into individual petri dishes along with 10 - 15 adult thrips. The petri dishes are then covered with lids. All test arenas are held under continuous light and a temperature of about 28°C for duration of the assay. After 4 days, the numbers of live thrips are counted on each flower, and along inner walls of each petri dish. The level of thrips mortality is extrapolated from pre-treatment thrips numbers.

10

II.18 Activity against Argentine ant, harvester ant, acrobat ant, carpenter ant, fire ant, house fly, stable fly, flesh fly, yellowfever mosquito, house mosquito, malaria mosquito, German cockroach, cat flea, and brown dog tick via glass contact

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

15

20 II.19 Activity against flea beetle (*Phyllotreta striolata*)

Flea beetle (*Phyllotreta striolata*) adults used for bioassay are obtained from a colony maintained continuously under laboratory conditions. For testing purposes, the test compound is diluted to a concentration of 300 ppm (wt compound: vol diluent) in a 1:1 mixture of acetone:water, plus 0.1% EL 620 surfactant.

25

Activity of each compound is evaluated using a lip -dip technique. Glass petri dishes (60 X 15 mm) lined with moist filter paper serves as test arenas. All leaf discs are dipped into treatment solution for approximately 3 seconds and allowed to dry for 2 hours. Each treated leaf disc is placed into individual petri dishes and inoculated with 10 adult beetles. Petri dishes are then covered with lids. All test arenas are held under continuous light and a temperature of about 28°C for duration of the assay. After 3 days, percent mortality is observed.

30

In this test, the compounds B85 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

35

II.20 Activity against rice green leaf hoppers (*Nephotettix virescens*)

Leaf hopper adults used for bioassay are obtained from a colony maintained continuously under laboratory conditions. For testing purposes, the test compound is

diluted in 300 ppm (wt compound:vol diluent) in a 1:1 mixture of acetone:water, plus 0.1% EL 620 surfactant.

Hopper activity is evaluated using the foliar spray technique. Potted rice plants (2-3 week old, Variety TN-1) are cleaned and dried prior to application. All plants are treated inside the fume hood using DeVilbiss atomizer at 25 psi with a spray volume of 5 ml /plant. To ensure uniform spray distribution, plants were placed in a rotating flat form inside the fume hood. Treated plants are then placed inside the holding room and allowed to dry for 2 hours. Each plant are caged using Mylar cages (4 inches diameter X 19 inches in height) and inoculated with 10 adults hoppers. All test plants are held under continuous light and a temperature of about 28°C for duration of the assay. Percent mortality is observed after 72 hours.

In this test, the compounds B85 at 300 ppm showed a mortality of at least 75% in comparison with untreated controls.

III. Comparative data for the biological activity

Comparative data for the biological activity of compounds (I) according to the present invention is compiled below in table F.

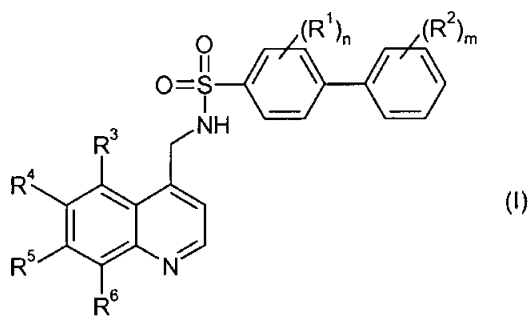
Table F

Assessment method	compound	mortality [%]		
		at 300 ppm	at 100 ppm	at 10 ppm
green peach aphid (II.2)	B14	90	90	n.d.
	C1	60	0	n.d.
	B24	100	90	90
	C2	100	60	0
diamond back moth (II.5)	B24	100	n.d.	n.d.
	C2	0	n.d.	n.d.
brown plant hopper (II.7)	B16	100	n.d.	n.d.
	C2	0	n.d.	n.d.

Those results clearly demonstrate the enhanced biological activity of compounds (I) according to the present invention.

We claim:

1. Quinoline compounds of formula (I)



wherein

R^1 , R^2 are each independently halogen, hydroxy, cyano, amino, nitro, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkynyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkynyloxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_4 -alkoxy, $C(OH)(CF_3)_2$, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_2 - C_6 -haloalkenyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_2 - C_6 -haloalkenyloxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -haloalkylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfonyl, $C(R^a)=O$ or $C(R^a)=NOR^b$;

R^a is hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl;

R^b is hydrogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkynyl, C_1 - C_4 -haloalkyl, or C_2 - C_4 -haloalkenyl;

R^3 , R^4 , R^5 , R^6 are each independently hydrogen, halogen, cyano, amino, nitro, hydroxy, C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_1 - C_6 -haloalkyl, C_1 - C_6 -haloalkoxy, C_1 - C_6 -alkylthio, C_1 - C_6 -haloalkylthio, C_1 - C_6 -alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -haloalkylsulfonyl, or $C(=O)OR^c$;

R^c is hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, or C_2 - C_6 -alkynyl;

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

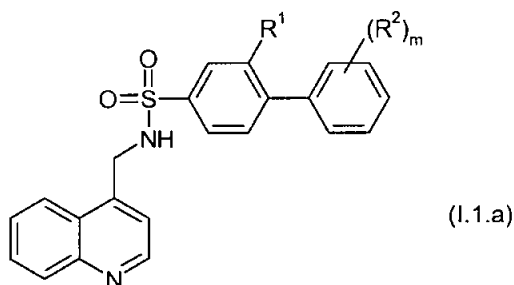
n is 1 or 2;

and the N-oxides and salts thereof.

2. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 1, wherein n is 1.

3. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 2, wherein the substituent R¹ is attached to the phenyl group in meta position relative to the sulfonamid moiety.
- 5 4. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 2, wherein the substituent R¹ is attached to the phenyl group in ortho position relative to the sulfonamid moiety.
- 10 5. Quinoline compounds of formula (I) according to any of the preceding claims, wherein R¹ is selected independently from the group consisting of halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl or C₁-C₆-haloalkylsulfonyl.
- 15 6. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 5, wherein R¹ is selected independently from the group consisting of F, Cl, Br, CH₃, CHF₂, CF₃, OCH₃, OCHF₂ and OCF₃.
- 20 7. Quinoline compounds of formula (I) according to any of the preceding claims, wherein m is 1, 2 or 3.
- 25 8. Quinoline compounds of formula (I) according to any of the preceding claims, wherein R² is selected independently from the group consisting of halogen, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-haloalkenyl, C₂-C₆-alkynyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkoxy, C₂-C₆-alkenyloxy, C₂-C₆-haloalkenyloxy, C₂-C₆-alkynyloxy, C₁-C₆-alkylthio, C₁-C₆-haloalkylthio, C₁-C₆-alkylsulfonyl or C₁-C₆-haloalkylsulfonyl.
- 30 9. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 8, wherein R² is selected independently from the group consisting of F, Cl, Br, CH₃, CHF₂, CF₃, OCH₃, OCHF₂ and OCF₃.
- 35 10. Quinoline compounds of formula (I) according to any of the preceding claims, wherein R³, R⁴, R⁵, R⁶ are each independently selected from the group consisting of hydrogen, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-haloalkoxy, or C₁-C₆-alkylthio.
- 40 11. Quinoline compounds of formula (I) according to claim 10, wherein R³, R⁴, R⁵, R⁶ are each hydrogen.

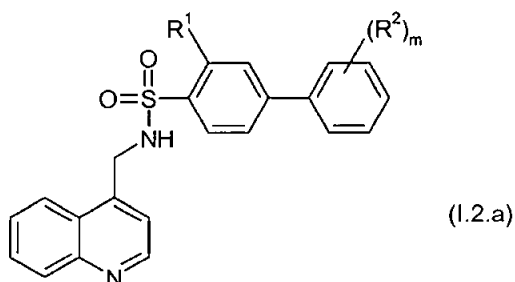
12. Quinoline compounds of formula (I), referred to as quinoline compounds of formula (I.1.a)



5 wherein

R¹, R² and m have the meanings given in any of the preceding claims.

13. Quinoline compounds of formula (I), referred to as quinoline compounds of formula (I.2.a)

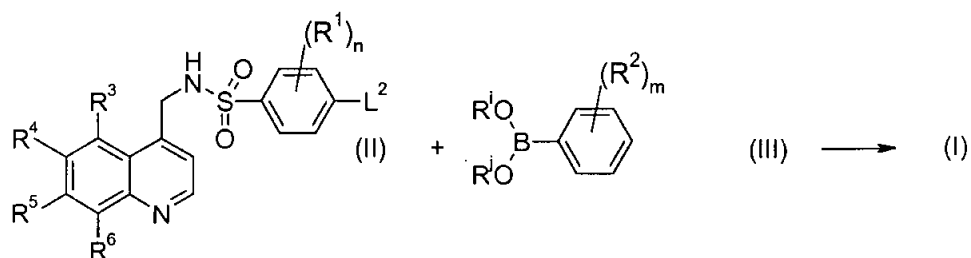


wherein

15 R¹, R² and m have the meanings given in any of the preceding claims.

14. A process for the preparation of quinoline compounds of formula (I) as defined in claims 1 to 13, comprising:

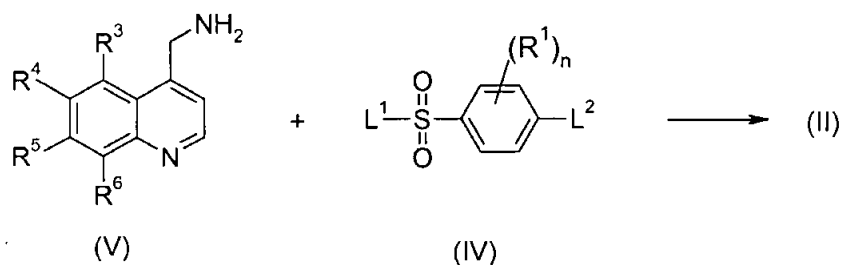
20 reacting a compound of formula (II) with a boronic acid derivative of the formula (III) in the presence of a base and a transition metal catalyst to give quinoline compounds of formula (I),



wherein the variables in the above compounds (II) and (III) have the meaning as defined above for quinoline compounds of formula (I), R^1 and R^i are each independently hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl, or R^i and R^i together form an 1,2-ethylene or 1,2-propylene moiety the carbon atoms of which may be unsubstituted or may all or in part be substituted by methyl groups, and L^2 is a suitable leaving group.

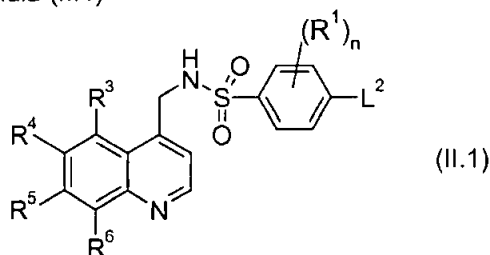
15. A process for the preparation of quinoline compounds of formula (I) according to claim 14, comprising additionally:

reacting a sulfonylchloride (IV) with a quinoline (V) in presence of a base to yield a compound of the formula (II),



wherein the variables in the above compounds (IV) and (V) have the meaning as defined above for quinoline compounds of formula (I), and L^1 and L^2 are suitable leaving groups.

16. A compound of formula (II.1)



wherein

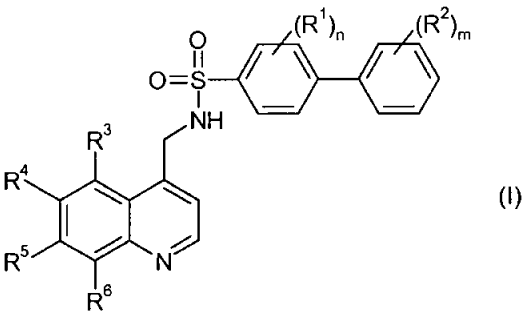
133

L² is chlorine, bromine or iodine and n, R¹, R³, R⁴, R⁵ and R⁶ have the meanings given in any of the claims 1 to 13.

- 5 17. Use of compounds of formula (I) and their N-oxides or salts as defined in any of claims 1 to 13 for combating arthropod pests or nematodes.
18. Compositions comprising at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or a salt thereof as defined in claims 1 to 13 and a carrier material.
- 10 19. A method for controlling of arthropod pests or nematodes, which comprises contacting the insect, arachnid or nematode or their food supply, habitat, breeding ground or their locus with at least one compound of the formulae (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof as defined in claims 1 to 13.
- 15 20. A method for protecting growing plants from attack or infestation by arthropod pests or nematodes, which comprises applying to the plants, or to the soil or water in which they are growing, at least one compound of the formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof as defined in claims 1 to 13.
- 20 21. The method as claimed in claims 19 or 20, wherein the at least one compound of formula (I) and/or the N-oxide or an agriculturally acceptable salt is applied in an amount of from 5 g/ha to 2000 g/ha, calculated as the compound of formula (I).
- 25 22. A method for protecting of seed comprising contacting the seeds with at least one compound of formulae (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof as defined in claims 1 to 13 or a composition containing at least one of these compounds in pesticidally effective amounts.
- 30 23. A method as claimed in claim 22, wherein the at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof is applied in an amount of from 0.1 g to 10 kg per 100 kg of seeds, calculated as the compound of formula (I).
- 35 24. Seed, comprising at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or an agriculturally acceptable salt thereof as defined in claims 1 to 13.

25. A method for treating, controlling, preventing or protecting animals against infestation or infection by parasites which comprises administering or applying to the animals a parasitically effective amount of at least one compound of formula (I) and/or a N-oxide or a veterinarily acceptable salt thereof as defined in claims 1 to 13.
26. Synergistic pesticidal mixtures, comprising a compound of formula (I) and/or a N-oxide or a salt thereof as defined in claims 1 to 13 and a pesticide selected from the organo(thio)phosphates, carbamates, pyrethroids, growth regulators, neonicotinoids, nicotinic receptor agonists/antagonists compounds, GABA antagonist compounds, macrocyclic lactone insecticides, METI I, II and III compounds, oxidative phosphorylation inhibitor compounds, moulting disruptor compounds, mixed function oxidase inhibitor compounds, sodium channel blocker compounds, benclonthiaz, bifentazate, cartap, flonicamid, pyridalyl, pymetrozine, sulfur, thiocyclam, flubendiamide, cyanopyrafen, flupyrzofos, cyflumetofen, amidoflumet, anthranilamides and N-R'-2,2-dihalo-1-R''-cyclopropanecarboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)hydrazone or N-R'-2,2-di(R''')-propionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -trifluoro-p-tolyl)-hydrazone, wherein R' is methyl or ethyl, halo is chloro or bromo, R'' is hydrogen or methyl and R''' is methyl or ethyl.

135



COMPUESTOS DE QUINOLINILMETILO

La presente invención se relaciona con compuestos novedosos de (quinolin-4-ilmetil)-amida de ácido bifenil-4-sulfónico y sus N-óxidos, y sus sales y con su uso para combatir plagas de artrópodos y nematodos, y también con composiciones que comprenden tales compuestos como componente activo. La presente invención también se relaciona con un método para controlar plagas de artrópodos o nematodos.

Las plagas animales y en particular los artrópodos y nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados, y atacan estructuras de viviendas de madera y comerciales, que causan gran pérdida económica al suministro de alimentos y a la propiedad. Si bien se conoce gran cantidad de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una creciente necesidad de nuevos agentes para combatir artrópodos y nematodos. Es por lo tanto, un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que tengan una buena actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de diferentes plagas animales, en especial contra la dificultad de controlar insectos, arácnidos y nematodos.

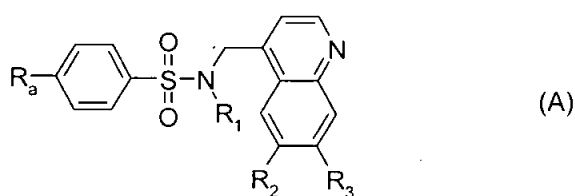
El documento WO 2005/033081 describe derivados fungicidas de 4-piridinilmetilsulfonamida. Estos compuestos pueden llevar un anillo benceno fusionado con un grupo funcional piridina.

El documento WO 2006/097489 (PCT/EP/2006/060753) describe diversas 4-piridilmetilamidas de ácido bifenilsulfónico, en donde el grupo funcional bifenilo

puede llevar sustituyentes en el anillo fenilo del grupo funcional bifenilo en el grupo sulfonamida. Los compuestos se utilizan para combatir plagas de artrópodos y para proteger los materiales contra la infestación y/o la destrucción por dichas plagas.

5

El documento WO 2006/097488 (PCT/EP/2006/060752) describe, inter alia, compuestos de quinolona contra artrópodos de la fórmula (A),



0

en donde R_2 y R_3 son ambos hidrógeno, halógeno, metoxi o trifluorometoxi, R_1 es hidrógeno o metilo y R_a se selecciona de fenilo que puede no ser sustituido o puede llevar un sustituyente seleccionado de cloro, alquilo C_1 - C_4 , metoxi, trifluorometoxi o fenilo.

5

El documento US 60/782429 describe metilsulfonamidas de quinolina específicas que llevan un grupo funcional bifenilo en el grupo sulfonamida donde el grupo funcional fenileno del bifenilo es no sustituido.

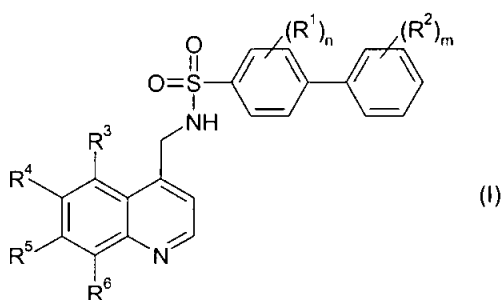
0

Existe una creciente necesidad de proporcionar compuestos que sean de utilidad para combatir artrópodos nocivos tales como insectos y arácnidos. Es deseable que los compuestos tengan una acción mejorada y/o un espectro de acción más amplio contra artrópodos dañinos.

5

Sorprendentemente, se ha encontrado que este objetivo se logra mediante

compuestos de quinolina de la fórmula (I)



5 donde

R^1 , R^2 son cada uno, independientemente, halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -
10 alcoxi C_1-C_4 , cicloalquil C_3-C_7 -alcoxi C_1-C_4 , $C(OH)(CF_3)_2$, haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , $C(R^a)=O$ o $C(R^a)=NOR^b$;

15 R^a es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

R^b es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o haloalquenilo C_2-C_4 ;

20 R^3 , R^4 , R^5 , R^6 son cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, amino, nitro, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 o $C(=O)OR^c$;

R^c es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ o alquinilo C₂-C₆;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n es 1 ó 2;

5 y sus N-óxidos o sus sales.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se relaciona con compuestos de quinolina de la fórmula general (I) y sus N-óxidos y sus sales.

0 Los compuestos de la presente invención también son útiles para combatir plagas de artrópodos y plagas de nematodos. Por lo tanto, la presente invención también se relaciona con el uso de los compuestos de quinolina de la fórmula general (I) y sus N-óxidos y sales para combatir plagas de artrópodos o plagas de nematodos.

5

La presente invención se relaciona adicionalmente con un método para controlar plagas de artrópodos o nematodos, que comprende poner en contacto el insecto, arácnido o nematodo o su suministro de alimento, hábitat, lugar de incubación o locus con por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o su N-óxido
0 o su sal. Por otra parte, la presente invención se relaciona con un método para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación de plagas de artrópodos o nematodos, que comprende la aplicación a las plantas o al suelo o al agua en las que crecen, por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícolamente aceptables. En una modalidad
5 preferida de los métodos antes mencionados, por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o sales o una composición que los comprende se aplica en una cantidad de 5 g/ha a 2000 g/ha, calculado como el compuesto de

la fórmula (I).

Adicionalmente, la presente invención se relaciona con un método para proteger semillas con por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícolas aceptables o una composición que contiene por lo menos uno de estos compuestos (I) en cantidades pesticidamente efectivas. Preferiblemente, por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícolas aceptables o una composición que comprende por lo menos uno de estos compuestos se aplica en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por cada 100 kg de semillas.

De acuerdo con lo anterior, un objetivo adicional de la presente invención es la semilla, que comprende por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícolas aceptables, preferiblemente en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por cada 100 kg de semillas, calculada como compuesto de la fórmula (I).

La presente invención también se relaciona con un método para tratar, controlar, evitar o proteger a animales contra la infestación o la infección por parásitos que comprende administrar o aplicar a los animales una cantidad parasiticidamente efectiva de por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales veterinariamente aceptables.

La presente invención también se relaciona con mezclas pesticidas sinérgicas, que comprenden un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales y un pesticida seleccionado de organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento, neonicotinoides, compuestos

141

agonistas/antagonistas del receptor nicotínico, compuestos antagonistas de GABA, insecticidas macrocíclicos de lactona, compuestos de METI I, II y III, compuestos inhibidores de fosforilación oxidativa, compuestos interruptores de la muda, compuestos inhibidores de la oxidasa de función mixta, compuestos
5 bloqueadores del canal de sodio, bencloflaz, bifenazato, cartap, flonicamida, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, flubendiamida, cianopirafeno, flupirazofos, ciflumetofeno, amidoflumet, antranilamidas y N-R'-2,2-dihalo-1-R"-ciclopropancarboxamid-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')-propionamid-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, donde R' es
0 metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo.

Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula (I) y sus N-óxidos pueden tener uno o varios centros de quiralidad, en cuyo caso están
5 presentes como enantiómeros puros o diastereómeros puros o como mezclas enantioméricas o diastereoméricas. Ambos, los enantiómeros o diastereómeros puros y sus mezclas son la materia objeto de la presente invención.

Las sales agrícolamente útiles de los compuestos (I) abarcan
0 especialmente las sales de los cationes o las sales de adición de ácidos de esos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efecto adverso sobre la acción pesticida de los compuestos (I). Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los
5 metales transición, preferiblemente manganeso, cobre, cinc y hierro, y también el ion amonio (NH_4^+) que, si se desea, puede llevar uno a cuatro sustituyentes de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ y/o un sustituyente de fenilo o bencilo, preferiblemente

diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, trimetilbencilamonio, además de iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(alquil C₁-C₄)sulfonio, e iones sulfoxonio, preferiblemente tri(alquil C₁-C₄)sulfoxonio.

5 Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato de dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanoicos C₁-C₄, preferiblemente formato, acetato, propionato y butirato. Ellos se pueden formar al
0 hacer reaccionar los compuestos de la fórmula (I) con un ácido del correspondiente anión, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Las sales veterinariamente aceptables de los compuestos de la fórmula (I)
5 abarcan especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácido que son conocidas o aceptadas en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, se forman por compuestos de fórmula I que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo, un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos, y nitratos y sales de ácidos orgánicos por ejemplo,
0 ácido acético, ácido maleico, por ejemplo las sales monoácidas o sales diácidas de ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, por ejemplo las sales monoácidas o sales diácidos de ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfénico, ácido metanosulfónico y ácido succínico.

5

En las definiciones de las variables indicadas anteriormente, se utilizan términos colectivos que en general son representativos de los sustituyentes en

cuestión. El término C_n-C_m indica la cantidad de átomos de carbono posible en cada caso en el sustituyente o grupo funcional sustituyente en cuestión.

El término "halógeno" como se utiliza aquí se relaciona con flúor, cloro,
5 bromo y yodo.

El término "alquilo" como se utiliza aquí se relaciona con un grupo hidrocarburo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-
0 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-
5 metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

El término "haloalquilo" como se utiliza aquí se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos
0 grupos se pueden reemplazar por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo y pentafluoroetilo, 2-fluoropropilo, 3-
5 fluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 2,3-difluoropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-

tricloropropilo, $\text{CH}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{CF}_2\text{-C}_2\text{F}_5$, $\text{CF}(\text{CF}_3)_2$, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo, 1-(clorometil)-2-cloroetilo, 1-(bromometil)-2-bromoetilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-bromobutilo, nonafluorobutilo, 5-fluoro-1-pentilo, 5-cloro-1-pentilo, 5-bromo-1-pentilo, 5-iodo-1-pentilo, 5,5,5-tricloro-1-pentilo, undecafluoropentilo, 6-fluoro-1-hexilo, 6-cloro-1-hexilo, 6-bromo-1-hexilo, 6-iodo-1-hexilo, 6,6,6-tricloro-1-hexilo o dodecafluorohexilo.

De acuerdo con lo anterior "alcoxi" y "alquiltio" tal como se utilizan en la presente se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente, en cualquier posición en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio y n-butiltio.

De modo similar, "alquilsulfinilo" y "alquilsulfonilo" se relaciona con grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de un grupo funcional -S(=O)- o un grupo funcional $\text{-S(=O)}_2\text{-}$, respectivamente, en cualquier posición en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen metilsulfinilo y metilsulfonilo.

De modo similar, "haloalcoxi" y "haloalquiltio" (o haloalquilsulfenilo, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente, en cualquier enlace en el grupo alquilo, en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se pueden reemplazar por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$, tales como clorometoxi,

145

bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 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 y pentafluoroetoxi, también haloalquil C₁-C₂-tio, tales como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoroetiltio y similares.

El término "alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄" como se utiliza aquí se refiere a alcoxi que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde un átomo de hidrógeno del radical alcoxi se reemplaza por un grupo alcoxi C₁-C₄.

5

El término "alquenilo" como se utiliza aquí significa un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene 2 a 6 átomos de carbono y un enlace doble 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-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;

0 El término "alquinilo" como se utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene 2 a 6 átomos de carbono y que contiene por lo menos un enlace triple, tales como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, y similares.

5 De modo similar, "alqueniloxi" y "alquiniloxi" se refieren a grupos alquenilo o alquinilo de cadena recta o ramificada, respectivamente (como se mencionó anteriormente) unidos a través de un átomo de oxígeno, en cualquier carbono del grupo alquenilo, o en cualquier átomo de carbono del grupo alquinilo, por ejemplo, aliloxi o propargiloxi.

0 El término "cicloalquilo" como se utiliza aquí se refiere a anillos de átomos de carbono saturados monocíclicos de 3 a 7 miembros, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, o cicloheptilo.

5 El término "cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₄" como se utiliza aquí se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo

147

cicloalquilo C₃-C₇.

De modo similar, el término "cicloalquil C₃-C₇-alcoxi C₁-C₄" como se utiliza aquí se refiere a alcoxi que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó
5 anteriormente), donde un átomo de hidrógeno del radical alcoxi se reemplaza por un grupo cicloalquilo C₃-C₇.

Respecto al uso pretendido de los compuestos de la fórmula (I), se da particular preferencia a los siguientes significados de los sustituyentes R¹ a R⁶ y
0 las variables n y m, en cada caso por sí mismo o en combinación:

Se da preferencia a compuestos de la fórmula (I), donde R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-
5 C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ o haloalquilsulfonilo C₁-C₆. Se da particular preferencia a compuestos de la fórmula (I), en los que R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, en particular F, Cl, Br; alquilo C₁-C₂, en particular CH₃, haloalquilo C₁-C₂, en especial
0 fluoroalquilo C₁-C₂, tales como CHF₂, CF₃, alcoxi C₁-C₂, en particular OCH₃, y haloalcoxi C₁-C₂, en especial fluoroalcoxi C₁-C₂, tales como OCHF₂ y OCF₃;

Se da preferencia a compuestos de la fórmula (I), en los que m es 1, 2 ó 3;

5 Se da preferencia a compuestos de la fórmula (I), en los que R² se selecciona, de modo independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆,

alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ o haloalquilsulfonilo C₁-C₆. Se da particular preferencia a compuestos de la fórmula (I), en los que R² se selecciona, independientemente, del grupo que consiste de
5 halógeno, en particular F, Cl, Br; alquilo C₁-C₂, en particular CH₃, haloalquilo C₁-C₃, en especial fluoroalquilo C₁-C₃, tales como CHF₂, CF₃ y CF(CF₃)₂; alcoxi C₁-C₂, en particular OCH₃, y haloalcoxi C₁-C₃, en especial fluoroalcoxi C₁-C₃, tales como OCHF₂, OCF₃, OCF(CF₃)₂.

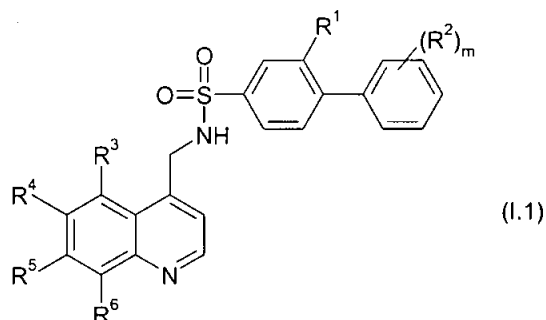
10 Se da preferencia a compuestos de la fórmula (I), en los que R³, R⁴, R⁵, R⁶ se seleccionan cada uno, independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, o alquiltio C₁-C₆.

15 Una modalidad de especial preferencia de la presente invención se relaciona con compuestos de la fórmula (I), donde R³, R⁴, R⁵, R⁶ son cada uno hidrógeno.

Otra modalidad preferida de la presente invención se relaciona con
20 compuestos de la fórmula (I), donde n es 1.

Una modalidad de especial preferencia de la presente invención se relaciona con compuestos de la fórmula (I), donde el sustituyente R¹ se une al grupo fenilo en la posición meta respecto al grupo funcional sulfonamida. Este
25 compuesto también se denomina compuesto de la fórmula (I.1), en donde el grupo funcional fenilo tiene el patrón de sustitución como en el siguiente esquema, y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y m son como se definió anteriormente para los compuestos de

la fórmula (I):



5 Un experto en la técnica entenderá fácilmente que las preferencias dadas para R^1 a R^6 y m en relación con los compuestos de la fórmula (I) también se aplican para las fórmulas (I.1) y (I.1a) como se define aquí a continuación.

En los compuestos de la fórmula (I.1) se da preferencia a aquellos que
10 donde R^1 se selecciona del grupo flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, trifluorometilo, metiltio, trifluorometiltio, y trifluorometoxi.

Las modalidades preferidas de tales compuestos incluyen:

15 Compuestos de la fórmula (I.1) donde R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 0;

Compuestos de la fórmula (I.1) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 1;

20

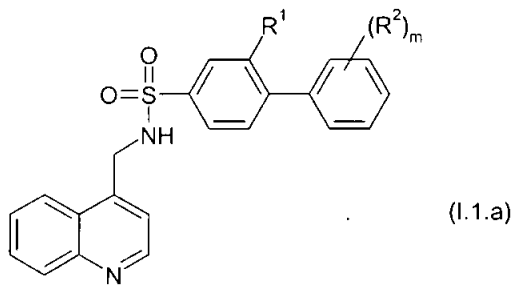
Compuestos de la fórmula (I.1) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 2;

Compuestos de la fórmula (I.1) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 3.

También se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula (I.1) donde R^1 es F, Cl o Br.

Se da también preferencia a los compuestos de la fórmula (I.1) donde R^2 se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 .

Entre los compuestos de la fórmula (I.1), se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula (I.1), donde R^1 se une al grupo fenilo en la posición meta respecto del grupo funcional sulfonamida, n es 1 y R^3 , R^4 , R^5 , R^6 son cada uno hidrógeno, a continuación denominados compuestos de quinolina de la fórmula (I.1.a)



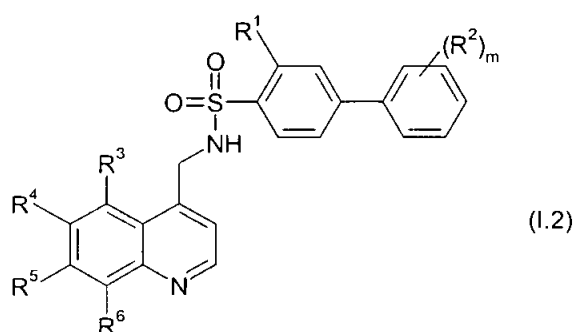
donde

R^1 , R^2 y m tienen los significados indicados anteriormente, en especial aquellos mencionados como preferidos.

Otra modalidad muy preferida de la presente invención se relaciona con

LS 1

compuestos de la fórmula (I), donde el sustituyente R^1 se une al grupo fenilo en posición orto respecto del grupo funcional sulfonamida. Este compuesto también se denomina compuesto de la fórmula (I.2), donde el grupo funcional fenilo tiene el patrón de sustitución como en el siguiente esquema, y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y m son como se definió anteriormente para los compuestos de la fórmula (I):



Un experto en la técnica comprenderá fácilmente que las preferencias dadas para R^1 a R^6 y m en relación con los compuestos de la fórmula (I) también se aplican a las fórmulas (I.2) y (I.2.a) como se define aquí a continuación.

En los compuestos de la fórmula (I.2) se da preferencia a aquellos donde R^1 se selecciona del grupo flúor, cloro, bromo, metilo, metoxi, trifluorometilo, metiltio, trifluorometiltio, y trifluorometoxi.

Las modalidades preferidas de tales compuestos incluyen:

Compuestos de la fórmula (I.2) donde R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 0;

Compuestos de la fórmula (I.2) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 1;

JS2

Compuestos de la fórmula (I.2) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 2;

- 5 Compuestos de la fórmula (I.2) donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son como se definió anteriormente y m es 3.

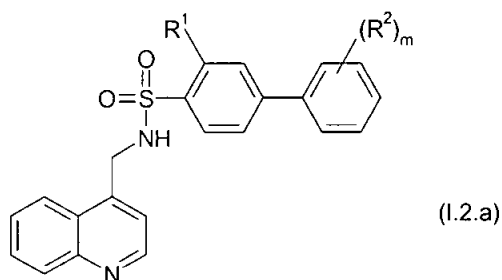
También se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula (I.2) donde R^1 es F, Cl o Br.

10

Se da también preferencia a los compuestos de la fórmula (I.2) donde R^2 se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 .

- 15 Entre los compuestos de la fórmula (I.2), se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula (I), donde R^1 se une al grupo fenilo en posición orto respecto del grupo funcional sulfonamida, n es 1 y R^3 , R^4 , R^5 , R^6 son cada uno hidrógeno, a continuación denominados como compuestos de quinolina de la fórmula (I.2.a),

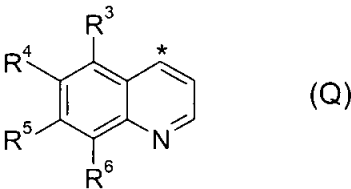
20



donde

R¹, R² y m tienen los significados indicados anteriormente, en especial aquellos mencionados como preferidos.

Los ejemplos de los grupos funcionales de quinolina Q se indican en la siguiente tabla A



En la fórmula (Q), * denota el sitio de unión con la estructura.

Resto de quinolina N.º	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
Q-1	H	H	H	H
Q-2	F	H	H	H
Q-3	H	F	H	H
Q-4	H	H	F	H
Q-5	H	H	H	F
Q-6	Cl	H	H	H
Q-7	H	Cl	H	H
Q-8	H	H	Cl	H
Q-9	H	H	H	Cl
Q-10	CH ₃	H	H	H
Q-11	H	CH ₃	H	H
Q-12	H	H	CH ₃	H
Q-13	H	H	H	CH ₃
Q-14	OCH ₃	H	H	H
Q-15	H	OCH ₃	H	H
Q-16	H	H	OCH ₃	H
Q-17	H	H	H	OCH ₃
Q-18	CF ₃	H	H	H
Q-19	H	CF ₃	H	H
Q-20	H	H	CF ₃	H

LS4

Resto de quinolina N.º	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
Q-21	H	H	H	CF ₃
Q-22	OCF ₃	H	H	H
Q-23	H	OCF ₃	H	H
Q-24	H	H	OCF ₃	H
Q-25	H	H	H	OCF ₃
Q-26	Cl	Cl	H	H
Q-27	Cl	H	Cl	H
Q-28	Cl	H	H	Cl
Q-29	H	Cl	Cl	H
Q-30	H	Cl	H	Cl
Q-31	H	H	Cl	Cl
Q-32	F	F	H	H
Q-33	F	H	F	H
Q-34	F	H	H	F
Q-35	H	F	F	H
Q-36	H	F	H	F
Q-37	H	H	F	F
Q-38	CH ₃	CH ₃	H	H
Q-39	CH ₃	H	CH ₃	H
Q-40	CH ₃	H	H	CH ₃
Q-41	H	CH ₃	CH ₃	H
Q-42	H	CH ₃	H	CH ₃
Q-43	H	H	CH ₃	CH ₃
Q-44	OCH ₃	OCH ₃	H	H
Q-45	OCH ₃	H	OCH ₃	H
Q-46	OCH ₃	H	H	OCH ₃
Q-47	H	OCH ₃	OCH ₃	H
Q-48	H	OCH ₃	H	OCH ₃
Q-49	H	H	OCH ₃	OCH ₃
Q-50	CF ₃	CF ₃	H	H
Q-51	CF ₃	H	CF ₃	H
Q-52	CF ₃	H	H	CF ₃
Q-53	H	CF ₃	CF ₃	H

LSR

Resto de quinolina N.º	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
Q-54	H	CF ₃	H	CF ₃
Q-55	H	H	CF ₃	CF ₃

con respecto al uso, se da particular preferencia a los compuestos de la fórmula (I) compilados en las siguientes tablas. Más aún, los grupos mencionados para un sustituyente en las tablas son en sí, sin tener en cuenta la combinación en la que se mencionan, una modalidad particularmente preferida del sustituyente en cuestión.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-1 y la combinación de (R¹)_n y (R²)_m en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

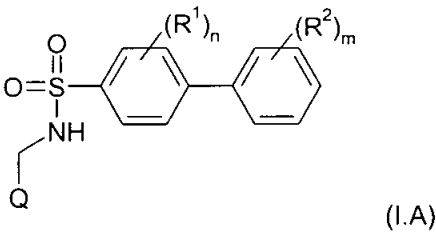


Tabla B

1576

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1	2-F	—
A-2	2-Cl	—
A-3	2-CH ₃	—
A-4	2-CF ₃	—
A-5	2-OCH ₃	—
A-6	2-OCF ₃	—
A-7	3-F	—
A-8	3-Cl	—
A-9	3-CH ₃	—
A-10	3-CF ₃	—
A-11	3-OCH ₃	—
A-12	3-OCF ₃	—
A-13	2-F	2-CH ₃
A-14	2-Cl	2-CH ₃
A-15	2-CH ₃	2-CH ₃
A-16	2-CF ₃	2-CH ₃
A-17	2-OCH ₃	2-CH ₃
A-18	2-OCF ₃	2-CH ₃
A-19	3-F	2-CH ₃
A-20	3-Cl	2-CH ₃
A-21	3-CH ₃	2-CH ₃
A-22	3-CF ₃	2-CH ₃
A-23	3-OCH ₃	2-CH ₃
A-24	3-OCF ₃	2-CH ₃
A-25	2-F	2-CH ₂ CH ₃
A-26	2-Cl	2-CH ₂ CH ₃
A-27	2-CH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-28	2-CF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-29	2-OCH ₃	2-CH ₂ CH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-30	2-OCF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-31	3-F	2-CH ₂ CH ₃
A-32	3-Cl	2-CH ₂ CH ₃
A-33	3-CH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-34	3-CF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-35	3-OCH ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-36	3-OCF ₃	2-CH ₂ CH ₃
A-37	2-F	2-Br
A-38	2-Cl	2-Br
A-39	2-CH ₃	2-Br
A-40	2-CF ₃	2-Br
A-41	2-OCH ₃	2-Br
A-42	2-OCF ₃	2-Br
A-43	3-F	2-Br
A-44	3-Cl	2-Br
A-45	3-CH ₃	2-Br
A-46	3-CF ₃	2-Br
A-47	3-OCH ₃	2-Br
A-48	3-OCF ₃	2-Br
A-49	2-F	2-Cl
A-50	2-Cl	2-Cl
A-51	2-CH ₃	2-Cl
A-52	2-CF ₃	2-Cl
A-53	2-OCH ₃	2-Cl
A-54	2-OCF ₃	2-Cl
A-55	3-F	2-Cl
A-56	3-Cl	2-Cl
A-57	3-CH ₃	2-Cl
A-58	3-CF ₃	2-Cl

157

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-59	3-OCH ₃	2-Cl
A-60	3-OCF ₃	2-Cl
A-61	2-F	2-F
A-62	2-Cl	2-F
A-63	2-CH ₃	2-F
A-64	2-CF ₃	2-F
A-65	2-OCH ₃	2-F
A-66	2-OCF ₃	2-F
A-67	3-F	2-F
A-68	3-Cl	2-F
A-69	3-CH ₃	2-F
A-70	3-CF ₃	2-F
A-71	3-OCH ₃	2-F
A-72	3-OCF ₃	2-F
A-73	2-F	2-CN
A-74	2-Cl	2-CN
A-75	2-CH ₃	2-CN
A-76	2-CF ₃	2-CN
A-77	2-OCH ₃	2-CN
A-78	2-OCF ₃	2-CN
A-79	3-F	2-CN
A-80	3-Cl	2-CN
A-81	3-CH ₃	2-CN
A-82	3-CF ₃	2-CN
A-83	3-OCH ₃	2-CN
A-84	3-OCF ₃	2-CN
A-85	2-F	2-NO ₂
A-86	2-Cl	2-NO ₂
A-87	2-CH ₃	2-NO ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-88	2-CF ₃	2-NO ₂
A-89	2-OCH ₃	2-NO ₂
A-90	2-OCF ₃	2-NO ₂
A-91	3-F	2-NO ₂
A-92	3-Cl	2-NO ₂
A-93	3-CH ₃	2-NO ₂
A-94	3-CF ₃	2-NO ₂
A-95	3-OCH ₃	2-NO ₂
A-96	3-OCF ₃	2-NO ₂
A-97	2-F	2-OCH ₃
A-98	2-Cl	2-OCH ₃
A-99	2-CH ₃	2-OCH ₃
A-100	2-CF ₃	2-OCH ₃
A-101	2-OCH ₃	2-OCH ₃
A-102	2-OCF ₃	2-OCH ₃
A-103	3-F	2-OCH ₃
A-104	3-Cl	2-OCH ₃
A-105	3-CH ₃	2-OCH ₃
A-106	3-CF ₃	2-OCH ₃
A-107	3-OCH ₃	2-OCH ₃
A-108	3-OCF ₃	2-OCH ₃
A-109	2-F	2-CF ₃
A-110	2-Cl	2-CF ₃
A-111	2-CH ₃	2-CF ₃
A-112	2-CF ₃	2-CF ₃
A-113	2-OCH ₃	2-CF ₃
A-114	2-OCF ₃	2-CF ₃
A-115	3-F	2-CF ₃
A-116	3-Cl	2-CF ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-117	3-CH ₃	2-CF ₃
A-118	3-CF ₃	2-CF ₃
A-119	3-OCH ₃	2-CF ₃
A-120	3-OCF ₃	2-CF ₃
A-121	2-F	2-OCF ₃
A-122	2-Cl	2-OCF ₃
A-123	2-CH ₃	2-OCF ₃
A-124	2-CF ₃	2-OCF ₃
A-125	2-OCH ₃	2-OCF ₃
A-126	2-OCF ₃	2-OCF ₃
A-127	3-F	2-OCF ₃
A-128	3-Cl	2-OCF ₃
A-129	3-CH ₃	2-OCF ₃
A-130	3-CF ₃	2-OCF ₃
A-131	3-OCH ₃	2-OCF ₃
A-132	3-OCF ₃	2-OCF ₃
A-133	2-F	2-CF(CF ₃) ₂
A-134	2-Cl	2-CF(CF ₃) ₂
A-135	2-CH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-136	2-CF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-137	2-OCH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-138	2-OCF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-139	3-F	2-CF(CF ₃) ₂
A-140	3-Cl	2-CF(CF ₃) ₂
A-141	3-CH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-142	3-CF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-143	3-OCH ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-144	3-OCF ₃	2-CF(CF ₃) ₂
A-145	2-F	2-SCH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-146	2-Cl	2-SCH ₃
A-147	2-CH ₃	2-SCH ₃
A-148	2-CF ₃	2-SCH ₃
A-149	2-OCH ₃	2-SCH ₃
A-150	2-OCF ₃	2-SCH ₃
A-151	3-F	2-SCH ₃
A-152	3-Cl	2-SCH ₃
A-153	3-CH ₃	2-SCH ₃
A-154	3-CF ₃	2-SCH ₃
A-155	3-OCH ₃	2-SCH ₃
A-156	3-OCF ₃	2-SCH ₃
A-157	2-F	3-CH ₃
A-158	2-Cl	3-CH ₃
A-159	2-CH ₃	3-CH ₃
A-160	2-CF ₃	3-CH ₃
A-161	2-OCH ₃	3-CH ₃
A-162	2-OCF ₃	3-CH ₃
A-163	3-F	3-CH ₃
A-164	3-Cl	3-CH ₃
A-165	3-CH ₃	3-CH ₃
A-166	3-CF ₃	3-CH ₃
A-167	3-OCH ₃	3-CH ₃
A-168	3-OCF ₃	3-CH ₃
A-169	2-F	3-CH ₂ CH ₃
A-170	2-Cl	3-CH ₂ CH ₃
A-171	2-CH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-172	2-CF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-173	2-OCH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-174	2-OCF ₃	3-CH ₂ CH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-175	3-F	3-CH ₂ CH ₃
A-176	3-Cl	3-CH ₂ CH ₃
A-177	3-CH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-178	3-CF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-179	3-OCH ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-180	3-OCF ₃	3-CH ₂ CH ₃
A-181	2-F	3-Br
A-182	2-Cl	3-Br
A-183	2-CH ₃	3-Br
A-184	2-CF ₃	3-Br
A-185	2-OCH ₃	3-Br
A-186	2-OCF ₃	3-Br
A-187	3-F	3-Br
A-188	3-Cl	3-Br
A-189	3-CH ₃	3-Br
A-190	3-CF ₃	3-Br
A-191	3-OCH ₃	3-Br
A-192	3-OCF ₃	3-Br
A-193	2-F	3-Cl
A-194	2-Cl	3-Cl
A-195	2-CH ₃	3-Cl
A-196	2-CF ₃	3-Cl
A-197	2-OCH ₃	3-Cl
A-198	2-OCF ₃	3-Cl
A-199	3-F	3-Cl
A-200	3-Cl	3-Cl
A-201	3-CH ₃	3-Cl
A-202	3-CF ₃	3-Cl
A-203	3-OCH ₃	3-Cl

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-204	3-OCF ₃	3-Cl
A-205	2-F	3-F
A-206	2-Cl	3-F
A-207	2-CH ₃	3-F
A-208	2-CF ₃	3-F
A-209	2-OCH ₃	3-F
A-210	2-OCF ₃	3-F
A-211	3-F	3-F
A-212	3-Cl	3-F
A-213	3-CH ₃	3-F
A-214	3-CF ₃	3-F
A-215	3-OCH ₃	3-F
A-216	3-OCF ₃	3-F
A-217	2-F	3-CN
A-218	2-Cl	3-CN
A-219	2-CH ₃	3-CN
A-220	2-CF ₃	3-CN
A-221	2-OCH ₃	3-CN
A-222	2-OCF ₃	3-CN
A-223	3-F	3-CN
A-224	3-Cl	3-CN
A-225	3-CH ₃	3-CN
A-226	3-CF ₃	3-CN
A-227	3-OCH ₃	3-CN
A-228	3-OCF ₃	3-CN
A-229	2-F	3-NO ₂
A-230	2-Cl	3-NO ₂
A-231	2-CH ₃	3-NO ₂
A-232	2-CF ₃	3-NO ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-233	2-OCH ₃	3-NO ₂
A-234	2-OCF ₃	3-NO ₂
A-235	3-F	3-NO ₂
A-236	3-Cl	3-NO ₂
A-237	3-CH ₃	3-NO ₂
A-238	3-CF ₃	3-NO ₂
A-239	3-OCH ₃	3-NO ₂
A-240	3-OCF ₃	3-NO ₂
A-241	2-F	3-OCH ₃
A-242	2-Cl	3-OCH ₃
A-243	2-CH ₃	3-OCH ₃
A-244	2-CF ₃	3-OCH ₃
A-245	2-OCH ₃	3-OCH ₃
A-246	2-OCF ₃	3-OCH ₃
A-247	3-F	3-OCH ₃
A-248	3-Cl	3-OCH ₃
A-249	3-CH ₃	3-OCH ₃
A-250	3-CF ₃	3-OCH ₃
A-251	3-OCH ₃	3-OCH ₃
A-252	3-OCF ₃	3-OCH ₃
A-253	2-F	3-CF ₃
A-254	2-Cl	3-CF ₃
A-255	2-CH ₃	3-CF ₃
A-256	2-CF ₃	3-CF ₃
A-257	2-OCH ₃	3-CF ₃
A-258	2-OCF ₃	3-CF ₃
A-259	3-F	3-CF ₃
A-260	3-Cl	3-CF ₃
A-261	3-CH ₃	3-CF ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-262	3-CF ₃	3-CF ₃
A-263	3-OCH ₃	3-CF ₃
A-264	3-OCF ₃	3-CF ₃
A-265	2-Cl	3-OCF ₃
A-266	2-CH ₃	3-OCF ₃
A-267	2-CF ₃	3-OCF ₃
A-268	2-OCH ₃	3-OCF ₃
A-269	2-OCF ₃	3-OCF ₃
A-270	3-F	3-OCF ₃
A-271	3-Cl	3-OCF ₃
A-272	3-CH ₃	3-OCF ₃
A-273	3-CF ₃	3-OCF ₃
A-274	3-OCH ₃	3-OCF ₃
A-275	3-OCF ₃	3-OCF ₃
A-276	2-F	3-CF(CF ₃) ₂
A-277	2-Cl	3-CF(CF ₃) ₂
A-278	2-CH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-279	2-CF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-280	2-OCH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-281	2-OCF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-282	3-F	3-CF(CF ₃) ₂
A-283	3-Cl	3-CF(CF ₃) ₂
A-284	3-CH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-285	3-CF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-286	3-OCH ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-287	3-OCF ₃	3-CF(CF ₃) ₂
A-288	2-Cl	3-SCH ₃
A-289	2-CH ₃	3-SCH ₃
A-290	2-CF ₃	3-SCH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-291	2-OCH ₃	3-SCH ₃
A-292	2-OCF ₃	3-SCH ₃
A-293	3-F	3-SCH ₃
A-294	3-Cl	3-SCH ₃
A-295	3-CH ₃	3-SCH ₃
A-296	3-CF ₃	3-SCH ₃
A-297	3-OCH ₃	3-SCH ₃
A-298	3-OCF ₃	3-SCH ₃
A-299	2-F	3-C(=O)CH ₃
A-300	2-Cl	3-C(=O)CH ₃
A-301	2-CH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-302	2-CF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-303	2-OCH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-304	2-OCF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-305	3-F	3-C(=O)CH ₃
A-306	3-Cl	3-C(=O)CH ₃
A-307	3-CH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-308	3-CF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-309	3-OCH ₃	3-C(=O)CH ₃
A-310	3-OCF ₃	3-C(=O)CH ₃
A-311	2-F	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-312	2-Cl	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-313	2-CH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-314	2-CF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-315	2-OCH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-316	2-OCF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-317	3-F	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-318	3-Cl	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-319	3-CH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-320	3-CF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-321	3-OCH ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-322	3-OCF ₃	3-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-323	2-F	4-CH ₃
A-324	2-Cl	4-CH ₃
A-325	2-CH ₃	4-CH ₃
A-326	2-CF ₃	4-CH ₃
A-327	2-OCH ₃	4-CH ₃
A-328	2-OCF ₃	4-CH ₃
A-329	3-F	4-CH ₃
A-330	3-Cl	4-CH ₃
A-331	3-CH ₃	4-CH ₃
A-332	3-CF ₃	4-CH ₃
A-333	3-OCH ₃	4-CH ₃
A-334	3-OCF ₃	4-CH ₃
A-335	2-F	4-CH ₂ CH ₃
A-336	2-Cl	4-CH ₂ CH ₃
A-337	2-CH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-338	2-CF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-339	2-OCH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-340	2-OCF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-341	3-F	4-CH ₂ CH ₃
A-342	3-Cl	4-CH ₂ CH ₃
A-343	3-CH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-344	3-CF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-345	3-OCH ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-346	3-OCF ₃	4-CH ₂ CH ₃
A-347	2-F	4-Br
A-348	2-Cl	4-Br

262

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-349	2-CH ₃	4-Br
A-350	2-CF ₃	4-Br
A-351	2-OCH ₃	4-Br
A-352	2-OCF ₃	4-Br
A-353	3-F	4-Br
A-354	3-Cl	4-Br
A-355	3-CH ₃	4-Br
A-356	3-CF ₃	4-Br
A-357	3-OCH ₃	4-Br
A-358	3-OCF ₃	4-Br
A-359	2-F	4-Cl
A-360	2-Cl	4-Cl
A-361	2-CH ₃	4-Cl
A-362	2-CF ₃	4-Cl
A-363	2-OCH ₃	4-Cl
A-364	2-OCF ₃	4-Cl
A-365	3-F	4-Cl
A-366	3-Cl	4-Cl
A-367	3-CH ₃	4-Cl
A-368	3-CF ₃	4-Cl
A-369	3-OCH ₃	4-Cl
A-370	3-OCF ₃	4-Cl
A-371	2-F	4-F
A-372	2-Cl	4-F
A-373	2-CH ₃	4-F
A-374	2-CF ₃	4-F
A-375	2-OCH ₃	4-F
A-376	2-OCF ₃	4-F
A-377	3-F	4-F

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-378	3-Cl	4-F
A-379	3-CH ₃	4-F
A-380	3-CF ₃	4-F
A-381	3-OCH ₃	4-F
A-382	3-OCF ₃	4-F
A-383	2-F	4-CN
A-384	2-Cl	4-CN
A-385	2-CH ₃	4-CN
A-386	2-CF ₃	4-CN
A-387	2-OCH ₃	4-CN
A-388	2-OCF ₃	4-CN
A-389	3-F	4-CN
A-390	3-Cl	4-CN
A-391	3-CH ₃	4-CN
A-392	3-CF ₃	4-CN
A-393	3-OCH ₃	4-CN
A-394	3-OCF ₃	4-CN
A-395	2-F	4-NO ₂
A-396	2-Cl	4-NO ₂
A-397	2-CH ₃	4-NO ₂
A-398	2-CF ₃	4-NO ₂
A-399	2-OCH ₃	4-NO ₂
A-400	2-OCF ₃	4-NO ₂
A-401	3-F	4-NO ₂
A-402	3-Cl	4-NO ₂
A-403	3-CH ₃	4-NO ₂
A-404	3-CF ₃	4-NO ₂
A-405	3-OCH ₃	4-NO ₂
A-406	3-OCF ₃	4-NO ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-407	2-F	4-OCH ₃
A-408	2-Cl	4-OCH ₃
A-409	2-CH ₃	4-OCH ₃
A-410	2-CF ₃	4-OCH ₃
A-411	2-OCH ₃	4-OCH ₃
A-412	2-OCF ₃	4-OCH ₃
A-413	3-F	4-OCH ₃
A-414	3-Cl	4-OCH ₃
A-415	3-CH ₃	4-OCH ₃
A-416	3-CF ₃	4-OCH ₃
A-417	3-OCH ₃	4-OCH ₃
A-418	3-OCF ₃	4-OCH ₃
A-419	2-F	4-OCH ₂ CH ₃
A-420	2-Cl	4-OCH ₂ CH ₃
A-421	2-CH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-422	2-CF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-423	2-OCH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-424	2-OCF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-425	3-F	4-OCH ₂ CH ₃
A-426	3-Cl	4-OCH ₂ CH ₃
A-427	3-CH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-428	3-CF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-429	3-OCH ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-430	3-OCF ₃	4-OCH ₂ CH ₃
A-431	2-F	4-OCH(CH ₃) ₂
A-432	2-Cl	4-OCH(CH ₃) ₂
A-433	2-CH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-434	2-CF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-435	2-OCH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-436	2-OCF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-437	3-F	4-OCH(CH ₃) ₂
A-438	3-Cl	4-OCH(CH ₃) ₂
A-439	3-CH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-440	3-CF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-441	3-OCH ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-442	3-OCF ₃	4-OCH(CH ₃) ₂
A-443	2-F	4-OC(CH ₃) ₃
A-444	2-Cl	4-OC(CH ₃) ₃
A-445	2-CH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-446	2-CF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-447	2-OCH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-448	2-OCF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-449	3-F	4-OC(CH ₃) ₃
A-450	3-Cl	4-OC(CH ₃) ₃
A-451	3-CH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-452	3-CF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-453	3-OCH ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-454	3-OCF ₃	4-OC(CH ₃) ₃
A-455	2-F	4-CF ₃
A-456	2-Cl	4-CF ₃
A-457	2-CH ₃	4-CF ₃
A-458	2-CF ₃	4-CF ₃
A-459	2-OCH ₃	4-CF ₃
A-460	2-OCF ₃	4-CF ₃
A-461	3-F	4-CF ₃
A-462	3-Cl	4-CF ₃
A-463	3-CH ₃	4-CF ₃
A-464	3-CF ₃	4-CF ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-465	3-OCH ₃	4-CF ₃
A-466	3-OCF ₃	4-CF ₃
A-467	2-F	4-OCF ₃
A-468	2-Cl	4-OCF ₃
A-469	2-CH ₃	4-OCF ₃
A-470	2-CF ₃	4-OCF ₃
A-471	2-OCH ₃	4-OCF ₃
A-472	2-OCF ₃	4-OCF ₃
A-473	3-F	4-OCF ₃
A-474	3-Cl	4-OCF ₃
A-475	3-CH ₃	4-OCF ₃
A-476	3-CF ₃	4-OCF ₃
A-477	3-OCH ₃	4-OCF ₃
A-478	3-OCF ₃	4-OCF ₃
A-479	2-F	4-SCH ₃
A-480	2-Cl	4-SCH ₃
A-481	2-CH ₃	4-SCH ₃
A-482	2-CF ₃	4-SCH ₃
A-483	2-OCH ₃	4-SCH ₃
A-484	2-OCF ₃	4-SCH ₃
A-485	3-F	4-SCH ₃
A-486	3-Cl	4-SCH ₃
A-487	3-CH ₃	4-SCH ₃
A-488	3-CF ₃	4-SCH ₃
A-489	3-OCH ₃	4-SCH ₃
A-490	3-OCF ₃	4-SCH ₃
A-491	2-F	4-C(=O)CH ₃
A-492	2-Cl	4-C(=O)CH ₃
A-493	2-CH ₃	4-C(=O)CH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-494	2-CF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-495	2-OCH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-496	2-OCF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-497	3-F	4-C(=O)CH ₃
A-498	3-Cl	4-C(=O)CH ₃
A-499	3-CH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-500	3-CF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-501	3-OCH ₃	4-C(=O)CH ₃
A-502	3-OCF ₃	4-C(=O)CH ₃
A-503	2-F	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-504	2-Cl	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-505	2-CH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-506	2-CF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-507	2-OCH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-508	2-OCF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-509	3-F	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-510	3-Cl	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-511	3-CH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-512	3-CF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-513	3-OCH ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-514	3-OCF ₃	4-C(=NOCH ₃)CH ₃
A-515	2-F	4-CF(CF ₃) ₂
A-516	2-Cl	4-CF(CF ₃) ₂
A-517	2-CH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-518	2-CF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-519	2-OCH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-520	2-OCF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-521	3-F	4-CF(CF ₃) ₂
A-522	3-Cl	4-CF(CF ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-523	3-CH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-524	3-CF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-525	3-OCH ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-526	3-OCF ₃	4-CF(CF ₃) ₂
A-527	2-F	2,4-(CH ₃) ₂
A-528	2-Cl	2,4-(CH ₃) ₂
A-529	2-CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-530	2-CF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-531	2-OCH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-532	2-OCF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-533	3-F	2,4-(CH ₃) ₂
A-534	3-Cl	2,4-(CH ₃) ₂
A-535	3-CH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-536	3-CF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-537	3-OCH ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-538	3-OCF ₃	2,4-(CH ₃) ₂
A-539	2-F	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-540	2-Cl	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-541	2-CH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-542	2-CF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-543	2-OCH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-544	2-OCF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-545	3-F	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-546	3-Cl	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-547	3-CH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-548	3-CF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-549	3-OCH ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-550	3-OCF ₃	2,4-(CH ₂ CH ₃) ₂
A-551	2-F	2,4-Br ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-552	2-Cl	2,4-Br ₂
A-553	2-CH ₃	2,4-Br ₂
A-554	2-CF ₃	2,4-Br ₂
A-555	2-OCH ₃	2,4-Br ₂
A-556	2-OCF ₃	2,4-Br ₂
A-557	3-F	2,4-Br ₂
A-558	3-Cl	2,4-Br ₂
A-559	3-CH ₃	2,4-Br ₂
A-560	3-CF ₃	2,4-Br ₂
A-561	3-OCH ₃	2,4-Br ₂
A-562	3-OCF ₃	2,4-Br ₂
A-563	2-F	2,4-Cl ₂
A-564	2-Cl	2,4-Cl ₂
A-565	2-CH ₃	2,4-Cl ₂
A-566	2-CF ₃	2,4-Cl ₂
A-567	2-OCH ₃	2,4-Cl ₂
A-568	2-OCF ₃	2,4-Cl ₂
A-569	3-F	2,4-Cl ₂
A-570	3-Cl	2,4-Cl ₂
A-571	3-CH ₃	2,4-Cl ₂
A-572	3-CF ₃	2,4-Cl ₂
A-573	3-OCH ₃	2,4-Cl ₂
A-574	3-OCF ₃	2,4-Cl ₂
A-575	2-F	2,4-F ₂
A-576	2-Cl	2,4-F ₂
A-577	2-CH ₃	2,4-F ₂
A-578	2-CF ₃	2,4-F ₂
A-579	2-OCH ₃	2,4-F ₂
A-580	2-OCF ₃	2,4-F ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-581	3-F	2,4-F ₂
A-582	3-Cl	2,4-F ₂
A-583	3-CH ₃	2,4-F ₂
A-584	3-CF ₃	2,4-F ₂
A-585	3-OCH ₃	2,4-F ₂
A-586	3-OCF ₃	2,4-F ₂
A-587	2-F	2,4-(OCH ₃) ₂
A-588	2-Cl	2,4-(OCH ₃) ₂
A-589	2-CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-590	2-CF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-591	2-OCH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-592	2-OCF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-593	3-F	2,4-(OCH ₃) ₂
A-594	3-Cl	2,4-(OCH ₃) ₂
A-595	3-CH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-596	3-CF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-597	3-OCH ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-598	3-OCF ₃	2,4-(OCH ₃) ₂
A-599	2-F	2,4-(CF ₃) ₂
A-600	2-Cl	2,4-(CF ₃) ₂
A-601	2-CH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-602	2-CF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-603	2-OCH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-604	2-OCF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-605	3-F	2,4-(CF ₃) ₂
A-606	3-Cl	2,4-(CF ₃) ₂
A-607	3-CH ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-608	3-CF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-609	3-OCH ₃	2,4-(CF ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-610	3-OCF ₃	2,4-(CF ₃) ₂
A-611	2-F	2,4-(OCF ₃) ₂
A-612	2-Cl	2,4-(OCF ₃) ₂
A-613	2-CH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-614	2-CF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-615	2-OCH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-616	2-OCF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-617	3-F	2,4-(OCF ₃) ₂
A-618	3-Cl	2,4-(OCF ₃) ₂
A-619	3-CH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-620	3-CF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-621	3-OCH ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-622	3-OCF ₃	2,4-(OCF ₃) ₂
A-623	2-F	2,5-(CH ₃) ₂
A-624	2-Cl	2,5-(CH ₃) ₂
A-625	2-CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-626	2-CF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-627	2-OCH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-628	2-OCF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-629	3-F	2,5-(CH ₃) ₂
A-630	3-Cl	2,5-(CH ₃) ₂
A-631	3-CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-632	3-CF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-633	3-OCH ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-634	3-OCF ₃	2,5-(CH ₃) ₂
A-635	2-F	2,5-Cl ₂
A-636	2-Cl	2,5-Cl ₂
A-637	2-CH ₃	2,5-Cl ₂
A-638	2-CF ₃	2,5-Cl ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-639	2-OCH ₃	2,5-Cl ₂
A-640	2-OCF ₃	2,5-Cl ₂
A-641	3-F	2,5-Cl ₂
A-642	3-Cl	2,5-Cl ₂
A-643	3-CH ₃	2,5-Cl ₂
A-644	3-CF ₃	2,5-Cl ₂
A-645	3-OCH ₃	2,5-Cl ₂
A-646	3-OCF ₃	2,5-Cl ₂
A-647	2-F	2,5-F ₂
A-648	2-Cl	2,5-F ₂
A-649	2-CH ₃	2,5-F ₂
A-650	2-CF ₃	2,5-F ₂
A-651	2-OCH ₃	2,5-F ₂
A-652	2-OCF ₃	2,5-F ₂
A-653	3-F	2,5-F ₂
A-654	3-Cl	2,5-F ₂
A-655	3-CH ₃	2,5-F ₂
A-656	3-CF ₃	2,5-F ₂
A-657	3-OCH ₃	2,5-F ₂
A-658	3-OCF ₃	2,5-F ₂
A-659	2-F	2,5-(OCH ₃) ₂
A-660	2-Cl	2,5-(OCH ₃) ₂
A-661	2-CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-662	2-CF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-663	2-OCH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-664	2-OCF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-665	3-F	2,5-(OCH ₃) ₂
A-666	3-Cl	2,5-(OCH ₃) ₂
A-667	3-CH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-668	3-CF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-669	3-OCH ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-670	3-OCF ₃	2,5-(OCH ₃) ₂
A-671	2-F	2,5-(CF ₃) ₂
A-672	2-Cl	2,5-(CF ₃) ₂
A-673	2-CH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-674	2-CF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-675	2-OCH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-676	2-OCF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-677	3-F	2,5-(CF ₃) ₂
A-678	3-Cl	2,5-(CF ₃) ₂
A-679	3-CH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-680	3-CF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-681	3-OCH ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-682	3-OCF ₃	2,5-(CF ₃) ₂
A-683	2-F	2,5-(OCF ₃) ₂
A-684	2-Cl	2,5-(OCF ₃) ₂
A-685	2-CH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-686	2-CF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-687	2-OCH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-688	2-OCF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-689	3-F	2,5-(OCF ₃) ₂
A-690	3-Cl	2,5-(OCF ₃) ₂
A-691	3-CH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-692	3-CF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-693	3-OCH ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-694	3-OCF ₃	2,5-(OCF ₃) ₂
A-695	2-F	2,5-(SCH ₃) ₂
A-696	2-Cl	2,5-(SCH ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-697	2-CH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-698	2-CF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-699	2-OCH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-700	2-OCF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-701	3-F	2,5-(SCH ₃) ₂
A-702	3-Cl	2,5-(SCH ₃) ₂
A-703	3-CH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-704	3-CF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-705	3-OCH ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-706	3-OCF ₃	2,5-(SCH ₃) ₂
A-707	2-F	2,6-(CH ₃) ₂
A-708	2-Cl	2,6-(CH ₃) ₂
A-709	2-CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-710	2-CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-711	2-OCH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-712	2-OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-713	3-F	2,6-(CH ₃) ₂
A-714	3-Cl	2,6-(CH ₃) ₂
A-715	3-CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-716	3-CF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-717	3-OCH ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-718	3-OCF ₃	2,6-(CH ₃) ₂
A-719	2-F	3,5-(CH ₃) ₂
A-720	2-Cl	3,5-(CH ₃) ₂
A-721	2-CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-722	2-CF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-723	2-OCH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-724	2-OCF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-725	3-F	3,5-(CH ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-726	3-Cl	3,5-(CH ₃) ₂
A-727	3-CH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-728	3-CF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-729	3-OCH ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-730	3-OCF ₃	3,5-(CH ₃) ₂
A-731	2-F	3,5-(CF ₃) ₂
A-732	2-Cl	3,5-(CF ₃) ₂
A-733	2-CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-734	2-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-735	2-OCH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-736	2-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-737	3-F	3,5-(CF ₃) ₂
A-738	3-Cl	3,5-(CF ₃) ₂
A-739	3-CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-740	3-CF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-741	3-OCH ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-742	3-OCF ₃	3,5-(CF ₃) ₂
A-743	2-F	3,5-(OCF ₃) ₂
A-744	2-Cl	3,5-(OCF ₃) ₂
A-745	2-CH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-746	2-CF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-747	2-OCH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-748	2-OCF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-749	3-F	3,5-(OCF ₃) ₂
A-750	3-Cl	3,5-(OCF ₃) ₂
A-751	3-CH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-752	3-CF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-753	3-OCH ₃	3,5-(OCF ₃) ₂
A-754	3-OCF ₃	3,5-(OCF ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-755	2-F	3-Cl, 4-F
A-756	2-Cl	3-Cl, 4-F
A-757	2-CH ₃	3-Cl, 4-F
A-758	2-CF ₃	3-Cl, 4-F
A-759	2-OCH ₃	3-Cl, 4-F
A-760	2-OCF ₃	3-Cl, 4-F
A-761	3-F	3-Cl, 4-F
A-762	3-Cl	3-Cl, 4-F
A-763	3-CH ₃	3-Cl, 4-F
A-764	3-CF ₃	3-Cl, 4-F
A-765	3-OCH ₃	3-Cl, 4-F
A-766	3-OCF ₃	3-Cl, 4-F
A-767	2-F	3-CH ₃ , 4-F
A-768	2-Cl	3-CH ₃ , 4-F
A-769	2-CH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-770	2-CF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-771	2-OCH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-772	2-OCF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-773	3-F	3-CH ₃ , 4-F
A-774	3-Cl	3-CH ₃ , 4-F
A-775	3-CH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-776	3-CF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-777	3-OCH ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-778	3-OCF ₃	3-CH ₃ , 4-F
A-779	2-F	2-Cl, 4-F
A-780	2-Cl	2-Cl, 4-F
A-781	2-CH ₃	2-Cl, 4-F
A-782	2-CF ₃	2-Cl, 4-F
A-783	2-OCH ₃	2-Cl, 4-F

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-784	2-OCF ₃	2-Cl, 4-F
A-785	3-F	2-Cl, 4-F
A-786	3-Cl	2-Cl, 4-F
A-787	3-CH ₃	2-Cl, 4-F
A-788	3-CF ₃	2-Cl, 4-F
A-789	3-OCH ₃	2-Cl, 4-F
A-790	3-OCF ₃	2-Cl, 4-F
A-791	2-F	2-Cl, 4-OCH ₃
A-792	2-Cl	2-Cl, 4-OCH ₃
A-793	2-CH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-794	2-CF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-795	2-OCH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-796	2-OCF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-797	3-F	2-Cl, 4-OCH ₃
A-798	3-Cl	2-Cl, 4-OCH ₃
A-799	3-CH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-800	3-CF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-801	3-OCH ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-802	3-OCF ₃	2-Cl, 4-OCH ₃
A-803	2-F	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-804	2-Cl	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-805	2-CH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-806	2-CF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-807	2-OCH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-808	2-OCF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-809	3-F	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-810	3-Cl	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-811	3-CH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-812	3-CF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-813	3-OCH ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-814	3-OCF ₃	2-Cl, 4-CF(CF ₃) ₂
A-815	2-F	2-F, 4-Cl
A-816	2-Cl	2-F, 4-Cl
A-817	2-CH ₃	2-F, 4-Cl
A-818	2-CF ₃	2-F, 4-Cl
A-819	2-OCH ₃	2-F, 4-Cl
A-820	2-OCF ₃	2-F, 4-Cl
A-821	3-F	2-F, 4-Cl
A-822	3-Cl	2-F, 4-Cl
A-823	3-CH ₃	2-F, 4-Cl
A-824	3-CF ₃	2-F, 4-Cl
A-825	3-OCH ₃	2-F, 4-Cl
A-826	3-OCF ₃	2-F, 4-Cl
A-827	2-F	2-F, 4-Br
A-828	2-Cl	2-F, 4-Br
A-829	2-CH ₃	2-F, 4-Br
A-830	2-CF ₃	2-F, 4-Br
A-831	2-OCH ₃	2-F, 4-Br
A-832	2-OCF ₃	2-F, 4-Br
A-833	3-F	2-F, 4-Br
A-834	3-Cl	2-F, 4-Br
A-835	3-CH ₃	2-F, 4-Br
A-836	3-CF ₃	2-F, 4-Br
A-837	3-OCH ₃	2-F, 4-Br
A-838	3-OCF ₃	2-F, 4-Br
A-839	2-F	2-F, 4-CH ₃
A-840	2-Cl	2-F, 4-CH ₃
A-841	2-CH ₃	2-F, 4-CH ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-842	2-CF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-843	2-OCH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-844	2-OCF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-845	3-F	2-F, 4-CH ₃
A-846	3-Cl	2-F, 4-CH ₃
A-847	3-CH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-848	3-CF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-849	3-OCH ₃	2-F, 4-CH ₃
A-850	3-OCF ₃	2-F, 4-CH ₃
A-851	2-F	2-F, 4-CF ₃
A-852	2-Cl	2-F, 4-CF ₃
A-853	2-CH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-854	2-CF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-855	2-OCH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-856	2-OCF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-857	3-F	2-F, 4-CF ₃
A-858	3-Cl	2-F, 4-CF ₃
A-859	3-CH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-860	3-CF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-861	3-OCH ₃	2-F, 4-CF ₃
A-862	3-OCF ₃	2-F, 4-CF ₃
A-863	2-F	2-F, 4-OCH ₃
A-864	2-Cl	2-F, 4-OCH ₃
A-865	2-CH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-866	2-CF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-867	2-OCH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-868	2-OCF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-869	3-F	2-F, 4-OCH ₃
A-870	3-Cl	2-F, 4-OCH ₃

172

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-871	3-CH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-872	3-CF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-873	3-OCH ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-874	3-OCF ₃	2-F, 4-OCH ₃
A-875	2-Cl	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-876	2-CH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-877	2-CF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-878	2-OCH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-879	2-OCF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-880	3-F	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-881	3-Cl	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-882	3-CH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-883	3-CF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-884	3-OCH ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-885	3-OCF ₃	2-F, 4-CF(CF ₃) ₂
A-886	2-F	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-887	2-Cl	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-888	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-889	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-890	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-891	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-892	3-F	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-893	3-Cl	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-894	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-895	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-896	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-897	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-OCH ₃
A-898	2-F	2-CH ₃ , 4-Cl
A-899	2-Cl	2-CH ₃ , 4-Cl

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-900	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-901	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-902	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-903	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-904	3-F	2-CH ₃ , 4-Cl
A-905	3-Cl	2-CH ₃ , 4-Cl
A-906	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-907	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-908	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-909	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-Cl
A-910	2-F	2-CH ₃ , 4-F
A-911	2-Cl	2-CH ₃ , 4-F
A-912	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-913	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-914	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-915	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-916	3-F	2-CH ₃ , 4-F
A-917	3-Cl	2-CH ₃ , 4-F
A-918	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-919	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-920	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-921	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-F
A-922	2-F	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-923	2-Cl	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-924	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-925	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-926	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-927	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-928	3-F	2-CH ₃ , 4-CF ₃

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-929	3-Cl	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-930	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-931	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-932	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-933	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF ₃
A-934	2-F	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-935	2-Cl	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-936	2-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-937	2-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-938	2-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-939	2-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-940	3-F	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-941	3-Cl	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-942	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-943	3-CF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-944	3-OCH ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-945	3-OCF ₃	2-CH ₃ , 4-CF(CF ₃) ₂
A-946	2-F	2-OCH ₃ , 4-F
A-947	2-Cl	2-OCH ₃ , 4-F
A-948	2-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-949	2-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-950	2-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-951	2-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-952	3-F	2-OCH ₃ , 4-F
A-953	3-Cl	2-OCH ₃ , 4-F
A-954	3-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-955	3-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-956	3-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-F
A-957	3-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-F

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-958	2-F	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-959	2-Cl	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-960	2-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-961	2-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-962	2-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-963	2-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-964	3-F	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-965	3-Cl	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-966	3-CH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-967	3-CF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-968	3-OCH ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-969	3-OCF ₃	2-OCH ₃ , 4-Cl
A-970	2-F	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-971	2-Cl	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-972	2-CH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-973	2-CF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-974	2-OCH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-975	2-OCF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-976	3-F	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-977	3-Cl	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-978	3-CH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-979	3-CF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-980	3-OCH ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-981	3-OCF ₃	3-NO ₂ , 4-CH ₃
A-982	3-F	2-CF ₃ , 4-Cl
A-983	3-Cl	2-CF ₃ , 4-Cl
A-984	3-CH ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-985	3-CF ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-986	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 4-Cl

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-987	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 4-Cl
A-988	3-F	2-Cl, 4-CF ₃
A-989	3-Cl	2-Cl, 4-CF ₃
A-990	3-CH ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-991	3-CF ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-992	3-OCH ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-993	3-OCF ₃	2-Cl, 4-CF ₃
A-994	3-F	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-995	3-Cl	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-996	3-CH ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-997	3-CF ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-998	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-999	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 4-OCH ₃
A-1000	3-F	3-Cl, 4-CF ₃
A-1001	3-Cl	3-Cl, 4-CF ₃
A-1002	3-CH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1003	3-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1004	3-OCH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1005	3-OCF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1006	3-F	2-CF ₃ , 5-F
A-1007	3-Cl	2-CF ₃ , 5-F
A-1008	3-CH ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1009	3-CF ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1010	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1011	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 5-F
A-1012	3-F	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1013	3-Cl	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1014	3-CH ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1015	3-CF ₃	2-CF ₃ , 5-Cl

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1016	3-OCH ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1017	3-OCF ₃	2-CF ₃ , 5-Cl
A-1018	3-F	2-Cl, 5-CF ₃
A-1019	3-Cl	2-Cl, 5-CF ₃
A-1020	3-CH ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1021	3-CF ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1022	3-OCH ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1023	3-OCF ₃	2-Cl, 5-CF ₃
A-1024	3-F	2-F, 5-CF ₃
A-1025	3-Cl	2-F, 5-CF ₃
A-1026	3-CH ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1027	3-CF ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1028	3-OCH ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1029	3-OCF ₃	2-F, 5-CF ₃
A-1030	3-F	3-F, 4-CF ₃
A-1031	3-Cl	3-F, 4-CF ₃
A-1032	3-CH ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1033	3-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1034	3-OCH ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1035	3-OCF ₃	3-F, 4-CF ₃
A-1036	3-F	3-Cl, 4-CF ₃
A-1037	3-Cl	3-Cl, 4-CF ₃
A-1038	3-CH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1039	3-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1040	3-OCH ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1041	3-OCF ₃	3-Cl, 4-CF ₃
A-1042	3-F	3-Cl, 4-Cl
A-1043	3-Cl	3-Cl, 4-Cl
A-1044	3-CH ₃	3-Cl, 4-Cl

N.º	(R ¹) _n	(R ²) _m
A-1045	3-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1046	3-OCH ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1047	3-OCF ₃	3-Cl, 4-Cl
A-1048	3-F	3-F, 4-Cl
A-1049	3-Cl	3-F, 4-Cl
A-1050	3-CH ₃	3-F, 4-Cl
A-1051	3-CF ₃	3-F, 4-Cl
A-1052	3-OCH ₃	3-F, 4-Cl
A-1053	3-OCF ₃	3-F, 4-Cl
A-1054	3-F	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1055	3-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1056	3-CH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1057	3-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1058	3-OCH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl
A-1059	3-OCF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl

JPT

Tabla 2

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-2 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

5

Tabla 3

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-3 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

10

Tabla 4

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-4 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

15

Tabla 5

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-5 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

20

Tabla 6

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-6 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

25

Tabla 7

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-7 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 8

5

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-8 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 9

10

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-9 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 10

15

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-10 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 11

20

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-11 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 12

25

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-12 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 13

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-13 y la combinación de

5 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 14

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-14 y la combinación de

10 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 15

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-15 y la combinación de

15 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 16

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-16 y la combinación de

20 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 17

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-17 y la combinación de

25 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 18

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-18 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

5 Tabla 19

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-19 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

10 Tabla 20

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-20 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

15 Tabla 21

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-21 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

20 Tabla 22

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-22 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

25 Tabla 23

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-23 y la combinación de

179

$(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 24

- 5 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-24 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 25

- 10 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-25 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 26

- 15 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-26 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 27

- 20 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-27 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 28

- 25 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-28 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 29

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-29 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

5

Tabla 30

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-30 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

10

Tabla 31

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-31 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

15

Tabla 32

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-32 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

20

Tabla 33

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-33 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

25

Tabla 34

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-34 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 35

5

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-35 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 36

10

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-36 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 37

15

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-37 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 38

20

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-38 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 39

25

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-39 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 40

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-40 y la combinación de

5 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 41

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-41 y la combinación de

10 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 42

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-42 y la combinación de

15 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 43

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-43 y la combinación de

20 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 44

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-44 y la combinación de

25 $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 45

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-45 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

5 Tabla 46

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-46 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

10 Tabla 47

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-47 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

15 Tabla 48

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-48 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

20 Tabla 49

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-49 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

25 Tabla 50

Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-50 y la combinación de

$(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 51

- 5 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-51 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 52

- 10 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-52 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 53

- 15 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-53 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 54

- 20 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-54 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

Tabla 55

- 25 Compuestos de la fórmula (I.A), donde Q denota Q-55 y la combinación de $(R^1)_n$ y $(R^2)_m$ en cada caso corresponde a una fila de la Tabla B.

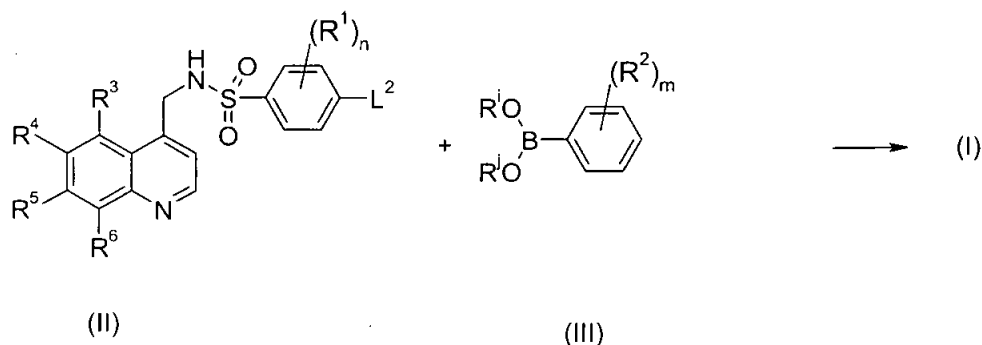
Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención se pueden preparar por diversas vías en analogía con procesos de la técnica previa conocidos per se para preparar compuestos bifenilos. Ventajosamente, se pueden obtener tal como se reseña en los esquemas 1 y 2.

5

En general, los compuestos de quinolina de la fórmula (I) se pueden preparar por reacción de un compuesto de la fórmula (II) con un derivado de ácido borónico de la fórmula (III) por acoplamiento de Suzuki tal como se muestra en el esquema 1.

10

Esquema 1:



15

En el esquema 1, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, n$ y m son tal como se definió anteriormente, R^i y R^j son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , o R^i y R^j juntos forman un residuo 1,2-etileno o 1,2-propileno, cuyos átomos de carbono pueden ser no sustituidos o pueden estar sustituidos en todo o en parte por grupos metilo, y L^2 es un grupo saliente adecuado.

20

Los grupos hábiles adecuados L^2 son halógenos, de preferencia cloro, bromo o yodo, alquilcarboxilato, benzoato, alquilsulfonato, haloalquilsulfonato o arilsulfonato, con mayor preferencia cloro o bromo.

La reacción generalmente se lleva a cabo en presencia de una base y un catalizador, en particular un catalizador de paladio, tal como por ejemplo se describe en la siguiente literatura: Synth. Commun. Vol. 11, p. 513 (1981); Acc. Chem. Res. Vol. 15, pp. 178-184 (1982); Chem. Rev. Vol. 95, pp. 2457-2483 (1995); Organic Letters Vol. 6 (16), p. 2808 (2004); "Metal catalyzed cross coupling reactions", 2º Edición, Wiley, VCH 2005 (Eds. De Meijere, Diederich); "Handbook of organopalladium chemistry for organic synthesis" (Eds Negishi), Wiley, Interscience, Nueva York, 2002; "Handbook of functionalized organometallics", (Ed. P. Knochel), Wiley, VCH, 2005.

Los catalizadores adecuados son tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0); cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II); cloruro de bis(acetonitrilo)paladio (II); complejo de cloruro de [1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]-paladio (II)/cloruro de metileno (1:1); bis[bis-(1,2-difenilfosfina)etano]paladio (0); cloruro de bis(bis-(1,2-difenilfosfina)butano)-paladio (II); acetato de paladio (II); cloruro de paladio (II); y complejo de acetato de paladio (II) /tri-o-tolilfosfina o las mezclas de sales de fosfinas y Pd o complejos de fosfinas y Pd, por ejemplo, dibencilidenacetona-paladio y tri-ter-butilfosfina (o su tetrafluoroborato), trisciclohexilfosfina; o un sistema catalizador de Pd ligado a polímero-trifenilfosfina.

Las bases adecuadas son, en general, compuestos inorgánicos, tales como óxidos de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como óxido de litio, óxido de sodio, óxido de calcio y magnesio, carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio y carbonato de calcio, y también bicarbonatos de metales alcalinos, tales como bicarbonatos de sodio, alcóxidos de

187

metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, etóxido de potasio y ter-butóxido de potasio, además de bases orgánicas, por ejemplo aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, y también aminas bicíclicas. Son de particular preferencia las bases tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, trietilamina y bicarbonato de sodio.

La base se utiliza en una relación molar de 1:1 a 1:10, de preferencia 1:1,5 a 5 respecto de 1 mol de los compuestos (II), el ácido borónico se utiliza en una relación molar de 1:1 a 1: 5, de preferencia una relación molar de 1:1 a 1:2,5 con respecto de 1 mol de los compuestos (II). En algunos casos puede ser beneficioso para facilitar la purificación usar el ácido borónico en una cantidad subestequiométrica de 0,7:1 a 0,99:1, respecto de 1 mol de compuesto (II).

15

La reacción generalmente se lleva a cabo en un disolvente orgánico inerte. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano y éter de petróleo, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, o, m y p-xileno, éteres tales como éter diisopropílico, éter ter-butilico, éter metílico, dioxano, anisol y tetrahidrofurano y dimetoxietano, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona y ter-butilmetilcetona, y también dimetilsulfóxido, dimetilformamida y dimetilacetamida, con particular preferencia éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano y dimetoxietano. También es posible usar mezclas de los disolventes mencionados, o mezclas con agua.

25

La reacción usualmente se lleva a cabo a temperaturas de 20 °C a 180 °C, de preferencia de 40 °C a 120 °C.

188

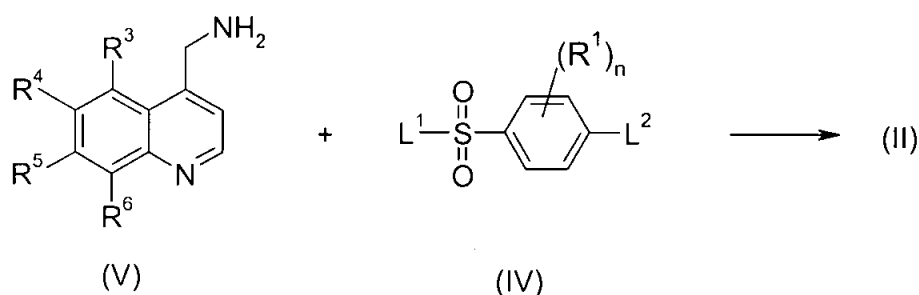
Después de completar la reacción, los compuestos de la fórmula (I) se pueden aislar mediante métodos convencionales tales como la adición de la mezcla de reacción a agua, la extracción con un disolvente orgánico, la
5 concentración del extracto y similares. Los compuestos aislados (I) se pueden purificar mediante una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, de ser necesario.

También es posible agregar un secuestrante a las mezclas de reacción para
10 remover subproductos o material de inicio que no haya reaccionado, al fijarse a ellos y luego por simple filtración. Para detalles ver "Synthesis and purification catalog", Argonaut, 2003 y la literatura allí citada.

Los ácidos o ésteres borónicos (III) están disponibles en el comercio o se
15 pueden preparar de acuerdo con "Science of Synthesis" Vol. 6, Thieme, 2005; WO 02/042275; Synlett 2003, (8) p.1204; J. Org. Chem., 2003, 68, p. 3729, Synthesis, 2000, p.442, J. Org. Chem., 1995, 60, p. 750; o "Handbook of functionalized organometallics", (Ed. P. Knochel), Wiley, VCH, 2005.

20 Los compuestos (II) se pueden obtener por reacción de sulfonilcloruros (IV) con quinolinas (V) tal como se muestra en el esquema 2.

Esquema 2



En el esquema 2, L^2 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , n y m son tal como se definió anteriormente, y L^1 es un grupo saliente como por ejemplo hidroxilo o halógeno, de preferencia cloro.

La reacción de un cloruro de sulfonilo (IV) con una quinolina (V) se puede llevar a cabo de acuerdo con métodos estándar de química orgánica, ver, por ejemplo, Lieb. Ann. Chem. P. 641, 1990, o el documento WO 2005/033081

Esta reacción usualmente se lleva a cabo en un disolvente orgánico inerte. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano y éter de petróleo, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, o, m y p-xileno, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo y clorobenceno, éteres tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter terc-butilmetílico, dioxano, anisol y tetrahydrofurano, nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, dietilcetona y terc-butilmetilcetona, y también dimetilsulfóxido, dimetilformamida y dimetilacetamida, de preferencia tetrahydrofurano, éter metil-terc-butílico, cloruro de metileno, cloroformo, acetonitrilo, tolueno o dimetilformamida. También es posible usar mezclas de los disolventes mencionados.

Puede ser ventajoso llevar a cabo la reacción en presencia de una base. Las bases adecuadas son, en general, compuestos inorgánicos, tales como

hidróxidos de metales alcalinos y de metales alcalinotérreos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio, óxidos de metal álcali y metal alcalinotérreo, tal como óxido de litio, óxido de sodio, óxido de calcio y óxido de magnesio, hidruros de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, hidruro de calcio, carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, y también bicarbonatos de metales alcalinos, tales como bicarbonato de sodio, más aún bases orgánicas, por ejemplo aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, y también aminas bicíclicas. Se da particular preferencia a piridina, trietilamina y carbonato de potasio. Las bases generalmente se emplean en cantidades equimolares, en exceso o, si corresponde, como disolvente. El exceso de base generalmente es de 0,5 a 5 equivalentes molares respecto de 1 mol de compuestos (V).

En general, la reacción se lleva a cabo a temperaturas de -30° C a 120° C, de preferencia de -10° C a 100° C.

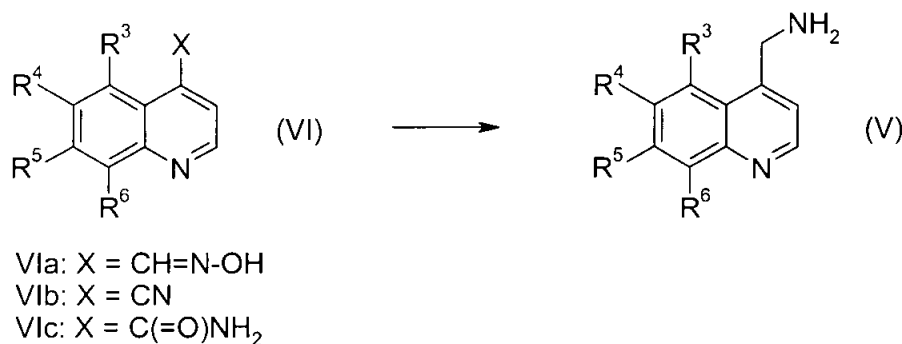
Los materiales de inicio en general se hacen reaccionar entre sí en cantidades equimolares.

Si no se dispone de cloruros de sulfonilo (IV) en el comercio, se pueden obtener de acuerdo con procedimientos conocidos en la técnica.

Las quinolinas (V) se conocen de la literatura o están disponibles en el comercio (por ejemplo: 4-metilenaminoquinolina: CAS-N.º 5632-13-3; 6-cloro-4-

metilenaminoquinolina: CAS-N.º 859814-05-5; 6-metoxi-4-metilenaminoquinolina: CAS-N.º 708261-71-6; 8-hidroxi-4-metilenaminoquinolina: CAS-N.º 33976-91-9; 6-metoxi-8-cloro-4-metilenaminoquinolina: CAS-N.º 857207-07-9), o se pueden preparar a partir de precursores de quinolina (VI) en donde X se define en el

5 siguiente esquema por reducción:



Los métodos de esta reducción se pueden hallar en la literatura, por ejemplo en Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968; Band 11/2, 1957; Band E5, 1985; J. Heterocycl. Chem., 1997, 34 (6), pp. 1661-1667; J. Chem. Soc. 1954, p. 1165; Heterocycles, 41(4), pp. 675-688, 1995; J. Org. Chem., 1982, 47, p. 3153; Heterocycles, 1996, 43 (9), pp.1893-1900; J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8), pp. 695-697, 1994; o son conocidos por los expertos en la técnica.

Las oximas (VIa) se pueden preparar a partir de su respectivo aldehído (X=CHO; compuestos (VI d)) o el metilderivado (X=CH₃; compuestos (VI e)), tal como se describe en Houben-Weyl, Band 10/4, Thieme, Stuttgart, 1968; Band 11/2, 1957; Band E5, 1985; J. Prakt. Chem-Chem. Ztg. 336(8), pp. 695-697, 1994; Tetrahedron Lett. 42(39), pp.6815-6818, 2001; o Heterocycles, 29(9), pp.1741-1760, 1989.

Los aldehídos (VI d) están disponibles en el comercio (por ejemplo 6-cloro-4-

quinolincarbaldehído, 7-metoxi-4-quinolincarbaldehído, quinolin-4-carbaldehído) o se pueden sintetizar a partir de una 4-metilquinolina tal como se reseña en J. Org. Chem. 51(4), pp. 536-537, 1986, o de un haloderivado (X = halógeno, compuestos (VIf)) tal como se muestra en Eur. J. Org. Chem., 2003, (8), pp. 1576-1588; 5 Tetrahedron Lett. 1999, 40 (19), pp. 3719-3722; Tetrahedron, 1999, 55 (41), pp. 12149-12156.

El derivado metilo (VIe) está disponible en el comercio (por ejemplo 6-cloro 4-metilquinolina; 6,8-dimetoxi-quinolina) o se puede sintetizar de acuerdo con 10 "Science of Synthesis", Vol 15, Thieme, Stuttgart, 2005.

Los nitrilos (VIb) se pueden preparar a partir del respectivo derivado halogenado (VIf) (X = halógeno, preferiblemente cloro, bromo o yodo) por reacción con una fuente de cianuro con o sin catalizadores adicionales, tal como se 15 describe por ejemplo en Tetrahedron Lett. 42(38), pp. 6707-6710, 2001; Chem. Eur. J., 2003, 9 (8), pp. 1828-1836; Chem. Commun. (Cambridge), 2004, (12), pp. 1388-1389; J. Organomet. Chem. 2004, 689 (24), pp. 4576-4583; o J. Chem. Soc. Perk. T., 1 (16), pp. 2323-2326, 1999. Alternativamente, la amida o la oxima se 20 pueden deshidratar al correspondiente nitrilo (VIb) tal como se reseña en "Synthesis", Stuttgart, (10), pp. 943-944, 1992; o la literatura allí citada; o Heterocycl. Chem. 1997, 34 (6), pp. 1661-1667.

Las 4-halogenoquinolinas (VIf) están disponibles en el comercio o se pueden sintetizar de acuerdo con "Science of Synthesis", Vol 15, Thieme, 25 Stuttgart, 2005 o por ejemplo de acuerdo con la siguiente literatura o sus citas: 4-cloro-6,7-dimetoxi-quinolina: Journal Med. Chem. 48(5), p. 1359, 2005; 4-cloro-5,7-dicloro-quinolina: Indian, 187817, 29 Jun 2002; 4-cloro-7-cloro-quinolina:

Tetrahedron, 60 (13), p. 3017, 2004; 4-cloro-7-trifluorometil-quinolina; Tetrahedron
lett., 31(8), p. 1093, 1990; 4-cloro-7,8-dimetoxi-quinolina: Tetrahedron, 41 (15),
p.3033, 1985; 4-cloro-8-metoxi quinolina: Chem. Berichte 118(4), p.1556, 1985; 4-
cloro-(6 o 7 o 8)-yodoquinolina, 4-bromo-(6 o 7 o 8)-yodo-quinolina, 4-iodo-(6 o 7 o
5 8)-yodo-quinolina: J. Med. Chem., 21(3), p. 268, 1978.

Se pueden encontrar métodos adicionales para construir precursores
apropiados o modificar el patrón de sustitución en "Synthesis", Stuttgart (1), pp.
31-32, 1993; Tetrahedron, 1993, 49 (24), pp. 5315-5326; "Methods in Science of
10 Synthesis", Band 15, y la literatura allí citada; Bioorg. Med. Chem. Lett. 1997, 7
(23), pp. 2935-2940; J. Am. Chem. Soc., 1946, 68, p. 1264; o Org. Synth. 1955, III,
p. 272.

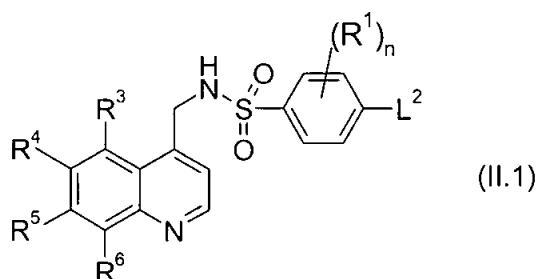
Los N-óxidos se pueden preparar a partir de los compuestos (I) de acuerdo
15 con métodos de oxidación convencionales, por ejemplo al tratar un compuesto (I)
con un perácido orgánico tal como ácido metacloroperbenzoico [Journal of
Medicinal Chemistry, 38(11), 1892-1903 (1995); WO 03/64572] o con agentes
oxidantes inorgánicos tales como peróxido de hidrógeno, [ver Journal of
Heterocyclic Chemistry, 18(7), 1305-8 (1981)] u oxona, ver Journal of the
20 American Chemical Society, 123(25), 5962-5973 (2001).

En algunos casos puede ser benéfico en términos de facilidad de trabajo o
purificación realizar la reducción de los compuestos (VI) a compuestos (V) y la
reacción de la amina (V) con el compuesto (IV) en un recipiente sin aislar los
25 compuestos (V).

Algunos de los intermediarios de la fórmula (II) son nuevos. Estos también

son objeto de la presente invención.

Especialmente, los intermediarios de la fórmula (II.1) son objeto de la presente invención:



5

en donde

L^2 es cloro, bromo o yodo, y

10 n , R^1 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 tienen los significados definidos anteriormente para los compuestos de la fórmula (I), especialmente aquellos dados como preferidos.

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

La preparación de los compuestos de la fórmula (I) puede conducir a su obtención como mezclas de isómeros (estereoisómeros, enantiómeros). Si se desea, estos se pueden resolver por los métodos adecuados para este propósito,
20 tales como cristalización o cromatografía, también adsorbato ópticamente activo, para dar los isómeros puros.

Debido a su excelente actividad, los compuestos de la fórmula general (I) además de sus N-óxidos y sus sales se pueden utilizar para controlar plagas

195

animales, seleccionadas de insectos, arácnidos o nematodos dañinos.

De acuerdo con lo anterior, la invención se relaciona adicionalmente con una composición agrícola para combatir tales plagas animales, que comprenden
5 tal cantidad de por lo menos un compuesto de la fórmula general (I), un N-óxido o una de sus sales agronómicamente aceptables, y por lo menos un portador líquido y/o sólido inerte agronómicamente aceptable con acción pesticida y, si se desea, por lo menos un agente tensoactivo.

10 Tal una composición puede contener un único compuesto activo de la fórmula (I), un N-óxido o una de sus sales agronómicamente aceptables, o una mezcla de varios compuestos activos de la fórmula (I), N-óxidos o sus sales agronómicamente aceptables de acuerdo con la presente invención.

15 Los compuestos de la fórmula (I), además de sus N-óxidos o sus sales agronómicamente aceptables y las composiciones pesticidas que los comprenden son efectivos agentes para controlar plagas de artrópodos y nematodos. Las plagas animales controladas por los compuestos de la fórmula (I) incluyen por ejemplo

20 Insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*,
25 *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*,

- Grapholitha funebrana, Grapholitha molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella,
- 5 Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Phalera bucephala, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scabra, Plutella xylostella, Pseudoplusia
- 10 includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumtopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni y Zeiraphera canadensis;
- 15 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,
- 20 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
- 25 oryzophilus, Melanotus communis, 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;

dípteros (Diptera), por ejemplo Aedes aegypti, Aedes vexans, Anastrepha
5 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, Haplodiplosis equestris, Hylemyia platura, Hypoderma lineata,
10 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 paludosa;

15

ácaros (Thysanoptera), por ejemplo Dichromothrips corbetti, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi y Thrips tabaci;

20 himenópteros (Hymenoptera), por ejemplo Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata y Solenopsis invicta;

heterópteros (Heteroptera), por ejemplo Acrosternum hilare, Blissus
25 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;

homópteros (Homoptera), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges*
laricis, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*,
5 *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 horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon*
fragaefolii, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*,
10 *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis*
pyri, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum*
avenae, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*,
Melanaphis pyrarius, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus*
ascalonicus, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*,
15 *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon*
humuli, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*,
Rhopalosiphum padi, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*,
Schizaphis graminum, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella*
furcifera *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, y *Viteus vitifolii*;

20

termitas (Isoptera), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*,
Reticulitermes flavipes, *Reticulitermes lucifugus* y *Termes natalensis*;

ortópteros (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*,
25 *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* y *Tachycines asynamorus*;

Arácnidos, por ejemplo arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias

5 *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*,
Amblyomma variegatum, *Argas 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*,

10 *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp. tales como *Aculus*
schlechtendali, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp.
tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp.
tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tales como *Tetranychus*
cinnabarinus, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y

15 *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *oligonychus pratensis*;

Sifonótera, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.;

Las composiciones y los compuestos de la fórmula (I) son útiles para el control de

nematodos, especialmente nematodos parasiítico vegetales tales como

20 nematodos de la raíces, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne*
javanica, y otras especies de *Meloidogyne*;

Nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras

especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera*

25 *schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nematodos de

semillas, especies *Anguina*; nematodos del tallo y foliares, especies

Aphelenchoides; nematodos picadores, *Belonolaimus longicaudatus* y otras

especies de *Belonolaimus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos anulares, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos del tallo y del bulbo, *Ditylenchus destructor*,
5 *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos punzantes, especies de *Dolichodorus*; nematodos espiralados, *Heliocotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de vaina, especies de *Hemicyclophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especies *Hoploaimus*; nematodos de raíz falsas, especies de
10 *Nacobbus*; nematodos de agujas, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de pica, especies de *Paratylenchus*; nematodos de lesiones, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos rugosos, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos reniformes,
15 *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz troncosa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrachodorus*; nematodos rígidos, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos de daga, especies
20 *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parásitas en plantas.

En una modalidad de preferencia de la invención, los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales agrónómicamente aceptables se utilizan para controlar artrópodos, tales como insectos o arácnidos, en particular insectos de los
25 órdenes Lepidóptera, Coleóptera y Homóptera y arácnidos del orden Acarina. Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Thysanoptera y

Homoptera.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos, sus sales agronómicamente aceptables, o las composiciones pesticidas que los comprenden se pueden utilizar para proteger plantas y cultivos en crecimiento contra el ataque o la infestación por plagas animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos al poner en contacto la planta/cultivo con una cantidad pesticidamente efectiva de compuestos de la fórmula (I). El término "cultivo" se refiere a los cultivos en crecimiento y cosechados.

10

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales agronómicamente aceptables se pueden convertir en las formulaciones adaptadas, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvillos, polvos, pastas y gránulos. La forma de uso depende del objetivo particular pretendido; en cada caso, éste debe asegurar una distribución fina y uniforme del compuesto de acuerdo con la invención.

15

Las formulaciones se preparan en una forma conocida (ver por ejemplo como revisión el documento US 3.060.084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dic. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4º Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes. Los documentos WO 91/13546, US 4.172.714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8ºEd., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2.

20

25

D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo al extender el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desean emulsificantes, agentes tensoactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespuma, agentes anticongelantes, formulaciones para el tratamiento para semillas, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificación.

Los ejemplos de disolventes adecuados son agua, disolventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidonas [NMP], N-octil-pirrolidona [NOP]), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. En principio, también se pueden utilizar mezclas de disolventes.

Los emulsificantes adecuados son emulsificantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo ésteres de alcohol graso de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Los ejemplos de dispersantes son licores de residuos de sulfito de lignina y metilcelulosa.

Los tensoactivos adecuados utilizados son las sales de metales alcalinos, metales alcalinotérreos y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalensulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalensulfónico, alquilarilsulfonatos,

alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes ácidos, ácidos grasos y éteres de alcohol ácido de sulfato de glicol, además de condensados de naftalensulfonato y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, éter
5 octilfenolpolioxietileno, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, éteres de alquilfenolpoliglicol, éter tributilfenilpoliglicol, éter triestearilfenilpoliglicol, alcoholes alquilarilpoliéter, condensados de alcohol y alcohol ácido/óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, éteres de polioxietilenalquilo, polioxipropileno etoxilado, acetaléter de laurilalcoholpoliglicol, ésteres de sorbitol, licores de desechos de
10 lignosulfito y metilcelulosa.

Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite para rocío directo son las fracciones de aceite mineral con punto de ebullición medio a elevado, tales como queroseno
15 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, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes altamente polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona o
20 agua.

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

25 Los agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes basados en estearado de silicio o magnesio.

Un conservante adecuado es por ejemplo diclorofeno.

Las formulaciones para el tratamiento para semillas también pueden comprender aglutinantes y opcionalmente colorantes.

5

Se pueden agregar aglutinantes, para mejorar la adhesión de los materiales activos en las semillas después de tratamiento. Los aglutinantes adecuados son tensoactivos EO/PO de copolímeros de bloque pero también alcoholes de polivinilo, povidona, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, acetato de polivinilo, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

10

Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o tinturas adecuados para las formulaciones para tratamiento para semillas son Rhodamin B, C.I. pigmento rojo 112, C.I. disolvente rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento café 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

20

ejemplo de un agente gelificación es carragenina (Satiagel®).

25

Se pueden preparar polvos, materiales para dispersión y productos

pulverizables al mezclar o al moler concomitantemente las sustancias activas con un portador sólido.

Se pueden preparar gránulos, por ejemplo, los gránulos recubiertos,
5 gránulos impregnados y gránulos homogéneos, al unir los compuestos activos a portadores sólidos.

Los ejemplos de portadores sólidos son tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, arcilla attaclay, piedra caliza, cal, tiza, bolo, loess,
10 arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores
15 sólidos.

En general, las formulaciones comprenden del 0,01 al 95% en peso, preferiblemente del 0,1 al 90% en peso, de los compuestos activos. En este caso, los compuestos activos se emplean con una pureza del 90% al 100% en peso,
20 preferiblemente del 95% al 100% en peso (de acuerdo con el espectro RMN).

Para propósitos de tratamientos para semillas, las respectivas formulaciones se pueden diluir 2-10 veces para producir concentraciones de preparaciones listas para usar del 0,01 al 60% en peso de compuesto activo en
25 peso, preferiblemente del 0,1 al 40% en peso.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales

agronómicamente aceptables se pueden utilizar como tales, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de ellas, por ejemplo, en la forma de soluciones directamente dispersables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones aceitosas, pastas, productos pulverizables, 5 materiales de dispersión, o gránulos, por medio de rociado, atomización, pulverización, dispersión o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los propósitos pretendidos; pretenden asegurar en cada caso la distribución más fina posible del o de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

10 Se pueden preparar las formas de uso acuosas a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos rociables, dispersiones en aceite) al agregar agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente, se pueden homogeneizar en agua por medio de un humectante, un espesante, un 15 dispersante o un emulsificante. Sin embargo, también es posible preparar concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, espesante, dispersante o emulsionante y, si es apropiado, disolvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

20 Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones listas para uso pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, están entre 0,0001 a 10%, preferiblemente entre 0,01 a 1% en peso.

Los compuestos activos también se pueden utilizar exitosamente en el 25 proceso de volumen ultrabajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de compuesto activo, o aún aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

1. Productos para la dilución con agua para aplicaciones foliares. Para
5 propósitos de tratamiento para semillas, estos productos se pueden aplicar a las
semillas diluidas o no diluidas.

A) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)

10 10 partes en peso del o de los compuestos activos se disuelven en
90 partes en peso de agua o en un disolvente hidrosoluble. Como una alternativa,
se agregan humectantes u otros auxiliares. El compuesto activo se disuelve luego
de dilución con agua, por lo cual se obtiene una formulación con 10% (p/p) de
compuestos activos.

15

B) Concentrados dispersables (DC)

20 20 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 70
partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un
dispersante, por ejemplo, povidona. La dilución con agua da una dispersión, por lo
cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de los compuestos activos.

C) Concentrados emulsionables (EC)

25 15 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 7 partes en
peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de
aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). La dilución con agua da una

emulsión, con lo cual se obtiene una formulación con el 15% (p/p) de los compuestos activos.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

5

25 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilmencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de un emulsificador (por ejemplo, Ultraturax) y se prepara una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, con lo cual se obtiene una formulación con el 25% (p/p) de los compuestos activos.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

15

En un molino de bolas agitado, se muelen 20 partes en peso de los compuestos activos con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para dar una suspensión de los compuestos activos finos. La dilución con agua da una suspensión estable de los compuestos activos, con lo cual se obtiene una formulación con el 20% (p/p) de los compuestos activos.

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

25

50 partes en peso de los compuestos activos se trituran finamente con adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se preparan

gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de rociado, lecho fluido). La dilución con agua da una dispersión estable o solución de los compuestos activos, con lo cual se obtiene una formulación con el 50% (p/p) de los compuestos activos.

5

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

75 partes en peso de los compuestos activos se muelen en un molino con rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersante, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una solución o dispersión estable de los compuestos activos, con lo cual se obtiene una formulación con el 75% (p/p) de los compuestos activos.

15 H) Formulación en gel (GF)

En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso de los compuestos activos con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un humectante de agente gelante y 70 partes en peso de agua o de un disolvente orgánico para dar una suspensión de compuestos activos finos. La dilución con agua da una suspensión estable de los compuestos activos, con lo cual se obtiene una formulación con el 20% (p/p) del o de los compuestos activos.

2. Productos para ser aplicados sin diluir para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento para semillas, tales productos se pueden aplicar a las semillas diluidas o sin diluir.

I) Polvos para formar polvillo (DP, DS)

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

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

0,5 partes en peso de los compuestos activos se muelen finamente y se asocian con 95,5 partes en peso de portadores, con lo cual se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) de compuestos activos. Los métodos actuales son extrusión, secado por rocío o lecho fluido. Esto da gránulos para ser aplicados sin diluir para un uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

10 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo, xileno. Esto da un producto que tiene un 10% (p/p) de compuestos activos, que se aplica sin diluir para uso foliar.

20

Los compuestos de la fórmula (I) también son adecuados para el tratamiento para semillas. Las formulaciones convencionales para el tratamiento para semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos hidrosolubles SS y emulsiones ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla, diluidas o sin diluir. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de sembrar, ya sea directamente

sobre las semillas o después de que éstas han pregerminado.

En una modalidad preferida, se utiliza una formulación FS para el tratamiento de la semilla. Generalmente, la formulación FS puede comprender 1-
5 800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de tensoactivo, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferiblemente agua.

Otras formulaciones FS preferidas de compuestos de la fórmula (I) para el
10 tratamiento para semillas comprenden del 0,5 al 80% en peso del ingrediente activo, del 0,05 al 5% en peso de un humectante, del 0,5 al 15% en peso de un agente dispersante, del 0,1 al 5% en peso de un espesante, del 5 al 20% en peso de un agente anticongelante, del 0,1 al 2% en peso de un agente antiespumante, del 1 al 20% en peso de un pigmento y/o una tintura, del 0 a 15% en peso de un
15 adhesivo/agente de adhesión, del 0 al 75% en peso de un relleno/vehículo y del 0,01 al 1% en peso de un conservante.

Se pueden agregar diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas a los ingredientes activos, si
20 resulta apropiado inmediatamente antes de usar (mezcla en tanque). Estos agentes generalmente se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales
25 agronómicamente aceptables, son efectivos tanto por contacto (a través del suelo, vidrio, pared, lecho, carpeta, partes de plantas o partes de animales) como por ingestión (cebo o parte de planta).

Para uso contra hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas, los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales agronómicamente aceptables preferiblemente se utilizan en una composición de
5 cebo.

El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden formar dándoles diferentes diseños y en formas que resulten adecuadas para la respectiva aplicación, por ejemplo,
10 gránulos, bloques, varillas, discos. Los cebos líquidos se pueden colocar dentro de diversos dispositivos para asegurar una aplicación adecuada, por ejemplo, recipientes abiertos, dispositivos en aerosol, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles se pueden basar en matrices acuosas o aceitosas, y se pueden formular para responder a las necesidades particulares en términos de
15 adhesividad, retención de humedad o características de envejecimiento.

El cebo empleado en la composición es un producto que es lo suficientemente atractivo como para incitar a insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc., o cucarachas a comerlo. El
20 atractivo se puede manejar al utilizar estimulantes de alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes de alimentación se eligen, por ejemplo, aunque no de manera exclusiva, entre proteínas de origen animal y/o vegetal (carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), entre grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, en especial de
25 sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o putrefactas de frutas, cereales, plantas, animales, insectos o partes específicas de ellos también pueden servir como estimulante de

alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y se conocen por los expertos en la técnica.

5 Las formulaciones de compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales agronómicamente aceptables, tales como aerosoles (por ejemplo, envases de aerosol), aerosoles aceitosos o aerosoles de bomba, son muy adecuados para el usuario no profesional a fin de controlar plagas tales como moscas, pulgas, ácaros, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol preferiblemente están

10 compuestas del compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo, kerosenos) con rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, sulfóxido de dimetilo (DMSO), hidrocarburos aromáticos tales como tolueno,

15 xileno, agua, otros auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleílo con 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites perfumantes tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromático, si resulta apropiado estabilizantes tales como benzoato de sodio, tensoactivos anfóteros,

20 epóxidos inferiores, ortoformato de trietilo y, si se requiere, propulsores tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, éter de dimetilo, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones en aerosol aceitoso difieren en que no se utilizan

25 propulsores.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales

agronómicamente aceptables y sus respectivas composiciones también se pueden utilizar en mosquitos y rollos, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores de larga duración para fumigación y además en papeles para polillas, almohadillas para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes
5 del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales
10 agronómicamente aceptables y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento de las superficies de chozas y viviendas, la pulverización al aire y la impregnación de cortinas, tiendas, prendas de vestir, mosquiteros de cama, trampas para moscas tse-tse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicar a fibras, telas, artículos de lana, a prendas
15 no tejidas, material de red o láminas y toldillos preferiblemente comprende una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y por lo menos un aglutinante. Los repelentes adecuados son, por ejemplo, N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexen-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-
20 hexandiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos vegetales en bruto de plantas como Eucaliptus maculata, Vitex
25 rotundifolia, Cimbopogan martinii, Cimbopogan citratus (pasto de limón), Cimbopogan nardus (citronella). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres de vinilo de ácidos alifáticos (tales

como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y di-etilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

5

La impregnación de cortinas y mosquiteros de cama se realiza en general al sumergir el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o rociándolo sobre las redes.

10

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y/o sus sales veterinariamente aceptables en particular también son adecuados para combatir parásitos en y sobre animales.

Un objetivo de la presente invención es por lo tanto también proporcionar
15 nuevos métodos para controlar parásitos en y sobre animales. Otro objetivo de la invención es proporcionar adicionalmente pesticidas más seguros para los animales. Otro objetivo de la invención es proporcionar adicionalmente pesticidas para animales que se puedan usar en dosis más bajas que los pesticidas existentes. Y otro objetivo de la invención es proporcionar pesticidas para
20 animales que aseguren un prolongado control residual de los parásitos.

La invención también se relaciona con composiciones que contienen una cantidad parasiticidamente efectiva de los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales veterinariamente aceptables y un portador aceptable, para
25 combatir parásitos en y sobre animales.

La presente invención también se relaciona con un método para tratar,

controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación y la infección por parásitos, que comprende la administración o aplicación oral, tópica o parenteral a los animales de una cantidad parasiticidamente efectiva de un compuesto de la fórmula (I), un N-óxido o su sal veterinariamente aceptable de dicho compuesto, o
5 una composición que lo comprende.

La invención también se relaciona con un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o la infección por parásitos, que comprende una cantidad
10 parasiticidamente efectiva de un compuesto de la fórmula (I), un N-óxido o una sal veterinariamente aceptable de dicho compuesto, o una composición que lo comprende.

La actividad de los compuestos contra las plagas agrícolas no sugiere que
15 sean adecuados para controlar endo y ectoparásitos en y sobre animales, lo cual requiere, por ejemplo, de dosis bajas y no eméticas en el caso de la aplicación oral, de compatibilidad metabólica con el animal, de baja toxicidad y de un manejo seguro.

20 Sorprendentemente, en la actualidad se descubre que los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos y sus sales veterinariamente aceptables son adecuados para combatir endo y ectoparásitos en animales o sobre ellos.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales
25 veterinariamente aceptables y las composiciones que los comprenden preferiblemente se utilizan para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (incluido el ser humano) y

peces. Son adecuados, por ejemplo, para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos, tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, lechones, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de la India, burros, gamos y renos, y también en animales con pelaje, tales como visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos, y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguila.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales veterinariamente aceptables, y las composiciones que los comprenden, preferiblemente se utilizan para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, aunque sin limitaciones, piojos, piojos mordedores, ácaros, moscas de la nariz, garrapatas, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales veterinariamente aceptables y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o endoparásitos. Ellos son activos contra todos o algunos estadios de desarrollo.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales veterinariamente aceptables son por lo tanto especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales

veterinariamente aceptables son por lo tanto especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

pulgas (Siphonaptera), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides*
5 *canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus*
fasciatus,

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

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*,
Aedes vexans, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*,
Anopheles albimanus, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles*
15 *leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Callifora vicina*,
Chrysomya bezziana, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops*
discalis, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cocliomyia hominivorax*,
Cordilobia anthropophaga, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*,
Culex quinquefasciatus, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*,
20 *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*
25 *argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulio mixtum*,
Sarcophaga haemorrhoidalis, *Sarcophaga* sp., *Simulio vittatum*, *Stomoxys*
calcitrans, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,

piojos (Phtiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurytetrus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y

5 *Solenopotes capillatus*.

garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*

10 y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*;

Actinidia (Prostigmata) y *Acaridida* (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp.,

15 *Cheiletiella* spp., *Ornithocheiletiella* 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., y *Laminosioptes* spp;

20

chinches (Heteropterida): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongilus* spp. y *Arilus critatus*,

Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus*

25 spp., *Pthirus* spp., y *Solenopotes* spp;

Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* y *Ischnocerina*), por ejemplo

Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp.,
Lepikentron spp., Trichodectes spp., y Felicola spp;

Nematodos Áscaris:

5

Tricocéfalos y Triquinosis (Trichosyringida), por ejemplo Trichinellidae
(Trichinella spp.), (Trichuridae) Trichuris spp., Capillaria spp;

10 Rhabditida, por ejemplo Rhabditis spp, Strongyloides spp., Helicephalobus
spp;

Strongylida, por ejemplo Strongylus spp., Ancylostoma spp., Necator
americanus, Bunostomum spp. (anquilostomas), Trichostrongylus spp.,
Haemonchus contortus., Ostertagia spp., Cooperia spp., Nematodirus spp.,
15 Dictyocaulus spp., Cyathostoma spp., Oesofagostomum spp., Stephanurus
dentatus, Ollulanus spp., Chabertia spp., Stephanurus dentatus, Syngamus
trachea, Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Globocephalus spp., Necator spp.,
Metastrongylus spp., Muellerius capillaris, Protostrongylus spp., Angiostrongylus
spp., Parelaphostrongylus spp. Aleurostrongylus abstrusus, y Dioctophyma renal;

20

Áscaris intestinales (Ascaridida), por ejemplo Ascaris lumbricoides, Ascaris
suum, Ascaridia galli, Parascaris equorum, Enterobius vermicularis (oxiurus),
Toxocara canis, Toxascaris leonine, Skrjabinema spp., y Oxyuris equi;

25

Camallanida, por ejemplo Dracunculus medinensis (gusano de guinea);

Spirurida, por ejemplo Thelazia spp. Wuchereria spp., Brugia spp.,

222

Onchocerca spp., Dirofilaria spp., Dipetalonema spp., Setaria spp., Elaeofores spp., Spirocerca lupi, y Habronema spp.;

Acantocéfalos (Acanthocephala), por ejemplo Acanthocephalus spp.,

5 Macracanthorhynchus hirudinaceus y Oncicola spp.;

Planarias (Platelmintos):

10 Trematodos (Trematoda), por ejemplo Fasciola spp., Fascioloides magna, Paragonimus spp., Dicrocoelium spp., Fasciolopsis buski, Clonorchis sinensis, Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Alaria alata, Paragonimus spp., y Nanocyetes spp.,

15 Cercomeromorfa, en particular Cestoda (cestodos), por ejemplo Difilobothrium spp., Tenia spp., Echinococcus spp., Dipylidium caninum, Multiceps spp., Hymenolepis spp., Mesocystoides spp., Vampirolepis spp., Moniezia spp., Anoplocephala spp., Sirometra spp., Anoplocephala spp., y Hymenolepis spp.

20 Los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que los contienen son de particular utilidad para controlar las plagas de los órdenes Díptera, Sifonáptero e Ixodida.

Más aún, se prefiere en especial el uso de los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales y las composiciones que los contienen para combatir
25 mosquitos.

El uso de los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales y las

223

composiciones que los contienen para combatir moscas también es otra modalidad preferida de la presente invención.

Por otra parte, se prefiere en especial el uso de los compuestos de la
5 fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales y las composiciones que los contienen para combatir pulgas.

El uso de los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales y las
composiciones que los contienen para combatir garrapatas es otra modalidad
10 preferida de la presente invención.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales también son de
utilidad especial para combatir endoparásitos (áscaris, acantocéfalos y planarias).

15 La administración se puede llevar a cabo tanto de modo preventivo como terapéutico.

La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o
en forma de preparaciones apropiadas, por vía oral, tópica/dérmica o parenteral.

20

Para administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de
la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales veterinariamente aceptables se pueden
formular como alimentos animales, premezclas de alimento animal, concentrados
de alimento animal, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, grageas, geles,
25 comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la fórmula (I) sus N-
óxidos o sus sales veterinariamente aceptables se pueden administrar a los
animales en su agua potable. Para la administración oral, la forma de dosificación

seleccionada ha de proporcionar al animal 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula (I), preferiblemente 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

5 De modo alternativo, los compuestos de la fórmula (I) se pueden administrar a animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraluminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula (I) se pueden dispersar o disolver en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. De modo alternativo, los compuestos de la fórmula (I) se
10 pueden formular en un implante para administración subcutánea. Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden administrar a los animales por vía transdérmica. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida se puede proporcionar al animal en 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula (I).

15

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden aplicar tópicamente a los animales en forma de inmersiones, polvillos, polvos, collares, medallones, sprays, champúes, formulaciones en placas y por volcado y en ungüentos o emulsiones aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las
20 inmersiones y sprays contienen usualmente 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferiblemente 1 ppm a 3.000 ppm de los compuestos de la fórmula (I). Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden formular como marcas de orejas para animales, en particular cuadrúpedos, tales como vacas y ovejas.

25 Las preparaciones apropiadas son:

Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración

oral después de diluir, soluciones para usar sobre la piel o en las cavidades corporales, formulaciones de unción dorsal, geles;

Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica;
5 preparaciones semisólidas;

Formulaciones en las que el compuesto activo se procesa en una base de ungüento o en una base de emulsión aceite en agua o agua en aceite;

10 Las preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, glóbulos, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados con contenido de compuesto activo.

Las composiciones apropiadas para inyección se preparan por disolución
15 del ingrediente activo en un disolvente apropiado y opcionalmente adición de otros ingredientes tales como ácidos, bases, sales tampón, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se envasan bajo esterilidad.

Los disolventes apropiados son disolventes fisiológicamente tolerables tales
20 como agua, alcoholes tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona, y mezclas de ellos.

Los compuestos activos se pueden disolver opcionalmente en aceites
25 vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables que son apropiados para inyectar.

Los solubilizantes apropiados son disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o que previenen su precipitación. Los ejemplos son povidona, alcohol polivinílico, aceite de ricino polioxietilado y éster de sorbitano polioxietilado.

5

Los conservantes apropiados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres de ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

10 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral antes de la dilución a la concentración de uso. Las soluciones orales y los concentrados se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y se describen anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

15 Las soluciones para usar sobre la piel se esparcen, se dispersan, se friccionan, se riegan o se rocían.

Las soluciones para usar sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo con lo que se describió anteriormente para
20 soluciones inyectables, no siendo necesarios procedimientos de estériles.

Otros disolventes apropiados son polipropilenglicol, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicolalquiléter, por ejemplo, dipropilenglicolmonometiléter, cetonas
25 tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida, transcutool, solcetal, propilencarbonato, y mezclas de ellos.

Puede resultar ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Los espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados celulósicos, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

Los geles se aplican o se dispersan sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando las soluciones que se preparan tal como se describió en el caso de las soluciones inyectables con suficiente cantidad de espesante, de modo que resulta un material claro que tiene una consistencia de tipo ungüento. Los espesantes empleados son los espesantes indicados anteriormente.

Las formulaciones de unción dorsal se vierten o rocían en áreas limitadas de la piel, por lo que el compuesto activo penetra en la piel y actúa sistémicamente.

Las formulaciones de unción dorsal se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes apropiados compatibles con la piel o mezclas de disolventes. De ser apropiado, se agregan otros auxiliares tales como colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, antioxidantes, estabilizantes de la luz, adhesivos.

Los disolventes apropiados son agua, alcanoles, 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 tales como alquilenglicolalquiléteres tales como dipropilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonobutiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, carbonatos cíclicos tales como propilencarbonato, etilencarbonato, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o
5 sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oxi-metilen-1,3-dioxolano y glicerol formal.

Los colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para usar en
10 animales y que se pueden disolver o suspender.

Las sustancias adecuadas que promueven la absorción son, por ejemplo, DMSO, aceites dispersantes tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites siliconados y sus copolímeros con poliéteres, ésteres de
15 ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

Los antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.
20

Los estabilizantes de luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

Los adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados celulósicos, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos,
25 gelatina.

Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o como

inyecciones.

Las emulsiones son de tipo agua en aceite o de tipo aceite en agua.

5 Se preparan disolviendo el compuesto activo ya sea en fase hidrófoba o en fase hidrófila y homogeneizándolo con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes apropiados y, de ser adecuado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias que promueven la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizantes de luz, sustancias que mejoran la viscosidad.

10

Las fases hidrófobas apropiadas (aceites) son:

 parafinas líquidas, aceites siliconados, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos
15 sintéticos tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de la longitud de cadena C_8 - C_{12} u otros ácidos grasos naturales especialmente elegidos, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente también con contenido de grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de ácidos grasos C_8 - C_{10} ,

20

 ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C_{16} - C_{18} , miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres
25 de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C_{12} - C_{18} , estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa sintética de la

glándula coccígea del pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con los últimos,

alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol
5 cetilestearílico, alcohol oleílico, y

ácidos grasos tales como ácido oleico y

mezclas de ellos.

10

Fases hidrófilas apropiadas son: agua, alcoholes tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de ellos.

Los emulsionantes apropiados son:

15

tensoactivos no iónicos, por ejemplo, aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, polioxietilestearato, alquilfenolpoliglicoléter;

20 tensoactivos anfólicos tales como N-lauril-p-iminodipropionato disódico o lecitina;

tensoactivos aniónicos, tales como laurilsulfato sódico, éter sulfatos de alcohol graso, sal de monoetanolamina de ácido ortofosfórico de
25 mono/dialquilpoliglicoléter;

tensoactivos catiónicos, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

Los demás auxiliares apropiados son: sustancias que mejoran la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábica, povidona, alcohol polivinílico, copolímeros de éter metilvinílico y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, de ser apropiado, con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias que promueven la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizantes de luz.

Agentes de suspensión líquidos son todos los disolventes homogéneos y mezclas de disolventes.

Los agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsionantes dados anteriormente.

20

Otros auxiliares que se pueden mencionar son los indicados anteriormente.

Las preparaciones semisólidas se pueden administrar oralmente o tópicamente/dérmicamente. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente sólo en su mayor viscosidad.

Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se

mezcla con excipientes adecuados, de ser apropiado, con adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

Los excipientes apropiados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Aquellas usadas son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrógeno-carbonatos, óxido de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, productos alimenticios y alimentos tales como leche en polvo, harina animal, harinas de granos y granos triturados, almidones.

Los auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se mencionaron anteriormente.

15

Otros auxiliares adecuados son lubricantes y lubricantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias que promueven la desintegración tales como almidón o povidonas reticuladas, aglutinantes tales como almidón, gelatina o povidona lineal, y aglutinantes secos tales como celulosa microcristalina.

20

En general, "cantidad de parasiticidamente efectiva" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, inclusive los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención y eliminación, destrucción o de otra forma la reducción de la ocurrencia y la actividad del organismo objetivo. La cantidad de parasiticidamente efectiva puede variar para los distintos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad

25

de parasiticidadamente efectiva de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto parasitario deseado y la duración, las especies objetivo, el modo de aplicación, y similares.

5 Las composiciones que se pueden utilizar en la invención pueden comprender en general de aproximadamente el 0,001 al 95% del compuesto de la fórmula (I) o de su N-óxido o su sal.

10 En general, es favorable aplicar los compuestos de la fórmula (I) en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm al 15 80 % en peso, preferiblemente del 0,1 al 65 % en peso, más preferiblemente del 1 al 50 % en peso, con máxima preferencia del 5 al 40 % en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes de usar contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones del 0,5 al 90 % en peso, 20 preferiblemente del 1 al 50 % en peso.

Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula (I) contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm al 2% en peso, preferiblemente de 0,05 al 0,9 por ciento en peso, muy particular y preferiblemente 25 de 0,005 al 0,25 % en peso.

En una modalidad preferida de la presente invención, las composiciones

234

que comprenden los compuestos de la fórmula (I) se aplican dérmicamente/tópicamente.

En una modalidad preferida, la aplicación tópica se conduce en la forma de artículos conformados con contenido de compuesto tales como collares, medallones, marcas de oreja, bandas para ser fijadas en partes del cuerpo y cintas y láminas adhesivas.

En general, es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberan compuestos de la fórmula (I) en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, más preferiblemente 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado durante tres semanas.

Para la preparación de los artículos conformados, se utilizan plásticos termoplásticos y flexibles, así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas polivinílicas, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados celulósicos, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de la fórmula (I). Se da una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como procedimientos de preparación para los artículos conformados, por ejemplo, en el documento WO 03/086075.

Las composiciones a ser utilizadas de acuerdo con esta invención también pueden contener otros ingredientes activos, por ejemplo, otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, sustancias fitotóxicas y reguladores del crecimiento de las plantas, protectores

235

y nematicidas. Estos ingredientes adicionales se pueden utilizar secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, si es apropiado, también se pueden agregar sólo inmediatamente antes de uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas se pueden rociar con una composición de esta invención ya sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

Estos agentes se pueden mezclar con los agentes utilizados de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1. La mezcla de los compuestos (I), o de las composiciones que los comprenden en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas resulta a menudo un espectro de acción pesticida más amplio.

La siguiente lista de pesticidas junto con los que los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero sin imponer ninguna limitación:

Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinfos, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/ DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotiona, fentiona, fostiazato, heptenofos, isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofos, metidationa, metil-parationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetona-metilo, paraoxona, parationa, parationa-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, forato, foxima, pirimifos, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentiona, quinalfos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometona,

triazofos, triclorfona, vamidotiona;

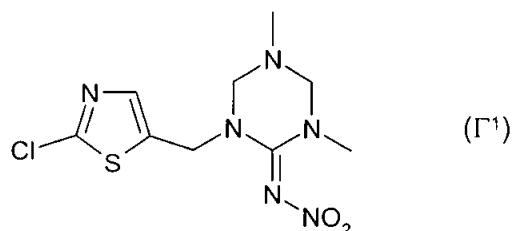
Carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxima, butoxicarboxima, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofoncarb, fenobucarb, fenoxicarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazemato, trimetacarb, XMC, xililcarb;

Piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-transaletrina, d-transaletrina, bifentrina, bioaletrina, S-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta- ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina I y II, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, dimeflutrina, ZXI 8901;

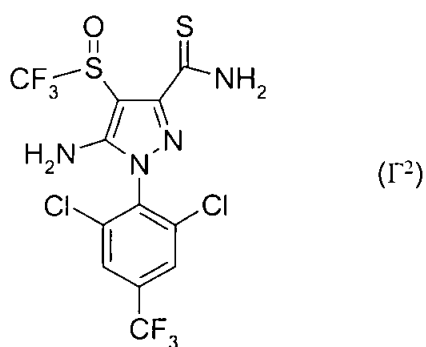
Reguladores del crecimiento: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas; bistriflurona, clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona, triflumurona; buprofezina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clofentezina; b) antagonistas de ecdisona: clormafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, azadiractina; c) juvenoides: piriproxifeno, hidropreno, quinopreno, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato;

Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida, tiametoxam, nicotina, bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam, tiosultap-sódico;

5 el compuesto de tiazol de la fórmula (Γ^1)



compuestos antagonistas de GABA: acetoprol, clordano, endosulfano, etiprol, gamma-HCH (lindano), fipronilo, vaniliprol, pirafluprol, piriprol, vaniliprol, el
10 compuesto de fenilpirazol de la fórmula Γ^2



15 Insecticidas macrocíclicos de lactona: abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad.

Compuestos METI I: fenazaquina, fenpiroximato, flufenerima, piridabeno, pirimidifeno, rotenona, tebufenpirad, tolfenpirad;

Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluacriprim, hidrametilnona;

Compuestos desacoplantes: clorfenapir, DNOC;

- 5 Compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurona, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifona;

Compuestos interruptores de muda: ciromazina;

- 10 Compuestos inhibidores de la oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;

Compuestos bloqueantes del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

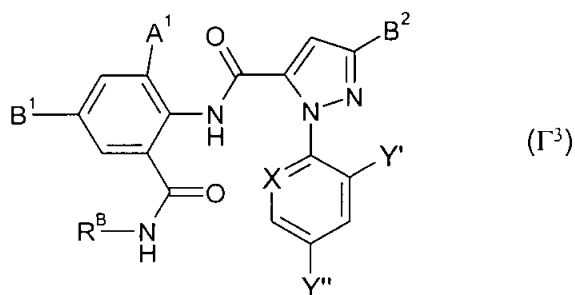
- 15 Compuestos inorgánicos: fosfuro de aluminio, bórax, criolita, cianuro, fluoruro de sulfurilo, fosfina;

- Interruptores microbianos de membranas de intestino medio de insectos: bacillus turingiensis subsp. israelensis, bacillus sphaericus, bacillus turingiensis subsp. aizawai, bacillus turingiensis subsp. kurstaki, bacillus turingiensis subsp. tenebrionis;
- 20

- Varios: amitraz, benclotiaz, benzoximat, bifenazato, bromopropilato, cartap, quinometionato, cloropicrina, flonicamida, bromuro de metilo, piridalilo, pimetrozina, rinaxipurazufre, emético tartárico, tiociclam, tribufosflubendiamida, cienopirafeno, flupirazofos, ciflumetofeno, amidoflumet, NNI-0101;
- 25

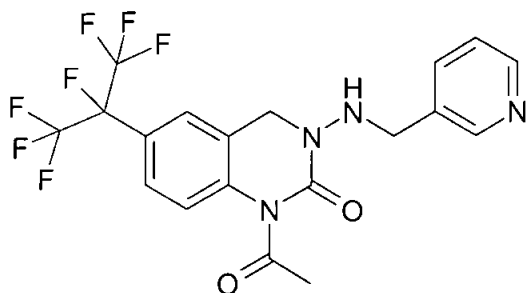
N-R'-2,2-dihalo-1-R''-ciclopropancarboxamid-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')-propionamid-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)hidrazona, donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, compuestos de antranilamida de la fórmula Γ^3

5



donde A¹ es CH₃, Cl, Br, I, X es C-H, C-Cl, C-F o N, Y' es F, Cl, o Br, Y'' es F, Cl, CF₃, B¹ es hidrógeno, Cl, Br, I, CN, B² es Cl, Br, CF₃, OCH₂CF₃, OCF₂H, y
 10 R^B es hidrógeno, CH₃ o CH(CH₃)₂, y compuestos de malononitrilo tal como se describen en los documentos JP 2002 284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399 o JP 2004 99597.

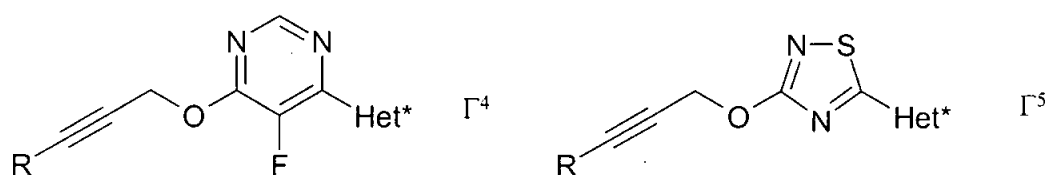
Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención también se
 15 pueden combinar con un compuesto de quinazolina fluorinado como:



1-acetil-3-[(piridin-3-ilmetil)-amino]-6-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-
 20 3,4-dihidro-1H-quinazolin-2-ona.

Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención también se pueden combinar con un compuesto de pirimidinilalquiniléter Γ^4 o un compuesto de tiadiazolilalquiniléter Γ^5 :

5



en donde R es metilo o etilo y Het^* es 3,3-dimetilpirrolidin-1-ilo, 3-metilpiperidin-1-ilo, 3,5-dimetilpiperidin-1-ilo, 4-metilpiperidin-1-ilo, hexahidroazepin-1-ilo, 2,6-dimetilhexahidroazepin-1-ilo o 2,6-dimetilmorfolin-4-ilo. Tales compuestos se describen, por ejemplo, en el documento JP 2006131529.

Los socios de mezcla antes mencionados son asequibles en comercios y se pueden hallar en el The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones.

Las tiamidas de la fórmula Γ^2 y su preparación se describen en el documento WO 98/28279.

Lepimectiona se conoce de Agro Project, PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. Benclotiaz y su preparación se describen en el documento EP-A1 454621. Metidationa y paraoxona y su preparación se describen en Pharm Chemicals Handbook, Volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoprol y su preparación se describen en el documento WO 98/28277. Metaflumizona y su preparación se describen en el documento EP-A1 462 456. Flupirazofos se

describió en Pesticide Science 54, 1988, p. 237-243 y en el documento US 4822779. Pirafluprol y su preparación se describen en el documento JP 2002193709 y en el documento WO 01/00614. Piriprol y su preparación se describen en el documento WO 98/45274 y en el documento US 6335357.

5 Amidoflumet y su preparación se describen en el documento US 6221890 y en el documento JP 21010907. Flufenerim y su preparación se describen en el documento WO 03/007717 y en el documento WO 03/007718. Ciflumetofeno y su preparación se describen en el documento WO 04/080180.

10 Los compuestos de antranilamida de la fórmula Γ^3 y su preparación se describen en los documentos WO 01/70671; WO 02/48137; WO 03/24222, WO 03/15518, WO 04/67528; WO 04/33468; y WO 05/118552.

Los socios de mezcla fungicida son aquellos seleccionados del grupo que
15 consiste en

acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo,

derivados de amina tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf,
20 fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf,

anilinopirimidinas tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo,

antibióticos tales como cicloheximida, griseofulvina, casugamicina,
25 natamicina, polioxina o estreptomicina,

azoles tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol,

diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalilo, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol,

5

dicarboximidas tales como iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina,

ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb,

10

compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomil, boscalida, carbendazima, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanilo, furametpir, isoprotiolano, mepronilo, nuarimol, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilona, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triciclazol, triforina,

15

fungicidas de cobre tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico,

20

derivados de nitrofenilo tales como binapacrilo, dinocap, dinobutona, nitroftalisopropilo,

fenilpirroles tales como fempiclonilo o fludioxonilo,

25

azufre,

otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, acetato de fentina, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetil-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurona, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintoceno, zoxamida,

estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina o trifloxistrobina,

derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captano, diclofluanida, folpet, tolilfluanida,

cinemamidas y análogos tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

La plaga animal, es decir, los artrópodos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en donde la planta está creciendo, se puede poner en contacto con el o los presentes compuestos (I), sus N-óxidos o sus sales o composiciones que los contienen por cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o planta - típicamente el follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones sobre el locus de la plaga animal o planta).

Más aún, las plagas animales se pueden controlar poniendo en contacto la plagas objetivo, su suministro de alimento, su hábitat, lugar de incubación o su locus con una cantidad pesticidamente efectiva de compuestos de la fórmula (I),

sus N-óxidos o sus sales. Como tal, la aplicación se puede llevar a cabo antes o después de la infección del locus, los cultivos en crecimiento o los cultivos recolectados por la plaga.

- 5 “Locus” significa hábitat, lugar de incubación, planta, semilla, suelo, área, material o medio ambiente en donde está creciendo o puede crecer una plaga o un parásito.

En general, “cantidad pesticidamente efectiva” significa la cantidad de
10 ingrediente activo necesario para obtener un efecto de crecimiento observable, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención y eliminación, destrucción o disminuir de otra manera la ocurrencia y la actividad del organismo blanco. La cantidad pesticidamente efectiva puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad
15 pesticidamente efectiva de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como el efecto pesticida deseado y la duración, el clima, las especies objetivo, el locus, el modo de aplicación y similares.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sales y las composiciones
20 que los comprenden se pueden utilizar para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, traviesas, etc. y edificios tales como casas, cobertizos, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cableados y alambres eléctricos, etc. contra hormigas y/o termitas y para el control de hormigas y termitas para evitar el daño de cultivos y
25 humanos (por ejemplo cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de la fórmula (I) se aplican no solo a la superficie de tierra circundante o el suelo bajo de la superficie, con el fin de proteger los materiales de

madera, también se pueden aplicar a artículos talados de madera tales como las superficies del subsuelo de concreto, postes de alcobas, vigas, maderas contrachadas, muebles, etc., artículos de madera tales como planchas de aglomerado, semiaglomerados, etc. y artículos de vinilo tales como cableados eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor tal como espumas de estireno, etc. En el caso de aplicación contra hormigas que dañan cultivos o humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o el suelo circundante, o se aplica directamente a los hormigueros o similares.

10

Los compuestos de la invención también se pueden aplicar preventivamente en lugares en los que se espera una ocurrencia de las plagas.

Los compuestos de la fórmula (I), sus N-óxidos o sus sales también se pueden utilizar para proteger las plantas de cultivo de un ataque o infestación de plagas, al poner en contacto la planta con una cantidad pesticidamente efectiva de compuestos de la fórmula (I). Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta - típicamente sobre el follaje, los tallos o las raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al lugar de la plaga y/o planta).

En el caso del tratamiento del suelo o de la aplicación a los lugares donde están las plagas o los nidos, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales van, por

ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para usar en la impregnación de materiales
5 contienen típicamente del 0,001 al 95 % en peso, preferiblemente del 0,1 al 45% en peso y con mayor preferencia del 1 al 25% en peso de por lo menos un repelente y / o insecticida.

Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente
10 activo varía del 0,001% en peso al 15% en peso, deseablemente del 0,001% en peso al 5% en peso de compuesto activo.

Para uso en composiciones en de rociado, el contenido de ingrediente
activo varía del 0,001 al 80% en peso, preferiblemente del 0,01 al 50% en peso y
15 con máxima preferencia del 0,01 al 15% en peso.

Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de
ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,1 g a 4000 g
por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente
20 de 50 g a 500 g por hectárea.

En el tratamiento para semillas, las tasas de aplicación de la mezcla van
generalmente de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5
kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semilla.

25

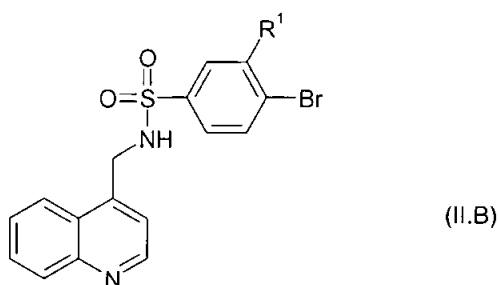
La presente invención se ilustra ahora con mayor detalle por medio de los siguientes ejemplos.

I. Procedimientos experimentales

Con la modificación debida de los compuestos de partida, los protocolos mostrados en el ejemplo de síntesis adelante se utilizan para obtener otros compuestos (I). Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, se enumeran adelante en la tabla C.

Los productos se caracterizan por cromatografía líquida de alto desempeño/espectrometría de masa (HPLC/MS), por ^1H -RMN (400 MHz) en CDCl_3 o d_6 -DMSO o sus puntos de fusión. Columna HPLC: columna RP-18 (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania). Elución: acetonitrilo + 0,1% de ácido trifluoroacético (TFA) / agua en una relación de 5:95 a 95:5 en 5 minutos a 40 °C. MS: ionización cuadrupolar por electronebulización, 80 V (modo positivo).

I.1.1 Preparación de bromosulfonamidas (II.B)



I.1.1.a) Preparación de 4-bromo-3-fluoro-N-[(quinolin-4-il)metil]bencen-sulfonamida ($\text{R}^1 = \text{F}$)

Una solución de quinolinmetilamina (61 g, 0,023 mol) en trietilamina (3,81 ml, 0,027 mol) se agrega a una solución de cloruro de ácido 3-fluoro-4-bromo-

sulfónico (6,24 g, 0,023 mol). La mezcla se deja bajo agitación a temperatura ambiente durante 16 h. Se agrega agua (20 ml); el precipitado se filtró, se enjuaga luego con agua y éter metil-terc-butílico y se seca para obtener el compuesto del título (4,92 g) en forma de un sólido incoloro. ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO): δ =
5 8,8 (m, 1 h), 8,6 (m, 1 h), 8,1-7,8 (m, 3 H), 7,8-7,4 (m, 5 h), 4,6 ppm (s, 2 H).

I.1.1.b) Preparación de 4-bromo-3-trifluorometil-N-[(quinolin-4-il)-metil]bencen-sulfonamida ($\text{R}^1 = \text{CF}_3$)

10 Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método descrito en el punto I.1.1.a), ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,8 (m, 2 H), 8,1 (m, 8 H), 4,6 ppm (s, 2 H).

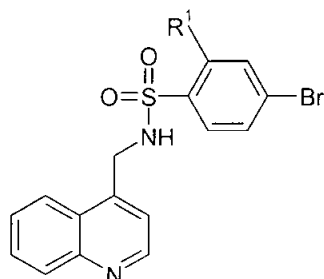
I.1.1.c) Preparación de 4-bromo-3-metil-N-[(quinolin-4-il)metil]bencen-sulfonamida ($\text{R}^1 = \text{CH}_3$)
15

Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método descrito en el punto I.1.1.a). ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,8 (m, 1 H), 8,5 (t, 1 H), 8,2-8,0 (m, 2 H), 7,8-7,5 (m, 6 H), 4,6 (d, 2 H), 2,4 ppm (s, 3 H).
20

I.1.1.d) Preparación de 4-bromo-3-cloro-N-[(quinolin-4-il)metil]bencen-sulfonamida ($\text{R}^1 = \text{Cl}$)

Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método descrito en el punto I.1.1.a). ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,8 (m, 1 H), 8,6 (t, 1 H), 8,1-7,6 (m, 8 H), 4,6 ppm (d, 2 H).
25

I.1.2 Preparación de bromosulfonamidas (II.B*)



(II.B*)

- 5 I.1.2.a) Preparación de 4-bromo-2-fluoro-N[(quinolin-4-il)metil]-
bencensulfonamida ($R^1 = F$)

Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método
descrito en el punto I.1.1.a). ^1H -RMN (400 MHz, d_8 -THF) $\delta = 8,6$ (m, 1 H), 8,1 (m, 1
10 H), 8,0 (m, 1 H), 7,6-7,4 (m, 5 H), 7,2 (m, 2 H), 4,5 (d, 2 H).

- I.1.2.b) Preparación de 4-bromo-2-metil-N[(quinolin-4-il)metil]-
bencensulfonamida ($R^1 = \text{CH}_3$)

15 Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método
descrito en el punto I.1.1.a). ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO) $\delta = 8,8$ (m, 1 H), 8,6
(m, 1 H), 8,1-8,0 (m, 2 H), 7,8-7,4 (m, 6 H), 7,2 (m, 2 H), 4,5 (d, 2 H), 2,5 (s, 3H).

- I.1.2.c) Preparación de 4-bromo-2-trifluorometoxi-N[(quinolin-4-
20 il)metil]bencensulfonamida ($R^1 = \text{OCF}_3$)

Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método
descrito en el punto I.1.1.a), ^1H -RMN (400 MHz, d_6 -DMSO) $\delta = 8,8$ (m, 1 H), 8,1-
8,0 (m, 2 H), 7,8-7,4 (m, 7 H), 7,2 (m, 2 H), 4,5 (d, 2 H).

I.1.2.d) Preparación de 4-bromo-2-cloro-N[(quinolin-4-il)metil]bencen-sulfonamida ($R^1 = Cl$)

5 Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método descrito en el punto I.1.1.a). 1H -RMN (400 Mhz, d_6 -DMSO) $\delta = 8,8$ (br, 2 H), 8,1-7,9 (m, 2 H), 7,8-7,4 (m, 6 H), 7,2 (m, 2 H), 4,6 (d, 2 H).

I.1.2.e) Preparación de 4-bromo-2-trifluorometil-N[(quinolin-4-il)metil]-
10 bencensulfonamida ($R^1 = CF_3$)

Este compuesto se prepara utilizando un método análogo al método descrito en el punto I.1.1.a). 1H -RMN (400 Mhz, d_6 -DMSO) $\delta = 8,8$ (m, 2 H), 8,2-7,6 (m, 5 H), 7,7 (m, 1 H), 7,6 (m, 1 H), 7,4 (m, 1 H), 4,5 (d, 2 H).

15

I.2 Procedimiento general para la preparación de compuestos (I)

Una mezcla de una sulfonamida apropiada de la fórmula general (II) (0,48 mmol) como se describió anteriormente, Cs_2CO_3 (200 mg), poliestireno-
20 trifenilfosfina-Pd (400 mg, Argonaut) y ácido borónico (0,6 mmol) en tetrahidrofurano (3 ml) y agua (0,5 ml) se hizo reaccionar a 75 °C. Al cabo de 20 h, la mezcla se enfria hasta temperatura ambiente y se trata con poliestireno-dietanolamina (100 mg, Novabiochem) durante 6 h. Los reactivos inmovilizados se filtran y se enjuagan con tetrahidrofurano (10 ml). El filtrado se recoge y las
25 sustancias volátiles se eliminan al vacío. El residuo se somete a cromatografía en columna (SiO_2 , ciclohexano/acetato de etilo).

Los datos analíticos de los compuestos representativos se indican en la tabla C y en la tabla D.

De acuerdo con el procedimiento descrito anteriormente, se preparan los
5 compuestos de la fórmula (I.B) enumerados en la tabla C.

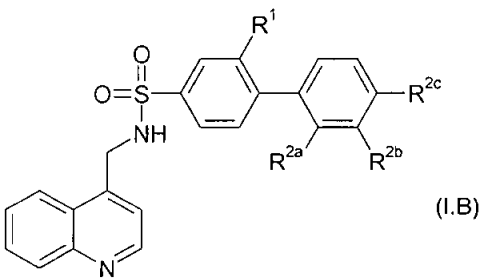


Tabla C

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B1	CH ₃	Cl	H	Cl	456,9	3,20
B2	CH ₃	H	CH ₃	H	402,5	2,91
B3	CH ₃	H	H	CF ₃	457,4	3,13
B4	CH ₃	H	F	H	406,5	2,77
B5	CH ₃	Cl	H	H	422,9	2,86
B6	CH ₃	F	H	H	406,5	2,68
B7	CH ₃	H	H	OCF ₃	473,4	3,21
B8	Cl	H	F	H	426,9	2,81
B9	F	Cl	H	Cl	461,3	3,08
B10	F	H	CH ₃	H	406,5	2,88

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B11	F	H	H	CF ₃	460,4	3,07
B12	F	H	F	H	410,4	2,76
B13	F	F	H	H	410,4	2,70
B14	F	H	H	OCF ₃	476,4	3,15
B15	CF ₃	H	CH ₃	H	456,5	3,06
16	CF ₃	H	H	CF ₃	510,5	3,23
B17	CF ₃	H	F	H	460,5	2,96
B18	CF ₃	H	H	OCF ₃	526,5	3,32
B19	CF ₃	H	H	CN	467,5	2,76
B20	CF ₃	H	H	O- CF=CF ₂	538,5	3,36
B21	Cl	CF ₃	H	CF ₃	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,2 m, 8,1 m, 8,0 m, 7,9 m, 7,8- 7,7 m, 7,6 m, 7,4 m, 7,2 m, 4,8 d
B22	Cl	Cl	H	Cl	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,1 m, 8,1 m, 7,9 m, 7,8 m, 7,6 m, 7,5 m, 7,4 m, 7,2 m, 7,1 m, 5,2 t, 4,8 d
B23	Cl	Cl	H	CF ₃	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,1 m, 8,1 m, 7,9 m, 7,8 m, 7,6 m, 7,5 m, 7,4 m, 7,2 m,

283

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
						7,1 m, 5,2 t, 4,8 d
B24	Cl	H	H	CF ₃	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,2 m, 8,0 m, 7,8-7,6 m, 7,5 m, 7,4 m, 7,3 m, 7,2 m, 5,2 t, 4,8 d
B25	Cl	H	H	OCH ₃	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,2 m, 7,9 m, 7,9-7,6 m; 7,3 m, 7,1 m, 7,0 m, 5,2 t, 4,8 d
B26	Cl	F	H	H	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,2 m, 7,9 m, 7,7 m, 7,6 m, 7,5- 7,1 m, 5,2 t, 4,8 d
B27	Cl	CH ₃	H	OCH ₃	n. d. ^{c)}	8,8 m, 8,2 m, 8,0 m, 7,7 m, 7,6 m, 7,3 m, 7,2 m, 7,0 m, 6,8 m, 5,2 t, 4,8 d
B28	CH ₃	H	Cl	H	422,9	2,94
B29	CH ₃	F	H	Br	485,4	3,04
B30	CH ₃	H	H	CN	414,0	2,6
B31	CH ₃	F	H	Cl	440,9	2,97
B32	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490,9	3,19
B33	CH ₃	H	CF ₃	Cl	490,9	3,23

254

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B34	CH ₃	F	H	OCH ₃	436,5	2,34
B35	Cl	H	Cl	H	443,4	3,00
B36	Cl	H	H	CN	433,9	2,63
B37	Cl	F	H	Cl	461,3	3,03
B38	Cl	H	CF ₃	Cl	511,3	3,31
B39	Cl	F	H	OCH ₃	456,9	2,52
B40	F	H	Cl	H	426,9	2,94
B41	F	H	H	CN	417,5	2,55
B42	F	F	H	Cl	444,9	2,97
B43	F	Cl	H	CF ₃	494,9	3,19
B44	F	H	CF ₃	Cl	494,9	3,23
B45	F	F	H	OCH ₃	440,5	2,41
B46	CH ₃	H	H	O- CF=CF ₂	484,5	3,22
B47	Cl	H	H	O- CF=CF ₂	504,9	3,26
B48	F	H	H	O- CF=CF ₂	488,5	3,20
B49	Cl	F	H	Br	5058	3,11
B50	CF ₃	H	Cl	H	476,9	3,13
B51	CF ₃	F	H	H	460,4	2,88
B52	CF ₃	F	H	Cl	494,9	3,15

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B53	CF ₃	H	CF ₃	Cl	544,9	3,40

a) tiempo de retención para el método descrito anteriormente

b) δ [ppm], (CDCl₃,400 MHz)

5

c) no determinado

De acuerdo con el procedimiento descrito anteriormente, se preparan los compuestos de la fórmula (I.B*) enumerados en la tabla D.

10

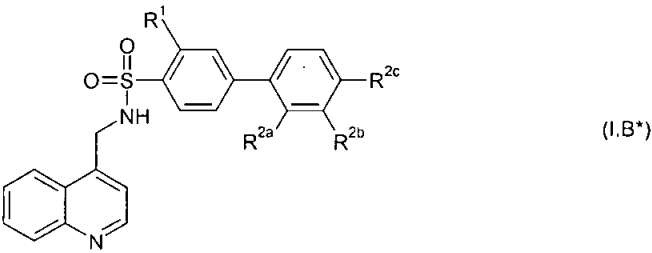


Tabla D

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B54	OCF ₃	H	H	Cl	492,9	3,16
B55	CF ₃	H	H	Cl	476,9	3,1

256

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} ○ ¹ H-RMN ^{b)}
B56	CH ₃	H	H	Cl	422,9	2,93
B57	F	H	H	Cl	426,9	2,86
B58	OCF ₃	H	H	CF ₃	526,9	3,25
B59	CF ₃	H	H	CF ₃	510,5	3,21
B60	CH ₃	H	H	CF ₃	456,6	3,06
B61	Cl	H	H	CF ₃	476,9	3,04
B62	F	H	H	CF ₃	460,4	2,96
B63	CF ₃	H	H	CN	467,5	2,70
B64	CH ₃	H	H	CN	413,2	2,52
B65	Cl	H	H	CN	433,9	2,48
B66	OCF ₃	H	H	OCF ₃	542,5	3,31
B67	CF ₃	H	H	OCF ₃	526,5	3,27
B68	CH ₃	H	H	OCF ₃	472,5	3,12
B69	Cl	H	H	OCF ₃	492,9	3,09
B70	F	H	H	OCF ₃	476,4	3,04
B71	OCF ₃	Cl	H	Cl	527,3	n. d. ^{c)}
B72	CF ₃	Cl	H	Cl	511,3	n. d. ^{c)}
B73	CH ₃	Cl	H	Cl	457,4	n. d. ^{c)}
B74	Cl	Cl	H	Cl	477,8	n. d. ^{c)}
B75	F	Cl	H	Cl	461,3	n. d. ^{c)}
B76	OCF ₃	Cl	H	Cl	594,5	n. d. ^{c)}
B77	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	578,5	n. d. ^{c)}
B78	CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	524,5	3,33
B79	Cl	CF ₃	H	CF ₃	544,9	n. d. ^{c)}
B80	F	CF ₃	H	CF ₃	528,4	n. d. ^{c)}
B81	OCF ₃	Cl	H	CF ₃	560,9	3,52
B82	CF ₃	Cl	H	CF ₃	544,9	n. d. ^{c)}
B83	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490,9	n. d. ^{c)}
B84	Cl	Cl	H	CF ₃	511,3	3,27

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B85	F	Cl	H	CF ₃	494,9	3,24
B86	OCF ₃	CF ₃	H	H	526,4	n. d. ^{c)}
B87	CF ₃	CF ₃	H	H	510,5	3,14
B88	CH ₃	CF ₃	H	H	456,5	3,04
B89	Cl	CF ₃	H	H	476,9	n. d. ^{c)}
B90	F	CF ₃	H	H	460,4	2,95
B91	OCF ₃	Cl	H	H	492,9	3,16
B92	CF ₃	Cl	H	H	476,9	3,08
B93	CH ₃	Cl	H	H	422,9	n. d. ^{c)}
B94	Cl	Cl	H	H	443,4	n. d. ^{c)}
B95	F	Cl	H	H	426,9	2,88
B96	OCF ₃	CF ₃	H	Cl	560,9	3,44
B97	CF ₃	CF ₃	H	Cl	544,9	3,38
B98	CH ₃	CF ₃	H	Cl	490,9	3,3
B99	Cl	CF ₃	H	Cl	511,3	3,3
B100	F	CF ₃	H	Cl	494,9	3,21
B101	OCF ₃	F	H	F	494,9	3,1
B102	CF ₃	F	H	F	478,4	3,05
B103	CH ₃	F	H	F	424,5	2,85
B104	Cl	F	H	F	444,9	2,83
B105	F	F	H	F	428,4	n. d. ^{c)}
B106	OCF ₃	F	H	H	476,4	3,06
B107	CF ₃	F	H	H	460,4	3,01
B108	CH ₃	F	H	H	406,5	n. d. ^{c)}
B109	Cl	F	H	H	426,9	2,74
B110	F	F	H	H	410,4	2,74
B111	OCF ₃	H	H	CN	483,5	2,78
B112	CH ₃	H	H	CN	413,2	2,56
B113	OCF ₃	Cl	H	Cl	527,3	n. d. ^{c)}

258

Compuesto	R ¹	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	MS (m/e [M ⁺])	HPLC ^{a)} o ¹ H-RMN ^{b)}
B114	CF ₃	Cl	H	Cl	511,3	3,34
B115	CH ₃	Cl	H	Cl	457,4	3,17
B116	Cl	Cl	H	Cl	477,8	3,18
B117	F	Cl	H	Cl	461,3	3,10
B118	CF ₃	Cl	H	CF ₃	544,9	n. d. ^{c)}
B119	CH ₃	Cl	H	CF ₃	490,93	n. d. ^{c)}
B120	Cl	CF ₃	H	H	476,9	2,96
B121	CH ₃	Cl	H	H	422,9	2,88
B122	Cl	Cl	H	H	443,4	2,88
B123	F	F	H	F	428,4	2,73
B124	CH ₃	F	H	H	406,5	2,75

c) no determinado

II. Evaluación de la actividad biológica

5

II.1 Actividad contra áfidos de algodón (*aphis gossipii*), etapas de vida mixta

Los compuestos activos se formulan en 50:50 acetona:agua y 100 ppm de agente tensoactivo Kineti[®].

Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón se infectan antes del tratamiento al colocar una hoja fuertemente infestada a partir de una colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Los áfidos se dejan transferir durante la noche y se retira la hoja del huésped. Los cotiledones

infestados luego se sumergen y agitan en la solución de prueba durante 3 segundos y se dejan secar en una campana. Las plantas de prueba se mantiene bajo luz fluorescente con un fotoperíodo de 24-h a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, respecto de la mortalidad en plantas control no tratadas, se determina después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos B1, B3, B7, B12, B14, B27, B45, B56, B59, B85, B90, B115, B117 y B123 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos el 75% en comparación con controles no tratados.

II.2 Actividad contra áfidos de durazno verde (*Mizus persicae*)

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

Las plantas de pimiento en la etapa de 2° par de hojas (variedad California Wonder) se infestan con aproximadamente 40 áfidos criados en laboratorio al colocar secciones de hojas infertadas sobre las plantas de prueba. Las secciones de hojas se retiran después de 24 h. Las hojas de las plantas intactas se sumergen en gradientes de soluciones del compuesto de prueba y se dejan secar. Las plantas de prueba se mantienen bajo luz fluorescente (período de 24 h) a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de los áfidos en las plantas tratadas, respecto de la mortalidad en las plantas control no tratadas, se determina después de 5 días

En esta prueba, los compuestos B1, B3, B9, B14, B27, B31, B56 y B85 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% e comparación con los

controles no tratados.

II.3 Actividad contra oruga de placa sureña (*Spodoptera eridania*), 2.º-3.º
es estado de larva

5

Los compuestos activos se formulan como solución de 10.000 ppm una mezcla de 35% de acetona y agua, que se diluye con agua, de ser necesario.

10 Follaje de porotos lima Sieva expandido hasta las primeras hojas se sumergen y agitan en la solución de prueba durante 3 segundos y se dejan secar en una campana. Las plantas tratadas se colocan luego en bolsas con cierre perforadas de plástico de 25 cm, se agregan 10 larvas en 2º estado y se sellan las bolsas. Después de 4 días se hacen observaciones de mortalidad alimentación de la planta y cualquier interferencia con el desarrollo de la larva.

15

En esta prueba, los compuestos B1, B3, B8, B10, B12, B26, B31, B32, B45, B60, B84, B90, B98 y B103 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

20 II.4 Actividad contra cascarudo rojo de papa (*Leptinotarsa decemlineata*)

Se utilizan plantas de papa para los ensayos biológicos. Las hojas de plantas cortadas se sumergen en diluciones 1:1 de acetona/agua de los compuestos activos. Después de secar las hojas, se colocan individualmente sobre papel de filtro humedecido en agua en placas de Petri. Cada placa se infesta con 5 -7 larvas y se cubre con una tapa. Cada dilución de tratamiento se duplica 4 veces. Las placas de prueba se mantienen a aproximadamente 27 °C y

25

60% de humedad. Se evalúa la cantidad de larvas vivas y muertas en cada placa 5 días después de la aplicación del tratamiento y se calcula el porcentaje de mortalidad.

- 5 En esta prueba, los compuestos B2, B16, B32, B68, B84, B121 y B122 a 2500 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

10 II.5 Actividad contra polilla de lomo con diamante (*Plutella xilostella*)

- Los compuestos activos se formulan en 50:50 acetona:agua y 0,1 % (vol/vol) de agente tensoactivo Alkamuls EL 620. Un disco de 6 cm de hojas de repollo se sumerge en la solución de prueba durante 3 segundos y se deja secar al aire en una placa de Petri revestida con papel de filtro humedecido. El disco de
15 hoja se inocula con 10 larvas de 3º etapa y se mantuvo a 25-27°C y 50-60% humedad durante 3 días. Se evalúa la mortalidad después de 72 h de tratamiento.

- En esta prueba, los compuestos B1, B3, B12, B23, B27 y B115 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no
20 tratados.

II.6 Actividad contra araña de dos manchas (*Tetranychus urticae*, cepa resistente a OP)

- 25 Los compuestos activos se formulan en 50:50 acetona:agua y 100 ppm agente tensoactivo Kinetic™.

Plantas de poroto lima Sieva con hojas primarias expandidas hasta 7-12 cm se infectan al colocar sobre cada una de ellas un pequeño trozo de una hoja infestada (con aproximadamente 100 ácaros) obtenidos de la colonia principal. Esto se realiza aproximadamente 2 horas antes del tratamiento para dejar que los ácaros pasaran a las plantas de prueba para desovar. El trozo de hoja usado para transferir los ácaros se quitó. Las plantas recién infestadas se sumergen en la solución de prueba y se dejan secar. Las plantas de prueba se mantienen bajo luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) a aproximadamente 25 °C y 20-40% de humedad relativa. Después de 5 días se retira una hoja y se hizo el recuento de mortalidad.

En esta prueba, los compuestos B1 y B7 at 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

15 II.7 Actividad contra saltamontes marrón (*Nilaparvata lugens*)

Los compuestos activos se formulan como solución 20:80 de acetona:agua. Se agrega agente tensoactivo (Alkamuls EL 620) a la tasa de 0,1% (vol/vol).

20 Plantas de arroz en macetas de 3-4 semanas se rocían con 10 ml de la solución de prueba mediante un atomizador manual impulsado por aire (atomizador Devillbis) a 1,7 bar. Las plantas tratadas se dejan secar durante aproximadamente 1 hora y se cubren con jaulas Milar. Las plantas se inoculan con 10 adultos de la especie (5 machos y 5 hembras) y se mantiene a 25-27 °C y 50-25 60% de humedad durante 3 días. Se evalúa la mortalidad después de 24, 48 y 72 horas de tratamiento. Generalmente se encuentran insectos muertos en la superficie del agua. Cada tratamiento se hace por duplicado.

En esta prueba, los compuestos B16 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

5 II.8 Actividad contra gorgojo bola (*Anthonomus grandis*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 DMSO:agua. Se colocan 10 a 15 huevos en placas de microtitulación llenos de 2% agar-agar en agua y 300 ppm de formalina. Los huevos se rocían con 20 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con lámina de aluminio perforado y se mantiene a 24-26 °C y 75-85% humedad con un ciclo de día/noche de 3 a 5 días. Se evalúa la mortalidad sobre la base de la cantidad de huevos no incubados o larvas en la superficie del agar y/o la cantidad y profundidad de los canales perforados por las larvas incubadas. Las pruebas se hacen por duplicado.

15

En esta prueba, los compuestos B68, B116 y B117 at 2500 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

20 II.9 Actividad contra mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 DMSO:agua. 50 a 80 huevos se colocan en placas de microtitulación llenos de 0,5% agar-agar y 14% de dieta en agua. Los huevos se rocían con 5 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con lámina de aluminio perforado y se mantiene a 27-29 °C y 75-85% de humedad con luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evalúa sobre la base de la agilidad de las larvas cultivadas. Las pruebas se hacen por duplicado.

En esta prueba, compuestos B85 y B98 a 2500 ppm muestran por lo menos 75% de mortalidad.

5 II.10 Actividad contra oruga de brotes de tabaco (*Heliothis virescens*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 DMSO:agua. 15 a 25 huevos se colocan en placas de microtitulación llenos de dieta. Los huevos se rocían con 10 µl de la solución de prueba, las placas se sellan con lámina de aluminio perforado
10 y se mantiene a 27-29 °C y 75-85% con luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evalúa sobre la base de la agilidad y la alimentación comparativa de las larvas. Las pruebas se hacen por duplicado.

En esta prueba, los compuestos a 2500 ppm muestran por lo menos 75%
15 de mortalidad.

II.11 Actividad contra áfido Vetch (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos se formulan en 1:3 DMSO:agua. Discos de hoja de
20 poroto se colocan en placas de microtitulación llenos con 0,8% de agar-agar y 2,5 ppm OPUS™. Los discos de hojas se rocían con 2,5 µl de la solución de prueba y 5 a 8 áfidos adultos se colocan en las placas de microtitulación que luego se cierran y se mantiene a 22-24 °C y 35-45% con luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evalúa sobre la base de los áfidos vitales, reproducidos. Las
25 pruebas se hacen por duplicado.

En esta prueba, el compuesto a 2500 ppm mostró por lo menos 75% de

mortalidad, comparado con 0% de mortalidad de los controles no tratados.

II.12 Actividad contra oruga de brotes de tabaco (*Heliothis virescens*)

- 5 Se usan plantas de algodón de dos hojas. Las hojas sacadas de la planta se sumergen en diluciones 1:1 de acetona/agua de los compuestos activos. Después de secar las hojas, se colocan individualmente sobre papel de filtro humedecido en la base de placas de Petri. Cada disco se infesta con 5 -7 larvas y se cubre con una tapa. Cada dilución de tratamiento se replica por cuadruplicado.
- 10 Las placas de prueba se mantienen a aproximadamente 27 °C y 60% de humedad. Se evalua la cantidad de larvas vivas y muertas en cada disco 5 días después de la aplicación del tratamiento y se calcula el porcentaje de mortalidad.

II.13 Actividad contra mosca blanca de hoja de plata (*Bemisia argentifolii*)

15

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

- Plantas de algodón seleccionadas se cultivan hasta el estado de cotiledón
- 20 (una planta por maceta). Los cotiledones se sumergen en la solución de prueba para lograr la cobertura completa el follaje y se colocan en una superficie bien ventilada para secar. Cada maceta con semillas germinadas tratadas se coloca en una taza de plástico y se introducen 10 a 12 moscas blancas adultas (aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se juntan con un aspirador y
- 25 una tubuladura no tóxica de 0,6 cm de Tygon conectada a una boquilla de pipeta de barrera. La boquilla que contenía los insectos recolectados se inserta entonces con suavidad en el suelo que contenía la planta tratada, y se permite que los

insectos salieran de la boquilla y alcanzaran el follaje para alimentarse. Las tazas se cubren con una tasa reutilizable con pantalla (pantalla de poliéster de malla 150 de micrones PeCap de Tetko Inc). Las plantas de prueba se mantiene en la habitación a aproximadamente 25 °C y 20-40% de humedad relativa durante 3 días evitando la exposición directa a la luz fluorescente (24 horas de fotoperiodo) para impedir el atropamiento de calor dentro de la taza. Se evalúa la mortalidad 3 días después del tratamiento de las plantas.

En esta prueba, los compuestos B56, B84, B85, B115 y B117 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 70% en comparación con controles no tratados.

II.14 Actividad contra áfidos de arvejas (*afis craccivora*)

Los compuestos activos se formulan en 50:50 acetona:agua. Plantas de arvejas colonizadas con 100 - 150 áfidos en diversos estadios se rocían después de registrar la población de la plaga. Se registra la reducción de la población después de 24, 72 y 120 horas.

En esta prueba, los compuestos a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 80% en comparación con controles no tratados.

II.15 Actividad contra mosquitos de fiebre amarilla (*Aedes aegypti*)

El compuesto de prueba (1 vol % en acetona) se aplica al agua en placas de vidrio que contenían *Aedes aegypti* en 4º etapa. Las placas de prueba se mantiene a aproximadamente 25 °C y se observan diariamente para determinar la

mortalidad. Cada prueba se hizo por triplicado en tres placas de prueba.

En esta prueba, los compuestos a 300 ppm después de 6 días muestran más del 90% de mortalidad, comparado con controles no tratados.

5

II.16 Actividad contra termitas subterráneas del este (*Reticulitermes flavipes*)

Se aplican tratamientos de toxicante (1,0% de compuesto de prueba p/p) a
10 papeles de filtro de 4,25 cm (diam.) en solución de acetona. Se calculan los niveles de tratamiento (% de compuesto de prueba) sobre la base del peso promedio por papel de filtro de 106,5 mg. Las soluciones de tratamiento se ajustan para proporcionar la cantidad de toxicante (mg) requerido por papel en 213 ml de acetona. La acetona solo se aplica como controles no tratados. Los papeles
15 tratados se ventilan para evaporar la acetona, se humedecen con 0,25 ml de agua y se encierran en placas de Petri de 50x9 mm con tapas ajustables.

Los ensayos biológicos de termitas se conducen en placas de Petri de 100x15 mm con 10 g de arena fina dispersa en una capa delgada sobre la base de
20 cada placa. Se apilan 2,5 g adicionales de arena contra el lado de cada placa. La arena se humedece con 2,8 ml de agua aplicada a la arena apilada. reagrega agua a las placas según necesidad durante el curso del ensayo biológico, a fin de mantener elevado el contenido de humedad. Se realizan ensayos biológicos con un filtro tratado (cierre interno) y 30 termitas obreras por placa de prueba. Cada
25 nivel de tratamiento se hizo por duplicado en dos placas. Las placas de prueba se mantiene a aproximadamente 25 °C y 85% de humedad durante 12 días y se observan diariamente para determinar la mortalidad.

II.17 Actividad contra tisanópteros de orquídea (*dichromothrips corbetti*)

Los adultos de *Dichromothrips corbetti* utilizados para el ensayo biológico se obtienen de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. A los fines de la prueba, el compuesto de prueba se diluye hasta una concentración de 500 ppm (compuesto húmedo: diluyente de vol) en una mezcla 1:1 de acetona:agua, más 0,01% de agente tensoactivo Kinetic.

La potencia contra tisanópteros de cada compuesto se evalúa mediante la técnica de inmersión floral. Se usan placas de Petri de plástico como ambiente de prueba. Todos los pétalos de flores de orquídea individuales intactas se sumergen en solución de tratamiento durante aproximadamente 3 segundos y se dejan secar durante 2 horas. Las flores tratadas se colocan en placas de Petri individuales junto con 10 - 15 tisanópteros adultos. Las placas de Petri se cubren entonces con tapas. Todas las situaciones de prueba se mantiene bajo luz continua y temperatura de aproximadamente 28 °C durante el ensayo. Después de 4 días se cuenta la cantidad de tisanópteros vivos en cada flor y a lo largo de las paredes internas de cada placa de Petri. Se extrapola el nivel de mortalidad de los tisanópteros respecto de la cantidad de tisanópteros antes del tratamiento.

II.18 Actividad contra hormiga argentina, hormiga de la cosecha, hormiga acróbata, hormiga de carpintero, hormiga de fuego, mosca doméstica, mosca estable, mosca de la carne, mosquito de fiebre amarilla, mosquito doméstico, mosquito de paludismo, cucaracha alemana, pulga de gato y garrapata parda de perro por contacto con vidrio

Viales de vidrio (viales de centelleo de 20 ml) se tratan con 0,5 ml de una solución de ingrediente activo en acetona. Cada vial se hizo girar sin tapa durante aproximadamente 10 minutos para permitir que el ingrediente active cubriera totalmente el vial y permitir el secado total de la acetona. Los insectos o garrapatas se colocan en cada vial. Los viales se mantiene a 22 °C y se observan los efectos del tratamiento con distintos intervalos de tiempo.

II.19 Actividad contra gorgojo de pulgas (*Philotretta striolata*)

Los gorgojos de pulga (*Philotretta striolata*) adultos utilizados para el ensayo biológico se obtienen de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. A los fines de prueba, el compuesto de prueba se diluye hasta una concentración de 300 ppm (peso del compuesto: diluyente de vol) en una mezcla 1:1 de acetona:agua, más 0,1% de EL 620 agente tensoactivo EL 620.

15

Se evalúa la actividad de cada compuesto mediante la técnica de inmersión de borde. Placas de Petri de vidrio (60 X 15 mm) revestidas con papel de filtro humedecido sirven como sitio de prueba. Todos los discos de hoja se sumergen en la solución de tratamiento durante aproximadamente 3 segundos y se dejan secar durante 2 horas. Cada disco de hoja tratado se coloca en placas de Petri individuales y se inocula con 10 gorgojos adultos. Las placas de Petri luego se cubren con tapas. Todos los sitios de prueba se mantiene vano luz continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante el ensayo. Después de 3 días se observa el porcentaje de mortalidad.

25

En esta prueba, los compuestos B85 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

II.20 Actividad contra saltamontes de hojas verdes de arroz (*Nephotettix virescens*)

5 Los adultos de saltamontes de hoja utilizados en el ensayo biológico se obtienen de una colonia mantenida continuamente en condiciones de laboratorio. A los fines de la prueba, el compuesto de prueba se diluye en 300 ppm (peso del compuesto: diluyente de vol) en una mezcla 1:1 de acetona:agua, más 0,1% de agente tensoactivo EL 620.

10

La actividad del saltamontes se evalúa mediante la técnica de rociado foliar. Plantas de arroz en maceta (de 2-3 semanas, variedad TN-1) se limpian y secan antes de la aplicación. Todas las plantas se tratan dentro de la campana con atomizador DeVilbiss a 25 psi con un volumen de rociado de 5 ml /planta. A fin de
15 asegurar una distribución uniforme de rociado se colocan las plantas en un una forma plana rotatoria dentro de la campana. Las plantas tratadas se colocan luego dentro de la habitación y se dejan secar durante 2 horas. Cada planta se coloca en una jaula Milar (4 pulgada de diámetro X 19 pulgadas de altura) y se inocula con
10 saltamontes adultos. Todas las plantas estudiadas se mantiene bajo luz
20 continua y una temperatura de aproximadamente 28 °C durante el ensayo. Se observa el porcentaje de mortalidad después de 72 horas.

En esta prueba, los compuestos B85 a 300 ppm muestran una mortalidad de por lo menos 75% en comparación con controles no tratados.

25

III. Datos comparativos de la actividad biológica

271

Los datos comparativos de la actividad biológica de los compuestos (I) de acuerdo con la presente invención se compilan a continuación en la tabla F.

Tabla F

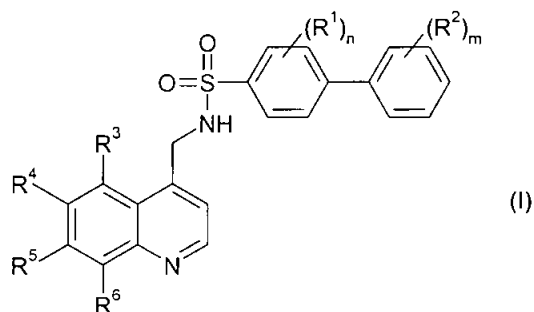
Método de evaluación	Compuesto	Mortalidad [%]		
		a 300 ppm	a 100 ppm	a 10 ppm
Áfido de durazno verde (II.2)	B14	90	90	n. d.
	C ₁	60	0	n. d.
	B24	100	90	90
	C ₂	100	60	0
Polilla de lomo en diamante (II.5)	B24	100	n.d.	n. d.
	C ₂	0	n.d.	n. d.
Saltamontes pardo de plantas (II.7)	B16	100	n.d.	n. d.
	C ₂	0	n.d.	n. d.

5

Dichos resultados demuestran claramente la mayor actividad biológica de los compuestos (I) de acuerdo con la presente invención.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de quinolina de la fórmula (I)



5

en donde

R^1 , R^2 son cada uno, independientemente, halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil C_3-C_7 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_2-C_6 , alquiniloxi C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -alcoxi C_1-C_4 , cicloalquil C_3-C_7 -alcoxi C_1-C_4 , $C(OH)(CF_3)_2$, haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalqueniloxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alquilsulfinilo C_1-C_6 , haloalquilsulfinilo C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , $C(R^a)=O$ o $C(R^a)=NOR^b$;

15

 R^a es hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ;

20

 R^b es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , o haloalquenilo C_2-C_4 ; R^3 , R^4 , R^5 , R^6 son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno,

ciano, amino, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, o C(=O)OR^c;

5

R^c es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, o alquino C₂-C₆;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

10

n es 1 ó 2;

y sus N-óxidos y sus sales.

15

2. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADOS porque n es 1.

20

3. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el sustituyente R¹ se une al grupo fenilo en la posición meta respecto del grupo funcional sulfonamida.

25

4. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el sustituyente R¹ se une al grupo fenilo en la posición orto respecto del grupo funcional sulfonamida.
5. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-

C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ o haloalquilsulfonilo C₁-C₆.

5

6. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 5, en donde R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en F, Cl, Br, CH₃, CHF₂, CF₃, OCH₃, OCHF₂ y OCF₃.

10 7. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde m es 1, 2 ó 3.

8. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R² se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ o haloalquilsulfonilo C₁-C₆.

15
20

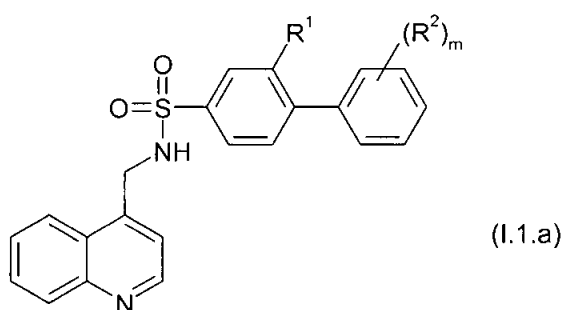
9. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 8, en donde R² se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en F, Cl, Br, CH₃, CHF₂, CF₃, OCH₃, OCHF₂ y OCF₃.

25 10. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R³, R⁴, R⁵, R⁶ se seleccionan cada uno, independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno,

alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alquiltio C₁-C₆.

11. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 10,
5 en donde R³, R⁴, R⁵, R⁶ son cada uno hidrógeno.

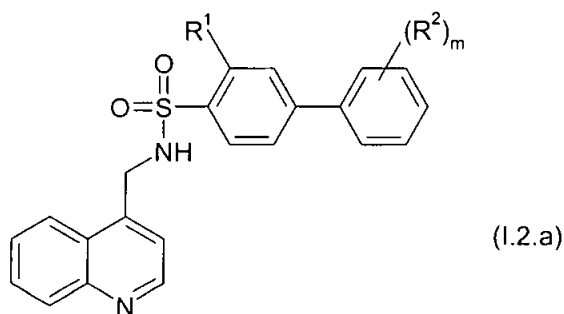
12. Compuestos de quinolina de la fórmula (I), denominados como compuestos de quinolina de la fórmula (I.1.a)



10 en donde

R¹, R² y m tienen los significados indicados en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.

13. Compuestos de quinolina de la fórmula (I), denominados como compuestos de quinolina de la fórmula (I.2.a)



en donde

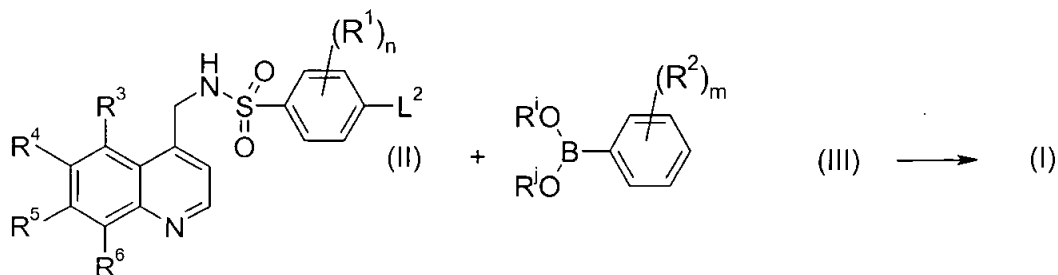
R^1 , R^2 y m tienen los significados indicados en cualquiera de las reivindicaciones precedentes.

5

14. Un proceso para la preparación de compuestos de quinolina de la fórmula (I) como se define en las reivindicaciones 1 a 13, que comprende:

10

hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II) con un derivado de ácido borónico de la fórmula (III) en presencia de una base y un catalizador de metal de transición para dar compuestos de quinolina de la fórmula (I),



15

donde las variables en los compuestos (II) y (III) anteriores tienen el significado indicado anteriormente para los compuestos de quinolina de la fórmula (I), R^i y R^j son cada uno, independientemente, hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , o R^i y R^j forman juntos un grupo funcional 1,2-etileno o 1,2-propileno, cuyos átomos de carbono pueden no estar sustituidos o pueden estar sustituidos todos o en parte con grupos metilo, y L^2 es un grupo saliente adecuado.

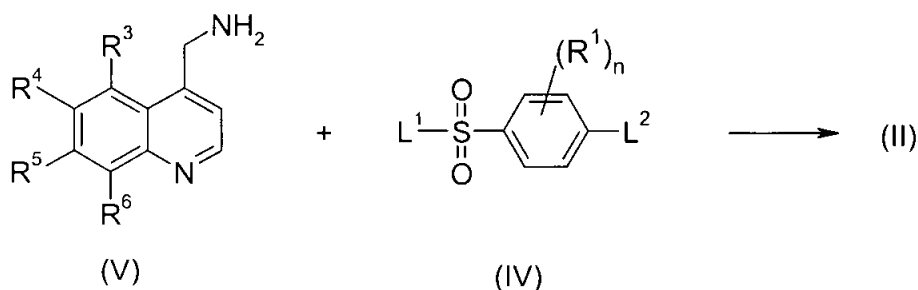
20

15. Un proceso para la preparación de compuestos de quinolina de la fórmula (I)

de acuerdo con la reivindicación 14, que comprende adicionalmente:

hacer reaccionar un cloruro de sulfonilo (IV) con una quinolina (V) en presencia de una base para obtener un compuesto de la fórmula (II),

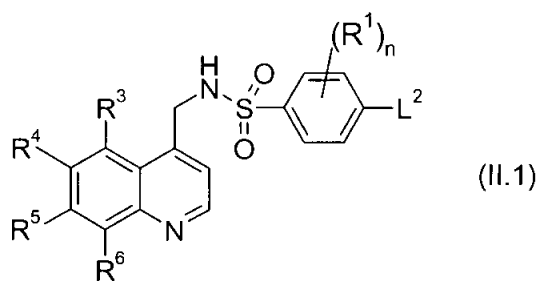
5



en donde las variables en los compuestos (IV) y (V) anteriores tienen el significado definido anteriormente para los compuestos de quinolina de la fórmula (I), y L¹ y L² son grupos salientes adecuados.

10

16. Un compuesto de la fórmula (II.1)



en donde

15

L² es cloro, bromo o yodo y n, R¹, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ tienen los significados dados en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13.

17. Uso de los compuestos de la fórmula (I) y sus N-óxidos o sales de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, en donde sirve para combatir

20

plagas de artrópodos o nematodos.

18. Composiciones, que comprenden por lo menos un compuesto de la fórmula (I)
y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales de acuerdo con las
reivindicaciones 1 a 13 y un material portador.

19. Un método para controlar plagas de artrópodos o nematodos, que comprende
poner en contacto el insecto, arácnido o nematodo o su suministro de
alimento, hábitat, lugar de incubación o locus con por lo menos un
compuesto de las fórmulas (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales
agrícolumente aceptables de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 13.

20. Un método para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación de
plagas de artrópodos o nematodos, que comprende aplicar a las plantas o
al suelo o al agua en la que crecen, por lo menos un compuesto de la
fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícolumente
aceptables de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 13.

21. El método de acuerdo con la reivindicación 19 ó 20, en donde por lo menos un
compuesto de la fórmula (I) y/o el N-óxido o una sal agrícolumente
aceptable se aplica en una cantidad de 5 g/ha a 2000 g/ha, calculado como
compuesto de la fórmula (I).

22. Un método para proteger semillas, que comprende poner en contacto las
semillas con por lo menos un compuesto de las fórmulas (I) y/o uno de sus
N-óxidos o una de sus sales agrícolumente aceptables como se define en
las reivindicaciones 1 a 13 o una composición que contiene por lo menos

uno de estos compuestos en cantidades pesticidamente efectivas.

23. Un método de acuerdo con la reivindicación 22, en donde por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales
5 agrícola­mente aceptables se aplica en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por cada 100 kg de semillas, calculado como compuesto de la fórmula (I).

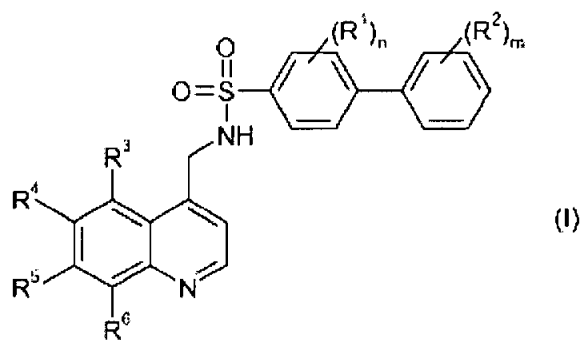
24. Semilla, que comprende por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales agrícola­mente aceptables de acuerdo
10 con las reivindicaciones 1 a 13.

25. Un método para tratar, controlar, prevenir o proteger a animales contra la infestación o la infección por parásitos, que comprende la administración o la aplicación a los animales de una cantidad parasiticidamente efectiva de
15 por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y/o un N-óxido o una de sus sales veterinariamente aceptables como se define en las reivindicaciones 1 a 13.

26. Mezclas pesticidas sinérgicas, que comprenden un compuesto de la fórmula (I)
20 y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales como se define en las reivindicaciones 1 a 13 y un pesticida seleccionado de organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento, neonicotinoides, compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico, compuestos antagonistas de GABA, insecticidas macrocíclicos de lactona, compuestos
25 de METI I, II y III, compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa, compuestos interruptores de la muda, compuestos inhibidores de la oxidasa de función mixta, compuestos bloqueantes del canal de sodio, benclotiaz,

5

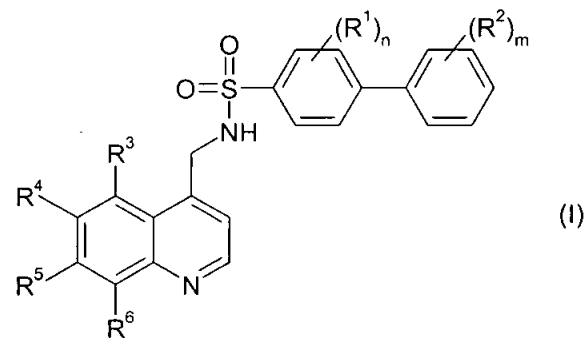
bifenazato, cartap, flonicamida, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, flubendiamida, cianopirafeno, flupirazofos, ciflumetofeno, amidoflumet, antranilamidas y N-R'-2,2-dihalo-1-R''-ciclopropanocarboxamid-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')-propionamid-2-(2,6-dicloro- 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 QUINOLINILMETILO

RESUMEN:

La presente invención se relaciona con compuestos novedosos de (quinolin-4-ilmetil)-amida de ácido bifenil-4-sulfónico de la fórmula (I)



en donde R¹ y R² son halógeno, OH, CN, NH₂, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenoilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, etc.; R³, R⁴, R⁵, R⁶ son halógeno, H, CN, NH₂, NO₂, OH, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, etc.; m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5; y n es 1 ó 2; y sus N-óxidos y sus sales, y su uso para combatir plagas de artrópodos y nematodos, y también con composiciones que comprenden tales compuestos como componente activo. La presente invención también se relaciona con un método para controlar plagas de artrópodos o plagas de nematodos.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/059538

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07D215/12 C07D215/18 C07D215/20

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 2005/033081 A (BASF AG [DE]; GRAMMENOS WASSILIOS [DE]; BLETNER CARSTEN [DE]; MUELLER) 14 April 2005 (2005-04-14) cited in the application claim 1	1-26
P, X	WO 2006/097488 A (BASF AG [DE]; PUHL MICHAEL [DE]; KORADIN CHRISTOPHER [DE]; RHEINHEIMER) 21 September 2006 (2006-09-21) cited in the application claim 1	1-26

☐ 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.
- *Z* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

23 November 2007

Date of mailing of the international search report

05/12/2007

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

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2007/059538

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

Although claims 17-21 and 25 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 No. 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 allsearchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search reportcovers 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 and, where applicable, the payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2007/059538

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005033081	A	14-04-2005	AU 2004278095 A1	14-04-2005
			BR PI0414410 A	14-11-2006
			CA 2537486 A1	14-04-2005
			CN 1852895 A	25-10-2006
			JP 2007505849 T	15-03-2007
			KR 20060070563 A	23-06-2006
			MX PA06002500 A	20-06-2006
			US 2006293314 A1	28-12-2006

WO 2006097488	A	21-09-2006	AR 053556 A1	09-05-2007
			AU 2006224567 A1	21-09-2006
			CA 2599551 A1	21-09-2006

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference M/47124-PCT		FOR FURTHER ACTION See Form PCT/PEA/416	
International application No. PCT/EP2007/059538		International filing date (day/month/year) 11.09.2007	Priority date (day/month/year) 12.09.2006
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC INV. C07D215/12			
Applicant BASF SE			
1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☐ sent to the applicant and to the International Bureau a total of sheets, as follows: ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in electronic form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).			
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the report ☐ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement ☒ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 2008-06-26		Date of completion of this report 04.09.2008	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465		Authorized officer Wolf, Claudia Telephone No. +49 89 2399-8285 	

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

286
International application No.
PCT/EP2007/059538

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the **language**, this report is based on

- ☒ the international application in the language in which it was filed
- ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of:
- ☐ international search (under Rules 12.3(a) and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4(a))
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2(a) and/or 55.3(a))

2. With regard to the **elements*** of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report):*

Description, Pages

1-82 as originally filed

Claims, Numbers

1-26 as originally filed

☐ a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages
- ☐ the claims, Nos.
- ☐ the drawings, sheets/figs
- ☐ the sequence listing (*specify*):
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*):

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages
- ☐ the claims, Nos.
- ☐ the drawings, sheets/figs
- ☐ the sequence listing (*specify*):
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*):

5. ☐ This opinion has been established taking into account the **rectification of an obvious mistake** authorized by or notified to this Authority under Rule 91 (Rule 70.2 (e)).

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2007/059538

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

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	<u>1-26</u>
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	<u>1-26</u>
	No: Claims	
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	<u>1-26</u>
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

Box No. VI Certain documents cited

1. Certain published documents (Rule 70.10)
and /or

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

see separate sheet

Re Item V.

Reference is made to the following document:

D1 : WO 2005/033081 A (BASF AG [DE]; GRAMMENOS WASSILIOS [DE]; BLETTNER CARSTEN [DE]; MUELLER) 14 April 2005 (2005-04-14) cited in the application.

The subject matter claimed is considered to be a selection of the subject matter already generically disclosed in D1 due to the case that always a substituent R1 has to be present in the subject matter claimed in the present application. The subject matter claimed is therefore novel over D1 (Article 33(2) PCT).

The technical problem underlying the present application was the provision of further compounds useful in combatting antropodes pests and nematodes.

In the light of the comparative test results submitted by the Applicant on 27.06.08 the Applicant has demonstrated a superior effect of the claimed compounds over the prior art compounds of D1. Thus the subject matter claimed appears to involve an inventive step (Article 33(3) PCT).

Claims 17-21,25 relate to subject-matter considered by this Authority to be covered by the provisions of Rule 39.1(iv) / 67.1(iv) PCT. The patentability can be dependent upon the formulation of the claims. The EPO, for example, does not recognise as patentable claims to the use of a compound in medical treatment, but may allow claims to a product, in particular substances or compositions for use in a first or further medical treatment.

Re Item VI.

D2 : WO 2006/097488 A (BASF AG [DE]; PUHL MICHAEL [DE]; KORADIN CHRISTOPHER [DE]; RHEINHEIMER) 21 September 2006 (2006-09-21) cited in the application will not be considered at this stage, since it is not prepublished to the

289

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

International application No.

PCT/EP2007/059538

priority date of the present application and it is assumed that the priority has been
validly claimed.

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

REITSTÖTTER, KINZEBACH & PARTNER
Ludwigsplatz 4
67059 Ludwigshafen
ALLEMAGNEDate of mailing (day/month/year)
09 April 2008 (09.04.2008)Applicant's or agent's file reference
M/47124-PCTInternational application No.
PCT/EP2007/059538

IMPORTANT NOTIFICATION

International filing date (day/month/year)
11 September 2007 (11.09.2007)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☐ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address

BASF AKTIENGESELLSCHAFT
67056 Ludwigshafen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☐ the person ☒ the name ☐ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address

BASF SE
67056 Ludwigshafen
Germany

State of Nationality

DE

State of Residence

DE

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☐ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Blanc Veronique

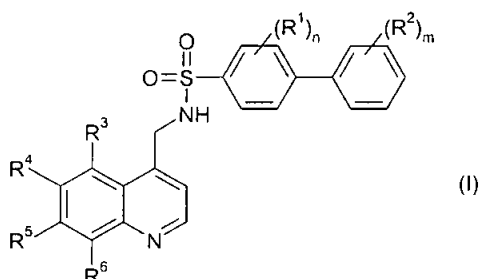
Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail Veronique.Blanc@wipo.int
Telephone No. +41 22 338 96 66

(21) N° de solicitud: 22) Fecha de solicitud: (30) Prioridad (31) Prioridad (32) Fecha (33) País 60/844,023 12/09/2006 US	(51) Int Cl: C07D 215/012 (71) Solicitante(s) BASF SE (72) Inventor(es) MICHAEL PUHL Y OTROS (74) Apoderado: EMILIO FERRERO
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 12/04/2009 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 11/09/2007 No. de solicitud PCT/EP2007/059538	(87) Publicación internacional Fecha: 20/03/2008 N° publicación: WO 2008/031824 A1
(54) Título: COMPUESTOS DE QUINOLINILMETILO	

Reivindicación(es):

1. Compuestos de quinolina de la fórmula (I)



en donde

R¹, R² son cada uno, independientemente, halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil C₃-C₇-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquenoiloxi C₂-C₆, alquinoiloxi C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₇-alcoxi C₁-C₄, C(OH)(CF₃)₂, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquenoiloxi C₂-C₆, alquilitio C₁-C₆, haloalquilitio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, C(R^a)=O o C(R^a)=NOR^b;

R^a es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

R^b es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, o haloalquenilo C₂-C₄;

R³, R⁴, R⁵, R⁶ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, amino, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, o C(=O)OR^c;

R^c es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, o alquinilo C₂-C₆;

m es 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

nes 1 ó 2:

y sus N-óxidos y sus sales.

2. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADOS porque n es 1.

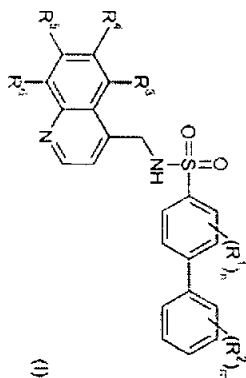
3. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el sustituyente R¹ se une al grupo fenilo en la posición meta respecto del grupo funcional sulfonamida.

4. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el sustituyente R¹ se une al grupo fenilo en la posición orto respecto del grupo funcional sulfonamida.

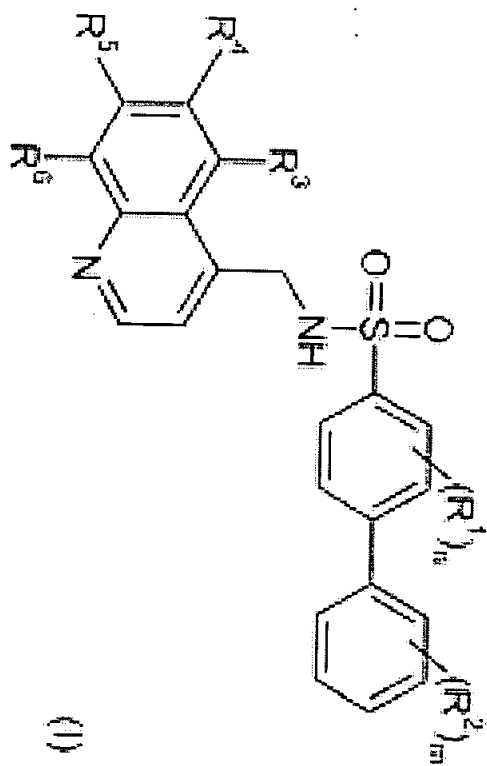
5. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinoxilo C₂-C₆, haloalquinoxilo C₂-C₆, alquinoxilo C₂-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆ o haloalquilsulfonilo C₁-C₆.

6. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 5, en donde R¹ se selecciona, independientemente, del grupo que consiste en F, Cl, Br, CH₃, CHF₂, CF₃, OCH₃, OCHF₂ y OCF₃.

7. Compuestos de quinolina de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde m es 1, 2 ó 3.



(ii)



(i)

293

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 16,805
FECHA : MARZO 2 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-025822- -00000-0000

Fecha: 2009-03-12 16:59:06 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 379 FASE NACIONAL II
Act. 411 PRESENTACION Folios: 295

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	19779045	02/03/2009	49,796,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	540,000.00
		TOTAL :	\$ 540,000.00

SON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

060 16452-841-027-1

294

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 16,768
FECHA : MARZO 2 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-025822- -00000-0000

Fecha: 2009-03-12 16:59:06 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 411 PRESENTACION Folios: 295

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	19779045	02/03/2009	49,796,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		90 INSCRIPCION DE RENUNCIA DE DERECH	273,000.00
		TOTAL :	\$ 273,000.00

SON: DOSCIENTOS SETENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Celo 16452-841-027-1

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

294
295

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2



CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 12,696
FECHA : FEBRERO 16 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	19779093	16/02/2009	16,385,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 16452-841-027-1

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

295.
296

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-025822- -00000-0000

Fecha: 2009-03-12 16:59:06 Dep. 2020 NUECREACION I
Tra. 11 PATENTE I Y II Eve: 379 FASE NACIONAL II
Act. 411 PRESENTACION Folios: 295

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 12,895
FECHA : FEBRERO 16 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	19779093	16/02/2009	16,385,000.00

***** CONCEPTO *****

CONT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
	TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

0610 16452 -841-027-1

209

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-025822- -00000-0000

Fecha: 2009-03-12 16:59:06 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 411 PRESENTACION Folios: 295



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 ☐

Claudia M. Nova Cortes
Firma Responsable

Fecha _____

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

298

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 297

020
Bogotá D.C.,

Autor(a)
ERRERO EMILIO
poderado(a) y/o Representante de
ASF SE

REFERENCIA	Radicación No.	09 25822
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/059538
	Fecha inicio fase nacional	12/04/2009
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	8003
	Folios	1

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

Úmplase
en Bogotá DC,

03 JUN. 2009

LIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

fernand