



Organización y
Digitalización CSA Ltda

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio
INVENTARIO

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

09-94512

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO DERIVADOS INSECTICIDAS DE BENZILAMINAS
SUSTITUIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER CROPS SCIENCE AG

DOMICILIO MONHEIN. ALEMANIA

74. APODERADO JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

22. BOGOTÁ, D. C.,

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-094512- -00000-0000

Fecha: 2009-09-04 16:10:50 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEYII Eve. 378 FASENACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios 257

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

2

☒ Patente de Invención

SOLICITUD DE:

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☒ Capítulo I

☐ Capítulo II

3

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **BAYER CROPSCIENCE AG**
Dirección: **Alfred-Nobel -Str. 50, 40789 MONHEIM, ALEMANIA**
Nacionalidad o domicilio: **MONHEIN, ALEMANIA**
Lugar de Constitución: **MONHEIN, ALEMANIA**
Teléfono: Fax:
E-mail:

IDENTIFICACIÓN
C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual: _____
Número:

4

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**
Dirección: **Avda. Carrera 24 No. 37 - 31 Of. 202
BOGOTA D.C., COLOMBIA**
Teléfono: **2444096** Fax: **2442496**
E-mail

IDENTIFICACIÓN
C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cuál
Número: **19.270.955 T.P. 43.308 C.S.J.
BOGOTA**

5

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre:
Dirección: **VER HOJA ANEXA**
Nacionalidad o Domicilio:

6

PCT (86)
Solicitud Internacional No. **PCT/EP2008/002475** Fecha: **28 - 03 -08**
Publicacion Internacional No. **WO 2008/119511 A1** Fecha: **09 - 10 - 08**

7

Título (54)

DERIVADOS INSECTICIDAS DE BENCILAMINAS SUSTITUIDAS

Clasificación internacional (51) _____

8

Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

EP
EP

(32) Fecha

03/04/2007
13/04/2007

(31) Número de Solicitud

07006907.5
07007590.8

9

Comprobante de pago No.

Fecha:

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

INVENTORES

- 1) **ARNOLD, Christian**
Pastor-Löh-Str. 42, 40764 Langenfeld, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 2) **GÖRGENS, Ulrich**
Festerstrasse 37, 40882 Ratingen, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 3) **SCHWARZ, Hans-Georg**
Wolfhagener Str. 3, 40764 Langenfeld, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 4) **HOLMWOOD, Graham**
Hitdorfer Kirchweg 40, 51371 Leverkusen, ALEMANIA
Nacionalidad: Británica
- 5) **ANDREE, Roland**
Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 6) **MALSAM, Olga**
Vor dem Klosterhof 19, 51503 Rösrath ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 7) **SCHALLNER, Otto**
Noldeweg 22, 40789 Monheim, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 8) **FRANKEN, Eva-Maria**
422 Route de Bellevue, 69760 Limonest, FRANCIA
Nacionalidad: Alemana
- 9) **ANTONICEK, Horst-Peter**
Brahmstr. 2 A, 51467 Bergisch Gladbach, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 10) **WERNER, Stefan**
Oranienburger Str. 14, Monheim, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana

10

ANEXOS

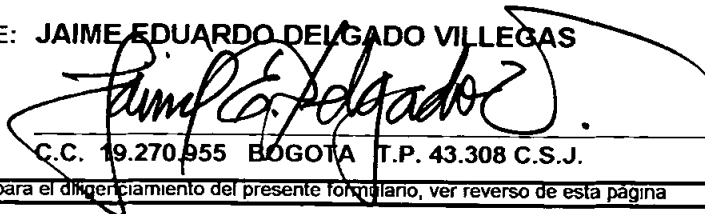
- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☐ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☐ Arte final 12X12 cm.
- ☐ De ser el caso, información de otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas total o parcialmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional, Nuevas Reivindicaciones
- ☒ Otros: Informe de Búsqueda de Antecedentes Internacional junto con la traducción
- ☒ Publicación Internacional No. WO/2008/119511 A1

FIGURA CARACTERISTICA

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

FIRMA:



C.C. 19.270.955 BOGOTÁ T.P. 43.308 C.S.J.

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

cas - Patentes
telos - Diseños
nbres Comerciales - Enseñas
piedad Intelectual
istros en el Exterior
istros Sanitarios INVIMA - ICA
iones Judiciales - Administrativas
echo Comercial - Industrial
soria - Contratos - Otros
responsalla a Nivel Mundial



Bogotá D.C. - Colombia
Avda. 22 Park Way No. 37 - 31 Of. 202
Tels. (571) 2444096 - 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com

Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.

Miembros ACPI - ASIPI - AIPPI

Abogados Consultores - Marcas y Patentes

The Undersigned José Antonio Hernández Rodríguez, citizen, adult and living in Spain, in my position of legal Representative of the company Bayer CropScience AG with headquarters in Alfred-Nobel-Strasse 50 (building 6100), 40789 Monheim, Germany, which was initially incorporated at Monheim, Germany, grant ample an sufficient power of attorney to: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS and/or CLEMENCIA DELGADO VILLEGAS, attorneys, adults, residing in Bogotá (Colombia), so that on our behalf and representation, carry out in Colombia and in any other Countries all types of errands an especial procedures for the registration and renewal of all kinds of Product and Service trademarks, deposits of name and commercial logotipe, industrial models and drawings, invention patents, utility models, Integrated circuits, name of domain, Copyrights, plant varieties, agricultural, veterinary and sanitary registries, capacity certificates, renewal, modification, transfer, assignment and expansions and to be responsible as general attorneys, for the supervision of all matters related to industrial and Intellectual property, being empowered to present and withdraw objections, to present appeals, to request testimonies, to receive documents, to pay legal fees, to approve exploitations, to agree on transactions on trademark agreements with third parties of legal entities, to abandon action, to substitute and to carry out all the necessary actions before any administrative authority of the aforementioned purposes in the event that such procedures shall be transferred unto a judicial field, the legal representatives are authorized to act as plaintiff or defendant before the competent authorities, having an ample power to settle, to submit to arbitration, to waive, to present appeals and all other necessary special faculties.
For that purpose, I kindly request to gran ample powers to our attorneys, who shall be able to exercise the functions independently or collectively.
The present power of attorney revokes and cancels any other previous powers of attorney given by the Company in the territory of the Colombian Republic
Sincerely,

Atentamente se dirige a Usted José Antonio Hernández Rodríguez, ciudadano español, mayor y vecino de Madrid, para manifestarle que en mi condición de Representante legal de la firma Bayer CropScience AG domiciliada en Alfred-Nobel-Strasse 50 (building 6100), 40789 Monheim, Alemania, y constituida inicialmente en Monheim, Alemania, confiero poder general, amplio y suficiente a los Dres. JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS, y/o CLEMENCIA DELGADO VILLEGAS, Abogados, mayores y vecinos de Bogotá, D.C. (Colombia), para que en nuestro nombre y representación adelanten en Colombia y en otros países toda clase de diligencias y procedimientos especiales para el Registro y Renovación en su Despacho, de toda clase de Marcas de Producto y Servicio, Depósitos de Nombre y Enseña Comercial, Diseños Industriales y Patentes de Invención, Patentes modelo de Utilidad, Esquemas de Circuitos integrados, Nombres de dominio, Derechos de Autor, Variedades vegetales, registros agrícolas, veterinarios y sanitarios, certificados de capacidad, renovación, modificación, traspaso y ampliación de los mismos y atiendan como Apoderados generales todo asunto referente a la Propiedad Industrial e intelectual, quedando facultados para presentar y retirar Oposiciones, interponer recursos, solicitar testimonios, recibir documentos, cancelar costos legales, probar explotaciones, aceptar transacciones, llegar a acuerdos marcarios con terceras personas o entidades jurídicas, desistir, sustituir y hacer cuanto fuere necesario ante cualquier autoridad administrativa para los fines arriba indicados; y en caso de que el procedimiento debiera pasar a conocimiento judicial, quedan facultados para actuar como demandantes o demandados ante los Jueces que sean competentes, con poder amplio, pudiendo transar, someter a árbitros, desistir, interponer recursos y con todas las demás facultades especiales que fueren necesarias.
Con éste objeto, ruego le confieran personería suficiente a nuestros Apoderados quienes podrán obrar en forma conjunta o independiente e incluso sustituir el presente poder.
Atentamente,

3371530Y Madrid
ID Card No. issued in

3371530Y Madrid
DNI Rpxed do en

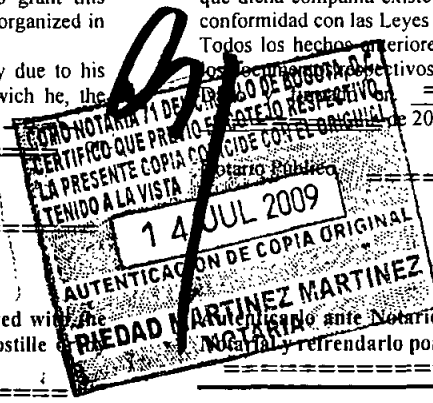
Please, submit to a public deed by public notary

Notarial Certificate:

The undersigned Notary Public certifies that the preceding signature reading José Antonio Hernández Rodríguez is authentic: that signer is (Authorised signatory) of Bayer CropScience AG and that he is empowered to grant this power, and that said Company exists and is duly organized in accordance with the laws of Monheim, Germany.
All the foregoing facts are know to the Notary due to his having examined the respective documents to wich he, the Notary, attests.
Granted and signed, at 200

Certificación Notarial:

El infrascrito Notario Público certifica que la firma que antecede y dice José Antonio Hernández Rodríguez es auténtica: que el firmante es (Firmante autorizado) de Bayer CropScience AG, que tiene facultad para otorgar este poder y que dicha compañía existe y está debidamente organizada de conformidad con las Leyes de Monheim, Alemania.
Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los documentos respectivos y de todo ello da fe.
El 14 de JULIO de 2009



Notary Public.

This Power of Attorney should be authenticated with the filed Notarial certificate and legalized by Apostille in the Colombian Consulate.

LE. . . //

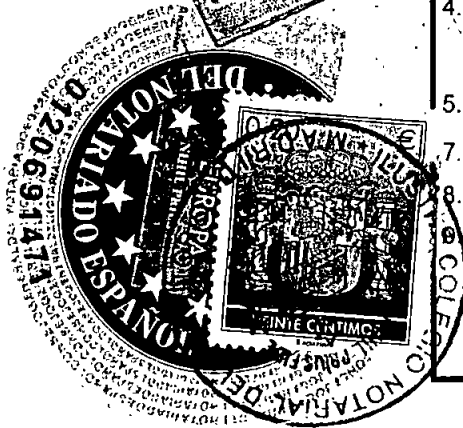
...//GITIMACIÓN: Yo, SANTIAGO RUBIO LINIERS, No-
tario del Ilustre colegio de Madrid con residencia
en esta Capital:-----

Conozco y considero legítima la firma que ante-
cede de don JOSÉ ANTONIO HERNÁNDEZ RODRÍGUEZ Y que he
levantado acta del presente documento con el número
901 ,de mi protocolo, a los efectos del artículo 207
del reglamento Notarial. En Madrid a siete de abril
de dos mil ocho. DOY FE.=.

[Handwritten signature of Santiago Rubio Liniers]

0.15
e

SELLO DE
LEGITIMACIONES Y
LEGALIZACIONES



Apostille (o legalización única)
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
(Real Decreto 2433/1978, de 2 de octubre)

Pais: *España*

El presente documento público

Ha sido firmado por D. **Santiago Rubio Liniers**

Actuando en calidad de NOTARIO

Se halla sellado / timbrado con el de su Notaría

CERTIFICADO

5. En Madrid 6. El **10 . Abril . 2008**

7. Por el Decano del Colegio Notarial de Madrid.

8. Con el número **25048**

9. Sello / timbre:

Firma

[Handwritten signature of Dña M. Nieves González de Echavarría Díaz]
Dña M. Nieves González de Echavarría Díaz
Firma Delegada del Decano

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

BAYER CROPSCIENCE AG
Business Planning and Administration,
Law and Patents, Patents and Licensing
Building 6100, Alfred-Nobel-Str 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 28 April 2008 (28.04.2008)	
Applicant's or agent's file reference BCS073025-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2008/002475	International filing date (day/month/year) 28 March 2008 (28.03.2008)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 03 April 2007 (03.04.2007)
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG et al	

1. By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
3. (If applicable) An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
03 April 2007 (03.04.2007)	07006907.5	EP	21 April 2008 (21.04.2008)
13 April 2007 (13.04.2007)	07007590.8	EP	21 April 2008 (21.04.2008)

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70	Authorized officer Agnes Wittmann-Regis e-mail PT06.PCT@WIPO.INT Telephone No. +41 22 338 74 06
---	--

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
9 October 2008 (09.10.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/119511 A1

(51) International Patent Classification:
A01N 43/76 (2006.01) A01P 7/00 (2006.01)
C07D 263/28 (2006.01) A01P 9/00 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/EP2008/002475

(22) International Filing Date: 28 March 2008 (28.03.2008)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
07006907.5 3 April 2007 (03.04.2007) EP
07007590.8 13 April 2007 (13.04.2007) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): ARNOLD, Christian [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 42, 40764 Langenfeld (DE). GÖRGENS, Ulrich [DE/DE]; FesterStr. 37, 40882 Ratingen (DE). SCHWARZ, Hans-Georg [DE/DE]; Heinenbusch 19 c, 40764 Langenfeld (DE). HOLMWOOD, Graham [GB/DE]; Hildorfer Kirchweg 40, 51371 Leverkusen (DE). ANDREE, Roland [DE/DE]; Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld (DE). MALSAM, Olga [DE/DE]; Vor dem Klosterhof 19, 51503 Rösrath (DE). SCHALLNER, Otto [DE/DE]; Noldeweg 22, 40789 Monheim (DE). FRANKEN, Eva-Maria

[DE/DE]: Sternstr. 21, 42799 Leichlingen (DE). ANTONICEK, Horst-Peter [DE/DE]: Brahmstr. 2 A, 51467 Bergisch Gladbach (DE). WERNER, Stefan [DE/DE]; Oranienburger Str 14, 40789 Monheim (DE).

(74) Common Representative: BAYER CROPSCIENCE AG; Business Planning and Administration, Law and Patents, Patents and Licensing, Building 6100, Alfred-Nobel-Str 50, 40789 Monheim (DE).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, 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.

(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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, 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
— before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments

(54) Title: INSECTICIDAL DERIVATIVES OF SUBSTITUTED BENZYLAMINES

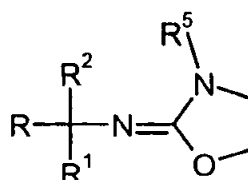
(57) Abstract: The present invention relates to novel derivatives of substituted benzylamines, to processes for their preparation and to their use for controlling animal pests, especially arthropods, in particular insects.



WO 2008/119511 A1

Insecticidal derivatives of substituted benzylamines

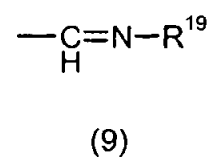
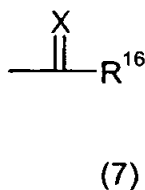
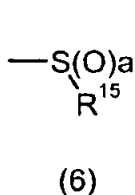
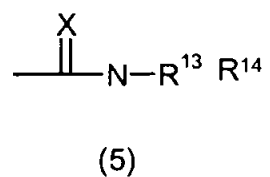
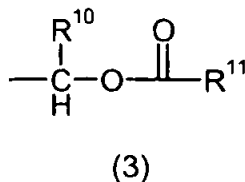
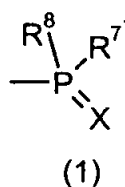
The present application relates to novel insecticidal derivatives of substituted benzylamines, to processes for their preparation and to their use for controlling animal pests, especially arthropods, in particular insects.

5 **Insecticidal and acaricidal benzylamino heterocyclic derivatives of the general formula**

wherein

R is 1-naphthyl, phenyl or phenyl substituted with one or two substituents selected from halogen or (C₁-C₂) alkyl;

- 10 R¹ is selected from hydrogen, (C₁-C₄) alkyl and (C₁-C₂) haloalkyl; R² is hydrogen; R⁵ is selected from cyano, (C₁-C₂) alkoxy(C₁-C₂) alkyl, 4-(C₁-C₂) alkoxybenzyl,



where

- 15 X is oxygen or sulfur; R⁷ and R⁸ are (C₁-C₂) alkoxy or (C₁-C₂) haloalkyl; R¹⁰ is hydrogen; R¹¹ is (C₁-C₄) alkyl; R¹³ is (C₁-C₂) alkyl; R¹⁴ is hydrogen or (C₁-C₂) alkyl; a is 2; R¹⁵ is (C₁-C₂) alkyl or (C₁-C₂) dialkylamino; R¹⁶ is (C₁-C₂) alkyl or (C₁-C₂) alkoxy; and R¹⁹ is (C₁-C₂) alkyl or (C₁-C₂) alkoxy;

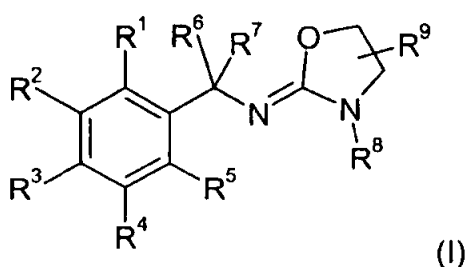
provided that when R is 1-naphthyl and R⁵ is formula (5) where X is sulfur, R¹³ is methyl and R¹⁴

is hydrogen, then R^1 is other than (C_1-C_2) alkyl; and when R is 3-chloro-2-methylphenyl and R^1 is hydrogen, then R^5 is other than formula (5) where X is oxygen, R^{13} is methyl and R^{14} is hydrogen or formula (6) where a is 2 and R^{15} is methyl,

are described as one embodiment in WO 2006/127426 (cf. e.g. formula IB, page 8).

- 5 There is however a continuing demand for new insecticides and acaricides that are not only safer and less costly than the known compounds but are in particular more effective.

This invention now provides novel compounds of the formula (I)



in which

- 10 R^1, R^2, R^3, R^4 , and R^5 independently from each other represent hydrogen, halogen, hydroxy, alkyl, alkoxy, haloalkyl, alkoxyalkyl, cycloalkyl, cyanoalkyl, haloalkoxy, alkylthio, haloalkylthio, alkylsulfonyl, alkylsulfonyloxy, halogenalkylsulfonyl, halogenalkylsulfonyloxy, alkoxy carbonyl, acetyl, alkyl carbonyl, alkenyl carbonyl, pentafluorosulfanyl, amino, mono- and dialkylamino, cycloalkylamino, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, cyano, or
- 15 nitro, or represent independently from each other aryl, aryloxy or heteroaryl which are optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, alkoxy carbonyl, nitro, and cyano;

- R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylmercaptoalkyl, alkenyl, or alkynyl, or represent independently from each
- 20 other aryl, heteroaryl or heterocyclyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, alkoxy, nitro, and cyano;

R^8 represents $-C(Z)R^{10}$, $-C(Z)OR^{10}$, or $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z represents O or S;

R^9 represents hydrogen, alkyl, or haloalkyl;

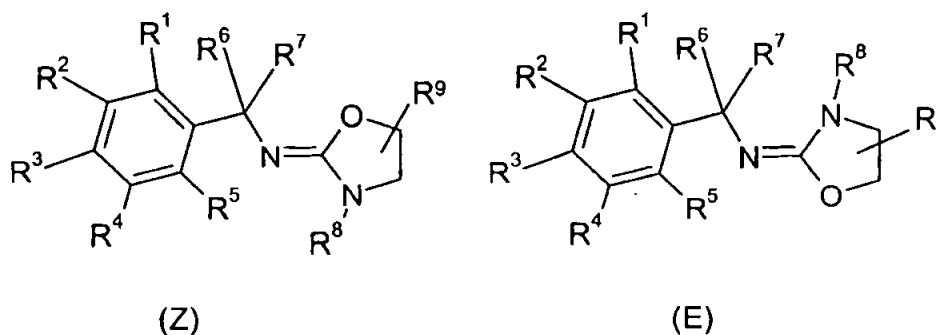
- R¹⁰ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto and cyano, or represents C₃-C₆ alkyl, cycloalkyl, or benzyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, and alkoxy;
- 5 R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl and cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkenyl, or alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, 10 optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, heterocyclyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, S(O)_n-alkyl, and S(O)_n-halogenalkyl;
- 15 R¹² represents hydrogen or alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, cyano, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclylalkyl, aryl, or heteroaryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, S(O)_n-alkyl, and S(O)_n-halogenalkyl; and
- 20 n is 0, 1 or 2.

Depending inter alia on the nature of the substituents, the compounds of the present invention may be present as geometrical and/or as optically active isomers or corresponding isomer mixtures of varying composition. Molecules that are not superimposable on their mirror image are called chiral; these molecules are optically active. If a molecule is nonsuperimposable on its mirror image, the mirror image must be a different molecule, since superimposability is the same as identity. 25 In each case of optical activity of a pure compound there are two and only two isomers, called enantiomers, which differ in structure only in the left- and right-handedness of their orientations. Enantiomers differ in that they rotate the plane of polarized light in opposite directions and in that they react at different rates with other chiral compounds or in the presence of a chiral catalyst (cf. 30 March's Advanced Organic Chemistry 5th edition ; Wiley 2001 page 125-126).

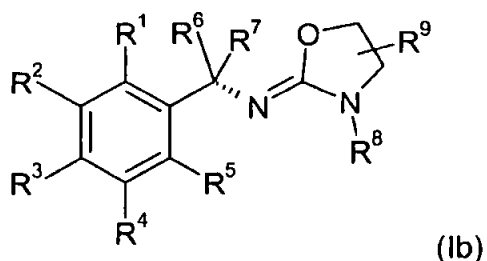
Provided that substituents R⁶ and R⁷ are different, the C-atom they are attached to is asymmetric or chiral and the respective compound is optically active. According to the Cahn-Ingold-Prelog system that ranks the four groups on an asymmetric carbon atom in order of decreasing atomic num-

ber, the asymmetric C-atom is present in S- or R-configuration (cf. March's Advanced Organic Chemistry 5th edition ; Wiley 2001 page 139).

- Compounds in which rotation is restricted may exhibit cis-trans isomerism. One type of cis-trans isomerism results from double bonds, such as the N=Oxazolidine-double bond. Based on the Cahn-Ingold-Prelog system, ranking the groups at each atom of the double bond in order of decreasing atomic number, the compounds according to the invention can be present in the Z or E form, Z being the isomer with the two higher ranking groups on the same side of the double bond (cf. March's Advanced Organic Chemistry 5th edition; Wiley 2001 page 157-158).



- Formula (I) of the present invention comprises both the pure R and S enantiomers and the enantiomer mixtures or racemates. Preferred are compounds of formula (Ib)



in which R¹ to R⁹ are as defined above for formula (I). Depending on the actual substituents R¹ to R⁷, the asymmetric C-atom might be present in the R- or the S-configuration.

- There is no disclosure or suggestion in WO 2006/127426 of the structures of the novel compounds of formula (I) of the present invention. In particular, there is no disclosure or suggestion in WO 2006/127426 of the surprisingly and significantly improved insecticidal activity of the compounds of formula (Ib) over their optical antipodes or the racemates, respectively.

- As used herein, the "optical antipode" of an S-enantiomer is defined as the corresponding R-enantiomer that differs only in the configuration of the asymmetric C-atom and rotates the plane of polarized light in the opposite direction. Accordingly, the optical antipode of an R-enantiomer is

the corresponding S-enantiomer.

The formula (I) provides a general definition of the compounds according to the invention.

Preferred substituents or ranges of the radicals given in the formulae mentioned above and below are illustrated below.

5 According to a further preferred embodiment of the invention,

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , and R^5 of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, preferably chlorine or fluorine, hydroxy, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl, preferably C_1 - C_2 haloalkyl, $(C_1$ - C_4)alkoxy(C_1 - C_4)alkyl, preferably $(C_1$ - C_2)alkoxy(C_1 - C_2)alkyl, C_3 - C_8 cycloalkyl, preferably C_3 - C_6 cycloalkyl, cyano(C_1 - C_4)alkyl, preferably cyano(C_1 - C_2)alkyl, halo(C_1 - C_4)alkoxy, preferably halo(C_1 - C_2)alkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, preferably C_1 - C_2 alkylthio, halo(C_1 - C_4)alkylthio, preferably halo(C_1 - C_2)alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyloxy, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyloxy, halogen(C_1 - C_4)alkylsulfonyl, preferably halogen(C_1 - C_2)alkylsulfonyl, halogen(C_1 - C_4)alkylsulfonyloxy, preferably halogen(C_1 - C_2)alkylsulfonyloxy, C_1 - C_4 alkoxycarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkoxycarbonyl, acetyl, C_1 - C_4 alkylcarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkylcarbonyl, C_2 - C_4 alkenylcarbonyl, pentafluorosulfanyl, amino, mono- and di(C_1 - C_4)alkylamino, preferably mono- and di(C_1 - C_2)alkylamino, C_3 - C_8 cycloalkylamino, preferably C_3 - C_6 cycloalkylamino, C_2 - C_4 alkenyl, halo(C_2 - C_4)alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, halo(C_2 - C_4)alkynyl, cyano, or nitro, or represent independently from each other C_5 - C_8 aryl, preferably C_5 - C_6 aryl, C_5 - C_8 aryloxy, preferably C_5 - C_6 aryloxy, or heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, which are optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, halo(C_1 - C_4)alkyl, preferably halo(C_1 - C_2)alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, halo(C_1 - C_4)alkoxy, preferably halo(C_1 - C_2)alkoxy, C_1 - C_4 alkoxycarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkoxycarbonyl, nitro, and cyano;

R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, preferably C_1 - C_2 haloalkyl, C_3 - C_8 cycloalkyl, preferably C_3 - C_6 cycloalkyl, $(C_1$ - C_4)alkoxy(C_1 - C_4)alkyl, preferably $(C_1$ - C_2)alkoxy(C_1 - C_2)alkyl, C_1 - C_4 alkylmercapto(C_1 - C_4)alkyl, preferably C_1 - C_2 alkylmercapto(C_1 - C_2)alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, or C_2 - C_4 alkynyl, or represent independently from each other C_5 - C_8 aryl, preferably C_5 - C_6 aryl, heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, or heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more

heteroatoms selected from O, N, P, and S, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, nitro, and cyano;

R⁸ represents -C(Z)R¹⁰, -C(Z)OR¹⁰, or -C(Z)NR¹¹R¹²;

5 Z represents O or S;

R⁹ represents hydrogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, or C₁-C₄ haloalkyl, preferably C₁-C₂ haloalkyl;

10 R¹⁰ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, and cyano, or represents C₃-C₆ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, or benzyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, and C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy;

15 R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, and cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, (C₃-C₆)cycloalkyl(C₁-C₄)alkyl, C₂-C₄ alkenyl, or C₂-C₄ alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, halo(C₁-C₄)alkyl, preferably halo(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, 20 C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, and di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, or represents 25 C₅-C₈ aryl(C₁-C₄)alkyl, preferably C₅-C₆ aryl(C₁-C₂)alkyl, heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P and S, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, C₅-C₈ aryl, heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, or heteroaryl(C₁-C₄)alkyl, preferably heteroaryl(C₁-C₂)alkyl, the heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably halogen(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, halogen(C₁-C₄)alkoxy, pref-

- erably halogen(C₁-C₂)alkoxy, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, cyano, nitro, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, S(O)_n-(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-(C₁-C₂)alkyl, and S(O)_n-halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-halogen(C₁-C₂)alkyl;
- 5 R^{12} represents hydrogen or C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl, preferably C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, cyano, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, and di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, or represents C₅-C₈ aryl(C₁-C₄)alkyl, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, C₅-C₈ aryl, or heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably halogen(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, halogen(C₁-C₄)alkoxy, preferably halogen(C₁-C₂)alkoxy, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, cyano, nitro, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, S(O)_n-(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-(C₁-C₂)alkyl, and S(O)_n-halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-halogen(C₁-C₂)alkyl; and
- 15 n is 0, 1 or 2

Further preferred are compounds of formula (Ib) in which R¹ to R⁹ are as defined above for the preferred embodiment of formula (I) and the special group thereof.

As used herein,

- “alkyl” is defined as a straight or branched C₁₋₁₂ alkyl such as, for example, methyl, ethyl, n- or isopropyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, n-pentyl, n-hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-decyl, n-undecyl, n-dodecyl and the like, preferably, a C₁₋₆ alkyl, more preferably, a C₁₋₄ alkyl.
- 30

“alkenyl” is defined as a straight or branched C₂₋₁₂ alkenyl comprising at least one double bond

such as, for example, vinyl, allyl, 1-propenyl, isopropenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1,3-butanedieryl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1,3 pentanedieryl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1,4-hexanedieryl, and the like, preferably, a C₂₋₆ alkenyl, more preferably a C₂₋₄ alkenyl.

- 5 “alkynyl” is defined as a C₂₋₁₂ alkynyl comprising at least one triple bond and optionally further comprising one or more double bonds such as, for example, ethynyl, 1-propynyl, propargyl and the like, preferably, a C₂₋₆ alkynyl, more preferably a C₂₋₄ alkynyl.

- As each alkyl portion in “alkoxy”, “haloalkyl”, “alkoxyalkyl”, “alkylaminocarbonyl”, “dialkylaminoalkyl”, “haloalkoxy”, “alkoxycarbonyl”, “alkoxycarbonyl” and “alkoxycarbonylalkyl”, and the
10 like, the same portions as described in the above-mentioned “alkyl” are exemplified.

“cycloalkyl” is defined as a C₃₋₈ cycloalkyl such as, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl and the like, preferably, a C₃₋₆ cycloalkyl.

- “heterocycloalkyl” (= “heterocyclyl”) is defined as a cycloalkyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, such as tetrahydrofurane,
15 thiolane, pyrrolidine, oxathiolane, oxazolidine, tetrahydropurane, piperidine, oxetane, tetrahydrothiophendioxide, dioxane, and the like, preferred is tetrahydrofurane.

“aryl” is defined as an unsaturated C₅-C₁₂ cycloalkyl, such as phenyl, α- or β-naphthyl, preferably, phenyl.

- “heteroaryl” is defined as an aryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more
20 heteroatoms selected from O, N, P, and S, such as furane, thiophene, pyrrole, oxazole, thiazole, pyrazole, pyridine, pyrimidine, pyrazole and the like, preferred are pyrimidine and pyrazole.

“aralkyl” is defined as, for example, benzyl, phenethyl or α-methylbenzyl, preferably, benzyl.

“halogen” is defined as fluorine, chlorine, bromine or iodine, preferably, fluorine, or chlorine.

- As each halogen portion in “haloalkyl”, “haloalkoxy”, “haloalkylthio”, “halogenalkylsulfonyl”,
25 “halogenalkylsulfonyloxy”, “haloalkenyl”, “haloalkynyl”, and the like, the same portions as described above are exemplified.

According to a particularly preferred embodiment,

R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ of the formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, haloalkyl, alkoxyalkyl, cycloalkyl, haloalkoxy, alkylthio, haloalkylthio, alkyl-

sulfonyl, alkylsulfonyloxy, halogenalkylsulfonyl, alkoxycarbonyl, acetyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, dialkylamino, cycloalkylamino, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, cyano, or nitro;

R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylmercaptoalkyl, alkenyl, or alkynyl, or independently from each other represent aryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, alkoxy, nitro and cyano;

R^8 represents $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z represents O or S;

R^9 represents hydrogen, or alkyl;

R^{11} represents C_1 - C_2 alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl and cyano, or represents C_3 - C_8 alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkenyl, or alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, heterocyclyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, $S(O)_n$ -alkyl, and $S(O)_n$ -halogenalkyl;

R^{12} represents hydrogen or alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, cyano, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclylalkyl, aryl, or heteroaryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, $S(O)_n$ -alkyl, and $S(O)_n$ -halogenalkyl;

n is 0, 1 or 2

According to a special group of compounds of the particularly preferred embodiment defined above,

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , and R^5 of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, preferably chlorine or fluorine, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl, preferably C_1 - C_2 haloalkyl, $(C_1$ - C_4)alkoxy(C_1 - C_4)alkyl, preferably $(C_1$ - C_2)alkoxy(C_1 - C_2)alkyl, C_3 - C_8 cycloalkyl, preferably C_3 - C_6 cycloalkyl, halo(C_1 - C_4)alkoxy, preferably halo(C_1 - C_2)alkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, preferably C_1 - C_2 alkylthio, halo(C_1 - C_4)alkylthio, preferably halo(C_1 - C_2)alkylthio, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyloxy, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyloxy, halogen(C_1 - C_4)alkylsulfonyl, preferably halogen(C_1 - C_2)alkylsulfonyl, C_1 - C_4 alkoxycarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkoxycarbonyl, acetyl, C_1 - C_4 alkylcarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkylcarbonyl, C_2 - C_4 alkenylcarbonyl, di(C_1 - C_4)alkylamino, preferably di(C_1 - C_2)alkylamino, C_3 - C_8 cycloalkylamino, preferably C_3 - C_6 cycloalkylamino, C_2 - C_4 alkenyl, halo(C_2 - C_4)alkenyl, C_2 - C_4 alkynyl, halo(C_2 - C_4)alkynyl, cyano, or nitro;

R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, preferably C_1 - C_2 haloalkyl, C_3 - C_8 cycloalkyl, preferably C_3 - C_6 cycloalkyl, $(C_1$ - C_4)alkoxy(C_1 - C_4)alkyl, preferably $(C_1$ - C_2)alkoxy(C_1 - C_2)alkyl, C_1 - C_4 alkylmercapto(C_1 - C_4)alkyl, preferably C_1 - C_2 alkylmercapto(C_1 - C_2)alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, or C_2 - C_4 alkynyl, or represent independently from each other C_5 - C_8 aryl, preferably C_5 - C_6 aryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, preferably chlorine or fluorine, C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, nitro and cyano;

R^8 represents $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z represents O or S;

R^9 represents hydrogen, or C_1 - C_4 alkyl, preferably C_1 - C_2 alkyl;

R^{11} represents C_1 - C_2 alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, C_1 - C_4 alkylmercapto, preferably C_1 - C_2 alkylmercapto, C_1 - C_4 alkoxycarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkoxycarbonyl, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyl, and cyano, or represents C_3 - C_8 alkyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, $(C_3$ - C_6)cycloalkyl(C_1 - C_4)alkyl, C_2 - C_4 alkenyl, or C_2 - C_4 alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, halo(C_1 - C_4)alkyl, preferably halo(C_1 - C_2)alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, preferably C_1 - C_2 alkoxy, C_1 - C_4 alkylmercapto, preferably C_1 - C_2 alkylmercapto, C_1 - C_4 alkylsulfinyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfinyl, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, preferably C_1 - C_2 alkylsulfonyl, di(C_1 - C_4)alkylamino, preferably di(C_1 - C_2)alkylamino, C_1 - C_4 alkoxycarbonyl, preferably C_1 - C_2 alkoxycarbonyl,

and di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, or represents C₅-C₈ aryl(C₁-C₄)alkyl, preferably C₅-C₆ aryl(C₁-C₂)alkyl, heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P and S, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, C₅-C₈ aryl, heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, or heteroaryl(C₁-C₄)alkyl, preferably heteroaryl(C₁-C₂)alkyl, the heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, halogen(C₁-C₄) alkyl, preferably halogen(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, halogen(C₁-C₄)alkoxy, preferably halogen(C₁-C₂)alkoxy, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, cyano, nitro, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, S(O)_n-(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-(C₁-C₂)alkyl, and S(O)_n-halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-halogen(C₁-C₂)alkyl;

R¹² represents hydrogen or C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl, preferably C₃-C₆ cycloalkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, cyano, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, and di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, or represents C₅-C₈ aryl(C₁-C₄)alkyl, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, C₅-C₈ aryl, heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably halogen(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, halogen(C₁-C₄)alkoxy, preferably halogen(C₁-C₂)alkoxy, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, di(C₁-C₄)alkylaminocarbonyl, preferably di(C₁-C₂)alkylaminocarbonyl, cyano, nitro, di(C₁-C₄)alkylamino, preferably di(C₁-C₂)alkylamino, S(O)_n-(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-(C₁-C₂)alkyl, and S(O)_n-halogen(C₁-C₄)alkyl, preferably S(O)_n-halogen(C₁-C₂)alkyl; and

n is 0, 1 or 2

Further preferred are compounds of formula (Ib) in which R¹ to R⁹ are as defined above for the particularly preferred embodiment of formula (I) and the special group thereof.

According to a very particularly preferred embodiment of the invention,

5 R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, haloalkyl; or haloalkoxy;

R⁶ and R⁷ independently from each other represent hydrogen, alkyl, or haloalkyl;

R⁸ represents -C(S)NR¹¹R¹²;

R⁹ represents hydrogen;

10 R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, or cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, or alkenyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and alkoxycarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclalkyl, aryl,
15 heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, and heterocyclyl;

R¹² represents hydrogen;

20 According to a special group of compounds of the very particularly preferred embodiment defined above,

R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, preferably chlorine or fluorine, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, preferably C₁-C₂ haloalkyl; C₁-C₄ haloalkoxy, preferably C₁-C₂ haloalkoxy;

25 R⁶ and R⁷ independently from each other represent hydrogen, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, preferably C₁-C₂ haloalkyl;

R⁸ represents -C(S)NR¹¹R¹²;

R⁹ represents hydrogen;

- R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, and cyano,
 5 or represents C₃-C₈ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, (C₃-C₆)cycloalkyl(C₁-C₄)alkyl, C₂-C₄ alkenyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, halo(C₁-C₄)alkyl, preferably halo(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, or represents,
 10 heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, or C₅-C₈ aryl; heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P and S, or heteroaryl (C₁-C₄) alkyl, preferably heteroaryl (C₁-C₂) alkyl,
 15 the heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P and S, and

R¹² represents hydrogen.

Further preferred are compounds of formula (Ib) in which R¹ to R⁹ are as defined above for the
 20 very particularly preferred embodiment of formula (I) and the special group thereof.

According to the most preferred embodiment of the invention,

R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, haloalkyl, or haloalkoxy;

R⁶ represents alkyl;

25 R⁷ represents hydrogen;

R⁸ represents -C(S)NR¹¹R¹²;

R⁹ represents hydrogen;

R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, or cyano, or represents
 30 C₃-C₈ alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, or alkenyl, optionally substituted with one or more

substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and alkoxycarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, and heterocyclyl; and

R¹² represents hydrogen.

According to a special group of compounds of the most preferred embodiment defined above,

R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ of formula (I) independently from each other represent hydrogen, halogen, preferably chlorine or fluorine, C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ haloalkyl, preferably C₁-C₂ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy, preferably C₁-C₂ haloalkoxy;

R⁶ represents C₁-C₄ alkyl, preferably C₁-C₂ alkyl,

R⁷ represents hydrogen;

R⁸ represents -C(S)NR¹¹R¹²;

R⁹ represents hydrogen;

R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, and cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, (C₃-C₆)cycloalkyl(C₁-C₄)alkyl, C₂-C₄ alkenyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, halo(C₁-C₄)alkyl, preferably halo(C₁-C₂)alkyl, C₁-C₄ alkoxy, preferably C₁-C₂ alkoxy, C₁-C₄ alkylmercapto, preferably C₁-C₂ alkylmercapto, C₁-C₄ alkylsulfinyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, preferably C₁-C₂ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkoxycarbonyl, preferably C₁-C₂ alkoxycarbonyl, or represents heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, heterocyclyl(C₁-C₄)alkyl, preferably heterocyclyl(C₁-C₂)alkyl, the heterocyclyl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P, and S, or C₅-C₈ aryl, heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms selected from O, N, P and S, or heteroaryl (C₁-C₄) alkyl, preferably heteroaryl (C₁-C₂) alkyl, the heteroaryl comprising a 5-8 membered ring containing one, two or more heteroatoms

selected from O, N, P and S, and

R¹² represents hydrogen.

Further preferred are compounds of formula (Ib) in which R¹ to R⁹ are as defined above for the most preferred embodiment of formula (I) and the special group thereof. All compounds of formula
5 (Ib) in which R¹ to R⁹ are as defined above for the most preferred embodiment of formula (I) and the special group thereof are present in the S-configuration.

The general or preferred radical definitions or explanations given above apply both to the end products and, correspondingly, to precursors and intermediates. These radical definitions can be combined with one another as desired, i.e. including combinations between the respective preferred ranges.
10

Preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) or (Ib) which contain a combination of the meanings listed above as being preferred.

Particular preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) or (Ib) which contain a combination of the meanings listed above as being particularly preferred.

15 Very particular preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) or (Ib) which contain a combination of the meanings listed above as being very particularly preferred.

Most preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) or (Ib) which contain a combination of the meanings listed above as being most preferred.

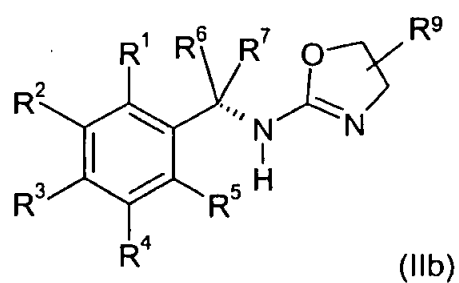
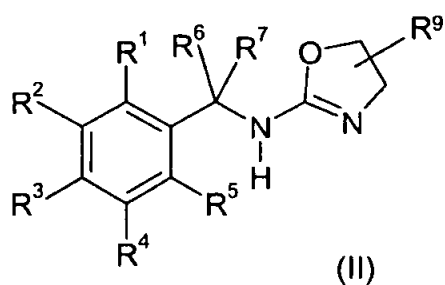
The present invention further relates to a composition comprising at least one compound of the
20 formula (I) or (Ib) as defined in any embodiment above and customary extenders and/or surfactants. Customary extenders and surfactants are defined below.

The present invention also relates to a method for controlling pests, wherein a compound of the formula (I) or (Ib) as defined in any embodiment above or a composition comprising at least one compound of the formula (I) or (Ib) as defined in any embodiment above and customary extenders
25 and/or surfactants is allowed to act on the pests and/or their habitat.

Further, the present invention relates to the use of the compounds of the formula (I) or (Ib) as defined in any embodiment above or of compositions comprising at least one compound of the formula (I) or (Ib) as defined in any embodiment above and customary extenders and/or surfactants for controlling pests.

The novel substituted compounds of the formula (I) or (Ib) in which R^8 is $-C(S)NR^{11}R^{12}$, and R^{12} is hydrogen are obtained when

a compound of the formula (II) or (IIb)



5 in which

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ and R^9 are as defined above

is reacted with a compound of formula (III)



in which

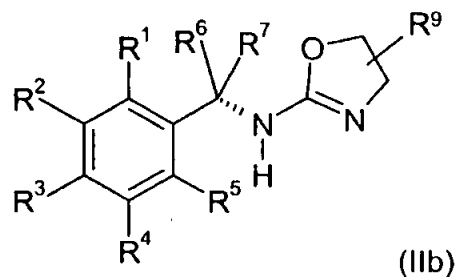
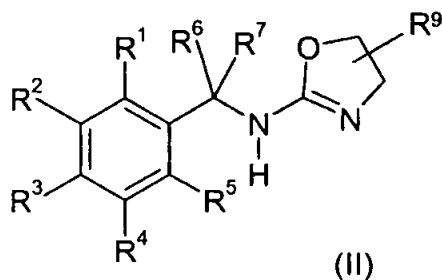
10 R^{11} is as defined above,

and N,N-di-isopropylethylamine in an aprotic solvent such as dichloromethane, chloroform, acetonitrile, dimethylformamide, tetrahydrofuran, or ethyl acetate at temperatures from -20 to 120°C , preferably 20 - 60°C , depending on the solvent. Reaction times are 0.5 to 20 h, ratios of the educts are compound of formula II : compound of formula III of $1 : 1$ to $1 : 1.5$, preferably $1 : 1$ (process

15 1).

Furthermore, it has been found that the novel substituted compounds of the formula (I) or (Ib) in which R^8 is $-C(S)NR^{11}R^{12}$, and R^{12} is hydrogen can also be obtained when

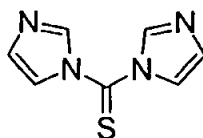
a compound of the formula (II) or (IIb)



in which

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ and R^9 are as defined above

5 is reacted with thiocarbonyldiimidazole



and a compound of the formula (IV)

$R^{II}-NH_2$ (IV)

in which

10 R^{II} is as defined above,

in an aprotic solvent such as dichloromethane, chloroform, acetonitrile, dimethylformamide, tetrahydrofuran, or ethyl acetate at temperatures from -20 to 120°C, preferably 0-40°C, depending on the solvent. Reaction times are 1 to 20 h, ratios of the educts are compound of formula II : thiocarbonyldiimidazole : compound of formula III of 1 : 1 : 1 to 1:2:2, preferably 1 : 1.1 : 1.1 (process 2).

15 This method is preferred if an isothiocyanate of an amine is not commercially available (e.g. aminoacetonitrile) and allows the use of the corresponding amine itself to shorten the synthesis pathway.

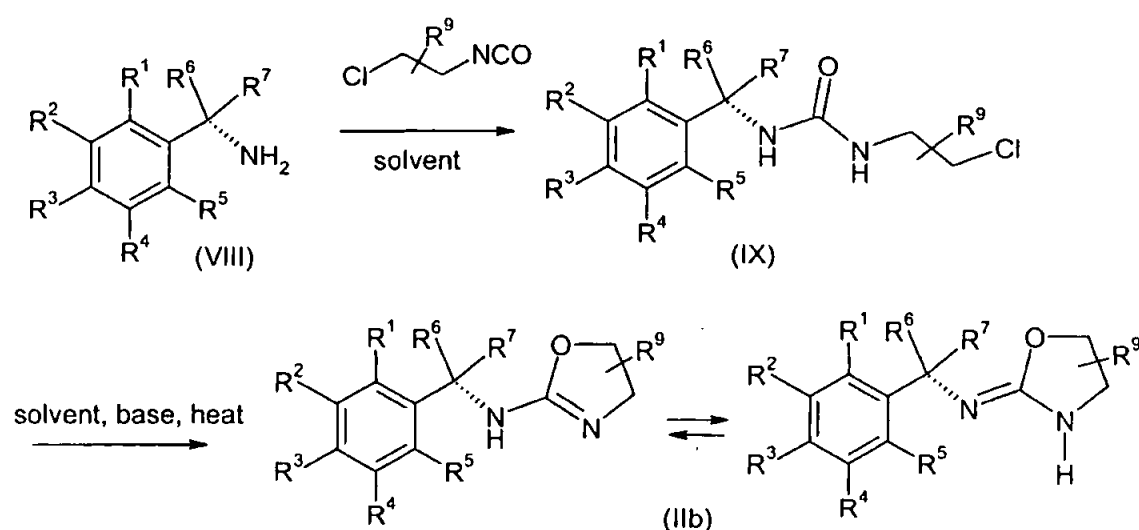
In general, the synthesis of thioureas by reaction of amines with thiocarbonyldiimidazole is known in the art (cf. e.g. WO 2005/007601, pages 50-52). However, the synthesis of 2-(imino)-1,3-oxazolidine-3-carbothioamides by reaction of an oxazolidine with thiocarbonyldiimidazole and a
20 primary or secondary amine has not been described before. Surprisingly, it was found that this

reaction of an oxazolidine with thiocarbonyldiimidazole and a primary or secondary amine is feasible. In view of the low basicity of the oxazolidines, this was unexpected for a person skilled in the art.

The amines (IV), thiocarbonyldiimidazole and isothiocyanates (III) are generally known and commercially available.

The compounds of general formulas (II) and (IIb) can be obtained analogous by methods known from literature (for example WO2006/127426).

Scheme 1



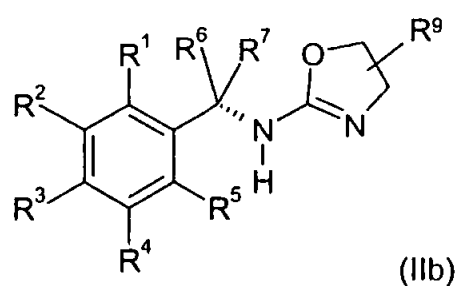
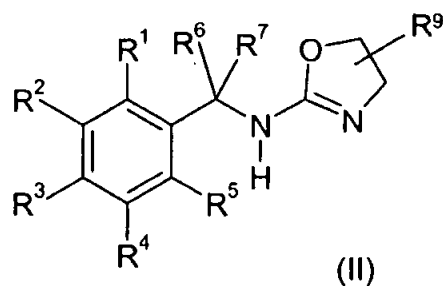
- As depicted in scheme 1, the reaction of an appropriately substituted benzylamine and an appropriately substituted 2-chloroethyl isocyanate (e.g. in 1,4-dioxane or dichloromethane) yielded the appropriately substituted 1-benzyl-3-(2-chloroethyl)urea, which after heating with a base (e.g. NaOH, H₂O, 1,4-dioxane or diaza(1,3)bicyclo[5.4.0]undecane (DBU), acetonitrile) yielded the appropriately substituted benzyl 1,3-oxazinyl amine (IIb), or (II) if (VIII) is a racemic mixture of appropriately substituted benzylamines. These methods are generally known to those skilled in the art (WO 2006/127426, pages 22, 26; WO2005/063724 page 56, and literature cited therein)

The novel substituted compounds of the formula (I) or (Ib) in which

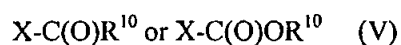
R⁸ is -C(O)R¹⁰ or -C(O)OR¹⁰ and

R¹² is hydrogen are obtained when

a compound of formula (II) or (IIb)

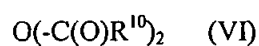


and a compound of formula (V)



5 in which R^{10} and R^{11} are as defined above and X is a leaving group as halogen

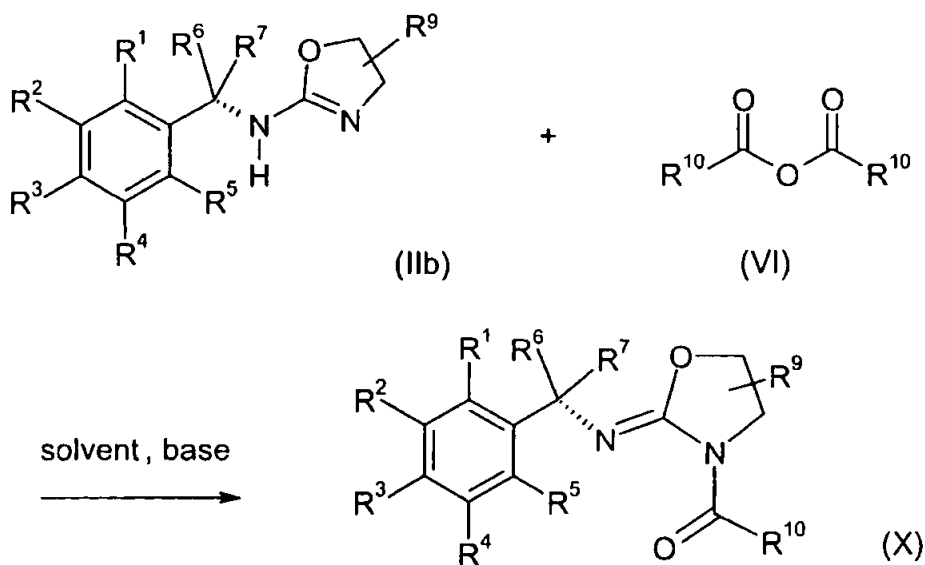
or a compound of formula (VI)



are reacted under basic conditions in an aprotic solvent.

10 These reactions are generally known to a person skilled in the art. (See WO 2006/127426, page 23 and 32). The compounds of formula (VI) are generally known and commercially available.

Scheme 2



Within this type of reaction depicted in scheme 2, organic as well as inorganic bases are useful (e.g. Diisopropylethylamin, Potassiumcarbonate), preferred are aprotic solvents. The reaction temperatures are between -20 to 40°C, preferred -5°C to 20°C.

Finally, it has been found that the novel compounds of the formula (I) and (Ib) have pronounced biological properties and are suitable especially for controlling animal pests, in particular insects, arachnids and nematodes encountered in agriculture, in forests, in the protection of stored products and in the protection of materials, and also in the hygiene sector.

If appropriate, the compounds of the formula (I) and (Ib) can be present in different polymorphic forms or as a mixture of different polymorphic forms. Both the pure polymorphs and the polymorph mixtures are provided by the invention and can be used according to the invention.

The active compounds according to the invention, in combination with good plant tolerance and favourable toxicity to warm-blooded animals and being tolerated well by the environment, are suitable for protecting plants and plant organs, for increasing the harvest yields, for improving the quality of the harvested material and for controlling animal pests, in particular insects, arachnids, helminths, nematodes and molluscs, which are encountered in agriculture, in horticulture, in animal husbandry, in forests, in gardens and leisure facilities, in the protection of stored products and of materials, and in the hygiene sector. They may be preferably employed as plant protection agents. They are active against normally sensitive and resistant species and against all or some stages of development. The abovementioned pests include:

From the order of the Anoplura (Phthiraptera), for example, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

From the class of the Arachnida, for example, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Choriop-tes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptiruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

From the class of the Bivalva, for example, *Dreissena* spp.

From the order of the Chilopoda, for example, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

- From the order of the Coleoptera, for example, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp.,
- 5 *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*,
- 10 *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.
- 15 From the order of the Collembola, for example, *Onychiurus armatus*.
- From the order of the Dermaptera, for example, *Forficula auricularia*.
- From the order of the Diplopoda, for example, *Blaniulus guttulatus*.
- From the order of the Diptera, for example, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp.,
- 20 *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.
- From the class of the Gastropoda, for example, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Dero-*
- 25 *ceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.
- From the class of the helminths, for example, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granu-*
- 30 *losus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schisto-*

somen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

It is furthermore possible to control protozoa, such as Eimeria.

- 5 From the order of the Heteroptera, for example, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Helio-
- peltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp.,
- 10 Psallus seriatus, Pseudacysta persea, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.

- From the order of the Homoptera, for example, Acyrthosipon spp., Aeneolamia spp., Agonosцена spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus
- 15 spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis
 - 20 spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dymicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis,
 - 25 Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gi-
 - 30 gas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictoccephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

From the order of the Hymenoptera, for example, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

From the order of the Isopoda, for example, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

- 5 From the order of the Isoptera, for example, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

- From the order of the Lepidoptera, for example, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia*
 10 *kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp.,
 15 *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.

- From the order of the Orthoptera, for example, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*,
 20 *Schistocerca gregaria*.

From the order of the Siphonaptera, for example, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

From the order of the Symphyla, for example, *Scutigereilla immaculata*.

- From the order of the Thysanoptera, for example, *Baliothrips bifornis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips*
 25 *cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

From the order of the Thysanura, for example, *Lepisma saccharina*.

- The phytoparasitic nematodes include, for example, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*,
 30 *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus*

semipenetrans, *Xiphinema* spp.

If appropriate, the active compounds according to the invention can, at certain concentrations or application rates, also be used as herbicides, safeners, growth regulators or agents to improve plant properties, or as microbicides, for example as fungicides, antimycotics, bactericides, viricides (including agents against viroids) or as agents against MLO (*Mycoplasma*-like organisms) and RLO (*Rickettsia*-like organisms). If appropriate, they can also be employed as intermediates or precursors for the synthesis of other active compounds.

The active compounds can be converted to the customary formulations, such as solutions, emulsions, wettable powders, water- and oil-based suspensions, powders, dusts, pastes, soluble powders, soluble granules, granules for broadcasting, suspension-emulsion concentrates, natural materials impregnated with active compound, synthetic materials impregnated with active compound, fertilizers and micro-encapsulations in polymeric substances.

These formulations are produced in a known manner, for example by mixing the active compounds with extenders, that is liquid solvents and/or solid carriers, optionally with the use of surfactants, that is emulsifiers and/or dispersants and/or foam-formers. The formulations are prepared either in suitable plants or else before or during the application.

Suitable for use as auxiliaries are substances which are suitable for imparting to the active compounds itself and/or to preparations derived therefrom (for example spray liquors, seed dressings) particular properties such as certain technical properties and/or also particular biological properties. Typical suitable auxiliaries are: extenders, solvents and carriers.

Suitable extenders are, for example, water, polar and non-polar organic chemical liquids, for example from the classes of the aromatic and non-aromatic hydrocarbons (such as paraffins, alkylbenzenes, alkylnaphthalenes, chlorobenzenes), the alcohols and polyols (which, if appropriate, may also be substituted, etherified and/or esterified), the ketones (such as acetone, cyclohexanone), esters (including fats and oils) and (poly)ethers, the unsubstituted and substituted amines, amides, lactams (such as *N*-alkylpyrrolidones) and lactones, the sulphones and sulfoxides (such as dimethyl sulphoxide).

If the extender used is water, it is also possible to employ, for example, organic solvents as auxiliary solvents. Essentially, suitable liquid solvents are: aromatics such as xylene, toluene or alkylnaphthalenes, chlorinated aromatics and chlorinated aliphatic hydrocarbons such as chlorobenzenes, chloroethylenes or methylene chloride, aliphatic hydrocarbons such as cyclohexane or paraffins, for example petroleum fractions, mineral and vegetable oils, alcohols such as butanol or glycol and also their

ethers and esters, ketones such as acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone or cyclohexanone, strongly polar solvents such as dimethyl sulphoxide, and also water.

Suitable solid carriers are:

for example, ammonium salts and ground natural minerals such as kaolins, clays, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite or diatomaceous earth, and ground synthetic minerals, such as finely divided silica, alumina and silicates; suitable solid carriers for granules are: for example, crushed and fractionated natural rocks such as calcite, marble, pumice, sepiolite and dolomite, and also synthetic granules of inorganic and organic meals, and granules of organic material such as paper, sawdust, coconut shells, maize cobs and tobacco stalks; suitable emulsifiers and/or foam-formers are: for example, nonionic and anionic emulsifiers, such as polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty alcohol ethers, for example alkylaryl polyglycol ethers, alkylsulphonates, alkyl sulphates, arylsulphonates and also protein hydrolysates; suitable dispersants are nonionic and/or ionic substances, for example from the classes of the alcohol-POE and/or -POP ethers, acid and/or POP-POE esters, alkyl aryl and/or POP-POE ethers, fat and/or POP-POE adducts, POE- and/or POP-polyol derivatives, POE- and/or POP-sorbitan- or -sugar adducts, alkyl or aryl sulphates, alkyl- or arylsulphonates and alkyl or aryl phosphates or the corresponding PO-ether adducts. Furthermore, suitable oligo- or polymers, for example those derived from vinylic monomers, from acrylic acid, from EO and/or PO alone or in combination with, for example, (poly)alcohols or (poly)amines. It is also possible to employ lignin and its sulphonic acid derivatives, unmodified and modified celluloses, aromatic and/or aliphatic sulphonic acids and their adducts with formaldehyde.

Tackifiers such as carboxymethylcellulose and natural and synthetic polymers in the form of powders, granules or latices, such as gum arabic, polyvinyl alcohol and polyvinyl acetate, as well as natural phospholipids such as cephalins and lecithins, and synthetic phospholipids, can be used in the formulations.

It is possible to use colorants such as inorganic pigments, for example iron oxide, titanium oxide and Prussian Blue, and organic dyestuffs, such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs and metal phthalocyanine dyestuffs, and trace nutrients such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

Other possible additives are perfumes, mineral or vegetable, optionally modified oils, waxes and nutrients (including trace nutrients), such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

Stabilizers, such as low-temperature stabilizers, preservatives, antioxidants, light stabilizers or

other agents which improve chemical and/or physical stability may also be present.

The formulations generally comprise between 0.01 and 98% by weight of active compound, preferably between 0.5 and 90%.

The active compound according to the invention can be used in its commercially available formula-
 5 tions and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with other active compounds, such as insecticides, attractants, sterilizing agents, bactericides, acaricides, nematocides, fungicides, growth-regulating substances, herbicides, safeners, fertilizers or semiochemicals.

Particularly favourable mixing components are, for example, the following compounds:

Fungicides:

10 Inhibitors of nucleic acid synthesis

benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, chiralaxyl, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalaxyl, metalaxyl-M, ofurace, oxadixyl, oxolinic acid

Inhibitors of mitosis and cell division

benomyl, carbendazim, diethofencarb, fuberidazole, pencycuron, thiabendazole, thiophanat-methyl,
 15 zoxamide

Inhibitors of respiratory chain complex I

diflumetorim

Inhibitors of respiratory chain complex II

boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad, thif-
 20 luzamide

Inhibitors of respiratory chain complex III

azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestrobin, famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin

Decouplers

25 dinocap, fluazinam

Inhibitors of ATP production

fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, silthiofam

Inhibitors of amino acid biosynthesis and protein biosynthesis

andoprim, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepaniprim,
5 pyrimethanil

Inhibitors of signal transduction

fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen

Inhibitors of lipid and membrane synthesis

chlozolate, iprodione, procymidone, vinclozolin

10 ampropylfos, potassium-ampropylfos, edifenphos, iprobenfos (IBP), isoprothiolane, pyrazophos

tolclofos-methyl, biphenyl

iodocarb, propamocarb, propamocarb hydrochloride

Inhibitors of ergosterol biosynthesis

fenhexamid,

15 azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, diclobutrazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, furconazole, furconazole-cis, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, paclobutrazole, penconazole, propiconazole, prothioconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole, uniconazole, voriconazole, imazalil, imazalil sulphate, oxpoconazole, fenarimol, flurprimidole, nuarimol, pyrifenoxy, triforine, pefurazoate,
20 prochloraz, triflumizole, viniconazole,

aldimorph, dodemorph, dodemorph acetate, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamine,

naftifine, pyributicarb, terbinafine

Inhibitors of cell wall synthesis

benthiavalicarb, bialaphos, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, polyoxins, polyoxorim, validamycin A

Inhibitors of melanin biosynthesis

capropamid, diclocymet, fenoxanil, phthalid, pyroquilon, tricyclazole

5 Resistance inductors

acibenzolar-S-methyl, probenazole, tiadinil

Multisite

10 captafol, captan, chlorothalonil, copper salts such as: copper hydroxide, copper naphthenate, copper oxychloride, copper sulphate, copper oxide, oxine-copper and Bordeaux mixture, dichlofluanid, dithianon, dodine, dodine free base, ferbam, folpet, fluorofolpet, guazatine, guazatine acetate, iminocadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, propineb, sulphur and sulphur preparations containing calcium polysulphide, thiram, tolylfluanid, zineb, ziram

Unknown mechanism

15 amibromdol, benthiazol, bethoxazin, capsimycin, carvone, chinomethionat, chloropicrin, cufraneb, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, dichlorophen, dicloran, difenzoquat, difenzoquat methyl sulphate, diphenylamine, ethaboxam, ferimzone, flumetover, flusulphamide, flupicolide, fluoroimide, hexachlorobenzene, 8-hydroxyquinoline sulphate, irumamycin, methasulphocarb, metrafenone, methyl isothiocyanate, mildiomyacin, natamycin, nickel dimethyl dithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, othilinone, oxamocarb, oxyfenthin, pentachlorophenol and salts, 2-phenylphenol and salts, piperalin, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrol nitrin, quintozone, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlamide, zarilamid and 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulphonyl)pyridine, *N*-(4-chloro-2-nitrophenyl)-*N*-ethyl-4-methylbenzenesulphonamide, 2-amino-4-methyl-*N*-phenyl-5-thiazolecarboxamide, 2-chloro-*N*-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinecarboxamide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)cycloheptanol, 2,4-dihydro-5-methoxy-2-methyl-4-[[[1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethylidene]amino]oxy]methyl]phenyl]-3H-1,2,3-triazol-3-one (185336-79-2), methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile, methyl 2-[[[cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl]thio]methyl]-alpha-(methoxymethylene)benzacetate, 4-chloro-alpha-propynyloxy-*N*-[2-[3-methoxy-4-(2-propynyloxy)phenyl]ethyl]benzacetamide, (2S)-*N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-

20

25

30

- methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulphonyl)amino]butanamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-*N*-[(1*R*)-1,2,2-trimethylpropyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-chloro-*N*-[(1*R*)-1,2-dimethylpropyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, *N*-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, *N*-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl-2,4-dichloronicotinamide, 2-butoxy-6-iodo-3-propylbenzopyranon-4-one, *N*-{(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl}-2-benzacetamide, *N*-(3-ethyl-3,5,5-trimethylcyclohexyl)-3-formylamino-2-hydroxybenzamide, 2-[[[1-[3(1-fluoro-2-phenylethyl)oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy]methyl]-alpha-(methoxyimino)-*N*-methyl-alphaE-benzacetamide, *N*-{2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]ethyl}-2-(trifluoromethyl)benzamide, *N*-(3',4'-dichloro-5-fluorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide, *N*-(6-methoxy-3-pyridinyl)cyclopropanecarboxamide, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl-1*H*-imidazole-1-carboxylic acid, O-[1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl]-1*H*-imidazole-1-carbothioic acid, 2-(2-[[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(methoxyimino)-*N*-methylacetamide

Bactericides:

bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, oethilinone, furancarboxylic acid, oxytetracycline, probenazole, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and other copper preparations.

20 Insecticides/acaricides/nematicides:

Acetylcholine esterase (AChE) inhibitors

carbamates,

- for example alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allyxycarb, aminocarb, bendiocarb, benfurcarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulphan, cloethocarb, dimetilan, ethiofencarb, fenobucarb, fenothiocarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, 25 metam-sodium, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, promecarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylylcarb, triazamate

organophosphates,

- for example acephate, azamethiphos, azinphos (-methyl, -ethyl), bromophos-ethyl, bromfenvinphos (-methyl), butathiofos, cadusafos, carbophenothion, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlor- 30 mephos, chlorpyrifos (-methyl/-ethyl), coumaphos, cyanofenphos, cyanophos, chlorfenvinphos,

demeton-S-methyl, demeton-S-methylsulphone, dialifos, diazinon, dichlofenthion, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, dioxabenzofos, disulphoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fensulphothion, fenthion, flupyrazofos, fonofos, formothion, fosmethilan, fosthiazate, heptenophos, iodofenphos, iprobenfos, isazofos, 5 isofenphos, isopropyl O-salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methacrifos, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, parathion (-methyl/-ethyl), phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phosphocarb, phoxim, pirimiphos (-methyl/-ethyl), profenofos, propaphos, propetamphos, prothiofos, prothoate, pyraclofos, pyridaphenthion, pyridathion, quinalphos, sebufos, sulphotep, sulprofos, tebupirimfos, temephos, 10 terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon, vamidothion

Sodium channel modulators / voltage-dependent sodium channel blockers

pyrethroids,

for example acrinathrin, allethrin (d-cis-trans, d-trans), beta-cyfluthrin, bifenthrin, bioallethrin, 15 bioallethrin-S-cyclopentyl isomer, bioethanomethrin, biopermethrin, bioresmethrin, chlovaporthrin, cis-cypermethrin, cis-resmethrin, cis-permethrin, clocythrin, cycloprothrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), cyphenothrin, deltamethrin, empen-
thrin (1R isomer), esfenvalerate, etofenprox, fenfluthrin, fenpropathrin, fenpyrithrin, fenvalerate, flubrocycrin, flucythrinate, flufenprox, flumethrin, fluvalinate, fubfenprox, gamma- 20 cyhalothrin, imiprothrin, kadethrin, lambda-cyhalothrin, metofluthrin, permethrin (cis-, trans-), phenothrin (1R-trans-isomer), prallethrin, profluthrin, protrifenbute, pyresmethrin, resmethrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, terallethrin, tetramethrin (1R isomer), tralomethrin, transfluthrin, ZXI 8901, pyrethrins (pyrethrum)

DDT

25 oxadiazines,

for example indoxacarb

semicarbazones,

for example metaflumizone (BAS3201)

Acetylcholine receptor agonists/antagonists

30 chloronicotinyls,

for example acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiacloprid, imidaclothiz, AKD-1022, thiamethoxam

nicotine, bensultap, cartap

Acetylcholine receptor modulators

5 spinosyns,

for example spinosad, spinetoram (XDE-175)

GABA-controlled chloride channel antagonists

organochlorines,

10 for example camphechlor, chlordane, endosulphan, gamma-HCH, HCH, heptachlor, lindane, methoxychlor

fiprols,

for example acetoprole, ethiprole, fipronil, pyrafluprole, pyriprole, vanilprole

Chloride channel activators

mectins,

15 for example abamectin, emamectin, emamectin-benzoate, ivermectin, lepimectin, milbemycin

Juvenile hormone mimetics,

for example diofenolan, epofenonane, fenoxycarb, hydroprene, kinoprene, methoprene, pyriproxifen, triprene

Ecdysone agonists/disruptors

20 diacylhydrazines,

for example chromafenozide, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide

Chitin biosynthesis inhibitors

benzoylureas,

for example bistrifluron, chlofluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucycloxuron, flufenoxuron,

hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron

buprofezin

cyromazine

Oxidative phosphorylation inhibitors, ATP disruptors

5 diafenthiuron

organotin compounds,

for example azocyclotin, cyhexatin, fenbutatin-oxide

Oxidative phosphorylation decouplers acting by interrupting the H-proton gradient

pyrroles,

10 for example chlorfenapyr

dinitrophenols,

for example binapacyrl, dinobuton, dinocap, DNOC

Site-I electron transport inhibitors

METIs,

15 for example fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad

hydramethylnon

dicofol

Site-II electron transport inhibitors

rotenone

20 Site-III electron transport inhibitors

acequinocyl, fluacrypyrim

Microbial disruptors of the insect gut membrane

Bacillus thuringiensis strains

Lipid synthesis inhibitors

tetronic acids,

for example spiroadiclofen, spiromesifen

5 tetramic acids,

for example spirotetramat

carboxamides,

for example flonicamid

octopaminergic agonists,

10 for example amitraz

Inhibitors of magnesium-stimulated ATPase,

propargite

nereistoxin analogues,

for example thiocyclam hydrogen oxalate, thiosultap-sodium

15 Ryanodin receptor agonists

benzoic acid dicarboxamides,

for example flubendiamid

anthronilamides,

20 for example pynaxypyr (3-bromo-*N*-{4-chloro-2-methyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl}-1-(3-chloropyridin-2-yl)-1H-pyrazole-5-carboxamide)

Biologicals, hormones or pheromones

azadirachtin, Bacillus spec., Beauveria spec., codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., thuringiensin, Verticillium spec.

Active compounds with unknown or unspecific mechanisms of action

fumigants,

for example aluminium phosphide, methyl bromide, sulphuryl fluoride

antifeedants,

5 for example cryolite, flonicamid, pymetrozine

mite growth inhibitors,

for example clofentezine, etoxazole, hexythiazox

amidoflumet, benclotiaz, benzoximate, bifenazate, bromopropylate, buprofezin, chinomethionat, chlordimeform, chlorobenzilate, chloropicrin, clothiazoben, cycloprene, cyflumetofen,
 10 dicyclanil, fenoxacrim, fentrifanil, flubenzimine, flufenimer, flutenzin, gossyplure, hydramethylnone, japonilure, metoxadiazon, petroleum, piperonyl butoxide, potassium oleate, pyridalyl, sulphuramid, tetradifon, tetrasul, triarathene, verbutin

A mixture with other known active compounds, such as herbicides, fertilizers, growth regulators, safeners, semiochemicals, or else with agents for improving the plant properties, is also possible.

15 When used as insecticides, the active compounds according to the invention can furthermore be present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with synergists. Synergists are compounds which increase the action of the active compounds, without it being necessary for the synergistic agent added to be active itself.

When used as insecticides, the active compounds according to the invention can furthermore be
 20 present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with inhibitors which reduce degradation of the active compound after use in the environment of the plant, on the surface of parts of plants or in plant tissues.

The active compound content of the use forms prepared from the commercially available formulations can vary within wide limits. The active compound concentration of the use forms can be from
 25 0.00000001 to 95% by weight of active compound, preferably between 0.00001 and 1% by weight.

The active compounds are employed in a customary manner appropriate for the use forms.

All plants and plant parts can be treated in accordance with the invention. Plants are to be understood as meaning in the present context all plants and plant populations such as desired and unde-

- sired wild plants or crop plants (including naturally occurring crop plants). Crop plants can be plants which can be obtained by conventional plant breeding and optimization methods or by biotechnological and genetic engineering methods or by combinations of these methods, including the transgenic plants and including the plant cultivars protectable or not protectable by plant breeders' rights. Plant parts are to be understood as meaning all parts and organs of plants above and below the ground, such as shoot, leaf, flower and root, examples which may be mentioned being leaves, needles, stalks, stems, flowers, fruit bodies, fruits, seeds, roots, tubers and rhizomes. The plant parts also include harvested material, and vegetative and generative propagation material, for example cuttings, tubers, rhizomes, offshoots and seeds.
- 10 Treatment according to the invention of the plants and plant parts with the active compounds is carried out directly or by allowing the compounds to act on the surroundings, habitat or storage space by the customary treatment methods, for example by immersion, spraying, evaporation, fogging, scattering, painting on, injection and, in the case of propagation material, in particular in the case of seeds, also by applying one or more coats.
- 15 The active compounds according to the invention are particularly suitable for treating seed. Here, the active compounds according to the invention mentioned above as preferred or particularly preferred may be mentioned as being preferred. Thus, a large part of the damage to crop plants which is caused by pests occurs as early as when the seed is attacked during storage and after the seed is introduced into the soil, during and immediately after germination of the plants. This phase is particularly critical since the roots and shoots of the growing plant are particularly sensitive and even minor damage can lead to the death of the whole plant. Protecting the seed and the germinating plant by the use of suitable active compounds is therefore of particularly great interest.
- 20

- The control of pests by treating the seeds of plants has been known for a long time and is the subject of continuous improvements. However, the treatment of seed entails a series of problems which cannot always be solved in a satisfactory manner. Thus, it is desirable to develop methods for protecting the seed and the germinating plant which dispense with the additional application of crop protection agents after sowing or after the emergence of the plants. It is furthermore desirable to optimize the amount of active compound employed in such a way as to provide maximum protection for the seed and the germinating plant from attack by pests, but without damaging the plant itself by the active compound employed. In particular, methods for the treatment of seed should also take into consideration the intrinsic insecticidal properties of transgenic plants in order to achieve optimum protection of the seed and the germinating plant with a minimum of crop protection agents being employed.
- 25
- 30

The present invention therefore in particular also relates to a method for the protection of seed and germinating plants from attack by pests, by treating the seed with an active compound according to the invention. The invention likewise relates to the use of the active compounds according to the invention for the treatment of seed for protecting the seed and the resultant plant from pests. Furthermore, the invention relates to seed which has been treated with an active compound according to the invention so as to afford protection from pests.

One of the advantages of the present invention is that the particular systemic properties of the active compounds according to the invention mean that treatment of the seed with these active compounds not only protects the seed itself, but also the resulting plants after emergence, from pests. In this manner, the immediate treatment of the crop at the time of sowing or shortly thereafter can be dispensed with.

Furthermore, it must be considered as advantageous that the active compounds according to the invention can also be employed in particular in transgenic seed, the plants arising from this seed being capable of expressing a protein directed against pests. By treating such seed with the active compounds according to the invention, certain pests can be controlled merely by the expression of the, for example, insecticidal protein, and additionally be protected by the active compounds according to the invention against damage.

The active compounds according to the invention are suitable for protecting seed of any plant variety as already mentioned above which is employed in agriculture, in the greenhouse, in forests or in horticulture. In particular, this takes the form of seed of maize, peanut, canola, oilseed rape, poppy, soya beans, cotton, beet (for example sugar beet and fodder beet), rice, sorghum and millet, wheat, barley, oats, rye, sunflower, tobacco, potatoes or vegetables (for example tomatoes, cabbage plants). The active compounds according to the invention are likewise suitable for treating the seed of fruit plants and vegetables as already mentioned above. The treatment of the seed of maize, soya beans, cotton, wheat and canola or oilseed rape is of particular importance.

As already mentioned above, the treatment of transgenic seed with an active compound according to the invention is also of particular importance. This takes the form of seed of plants which, as a rule, comprise at least one heterologous gene which governs the expression of a polypeptide with in particular insecticidal properties. In this context, the heterologous genes in transgenic seed may be derived from microorganisms such as *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* or *Gliocladium*. The present invention is particularly suitable for the treatment of transgenic seed which comprises at least one heterologous gene originating from *Bacillus* sp. and whose gene product shows activity against the European corn borer and/or the corn

root worm. It is particularly preferably a heterologous gene derived from *Bacillus thuringiensis*.

In the context of the present invention, the active compound according to the invention is applied to the seed either alone or in a suitable formulation. Preferably, the seed is treated in a state which is stable enough to avoid damage during treatment. In general, the seed may be treated at any point
5 in time between harvest and sowing. The seed usually used has been separated from the plant and freed from cobs, shells, stalks, coats, hairs or the flesh of the fruits.

When treating the seed, care must generally be taken that the amount of the active compound according to the invention applied to the seed and/or the amount of further additives is chosen in such a way that the germination of the seed is not adversely affected, or that the resulting plant is
10 not damaged. This must be borne in mind in particular in the case of active compounds which may have phytotoxic effects at certain application rates.

As already mentioned above, it is possible to treat all plants and their parts according to the invention. In a preferred embodiment, wild plant species and plant cultivars, or those obtained by conventional biological breeding methods, such as crossing or protoplast fusion, and parts thereof, are
15 treated. In a further preferred embodiment, transgenic plants and plant cultivars obtained by genetic engineering methods, if appropriate in combination with conventional methods (Genetically Modified Organisms), and parts thereof are treated. The terms "parts", "parts of plants" and "plant parts" have been explained above.

Particularly preferably, plants of the plant cultivars which are in each case commercially available
20 or in use are treated according to the invention. Plant cultivars are to be understood as meaning plants having novel properties ("traits") which have been obtained by conventional breeding, by mutagenesis or by recombinant DNA techniques. These can be cultivars, bio- or genotypes.

Depending on the plant species or plant cultivars, their location and growth conditions (soils, climate, vegetation period, diet), the treatment according to the invention may also result in superadditive ("synergistic") effects. Thus, for example, reduced application rates and/or a widening of the
25 activity spectrum and/or an increase in the activity of the active compounds and compositions which can be used according to the invention, better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, higher quality
30 and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products are possible, which exceed the effects which were actually to be expected.

The transgenic plants or plant cultivars (obtained by genetic engineering) which are preferably to be treated according to the invention include all plants which, by virtue of the genetic modification, received genetic material which imparted particularly advantageous, useful traits to these plants. Examples of such traits are better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, higher quality and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products. Further and particularly emphasized examples of such traits are a better defence of the plants against animal and microbial pests, such as against insects, mites, phytopathogenic fungi, bacteria and/or viruses, and also increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds. Examples of transgenic plants which may be mentioned are the important crop plants, such as cereals (wheat, rice), maize, soya beans, potatoes, sugar beet, tomatoes, peas and other vegetable varieties, cotton, tobacco, oilseed rape and also fruit plants (with the fruits apples, pears, citrus fruits and grapes), and particular emphasis is given to maize, soya beans, potatoes, cotton, tobacco and oilseed rape. Traits that are emphasized are in particular increased defence of the plants against insects, arachnids, nematodes and slugs and snails by virtue of toxins formed in the plants, in particular those formed in the plants by the genetic material from *Bacillus thuringiensis* (for example by the genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF and also combinations thereof) (referred to hereinbelow as "Bt plants"). Traits that are also particularly emphasized are the increased defence of the plants against fungi, bacteria and viruses by systemic acquired resistance (SAR), systemin, phytoalexins, elicitors and resistance genes and correspondingly expressed proteins and toxins. Traits that are furthermore particularly emphasized are the increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds, for example imidazolinones, sulphonylureas, glyphosate or phosphinotricin (for example the "PAT" gene). The genes which impart the desired traits in question can also be present in combination with one another in the transgenic plants. Examples of "Bt plants" which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties, soya bean varieties and potato varieties which are sold under the trade names YIELD GARD® (for example maize, cotton, soya beans), KnockOut® (for example maize), StarLink® (for example maize), Bollgard® (cotton), Nucoat® (cotton) and NewLeaf® (potato). Examples of herbicide-tolerant plants which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties and soya bean varieties which are sold under the trade names Roundup Ready® (tolerance to glyphosate, for example maize, cotton, soya bean), Liberty Link® (tolerance to phosphinotricin, for example oilseed rape), IMI® (tolerance to imidazolinones) and STS® (tolerance to sulphonylureas, for example maize). Herbicide-resistant plants (plants bred in a conventional manner for herbicide tolerance) which may be mentioned include the varieties sold under the name Clearfield® (for example maize). Of course, these statements also apply to plant cultivars

having these genetic traits or genetic traits still to be developed, which plant cultivars will be developed and/or marketed in the future.

The plants listed can be treated according to the invention in a particularly advantageous manner with the active compounds of the general formula I according to the invention. The preferred
5 ranges stated above for the active compounds also apply to the treatment of these plants. Particular emphasis is given to the treatment of plants with the active compounds specifically mentioned in the present text.

The active compounds according to the invention act not only against plant, hygiene and stored
10 product pests, but also in the veterinary medicine sector against animal parasites (ecto- and endoparasites), such as hard ticks, soft ticks, mange mites, leaf mites, flies (biting and licking), parasitic fly larvae, lice, hair lice, feather lice and fleas. These parasites include:

From the order of the Anoplurida, for example, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.

From the order of the Mallophagida and the suborders Amblycerina and Ischnocerina, for example,
15 *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

From the order of the Diptera and the suborders Nematocerina and Brachyicerina, for example, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp.,
20 *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp.

From the order of the Siphonapterida, for example, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp.,
25 *Ceratophyllus* spp.

From the order of the Heteropterida, for example, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

From the order of the Blattarida, for example, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

From the subclass of the Acari (Acarina) and the orders of the Meta- and Mesostigmata, for example, Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp.

- 5 From the order of the Actinedida (Prostigmata) and Acaridida (Astigmata), for example, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.
- 10 The active compounds of the formula (I) according to the invention are also suitable for controlling arthropods which infest agricultural productive livestock, such as, for example, cattle, sheep, goats, horses, pigs, donkeys, camels, buffalo, rabbits, chickens, turkeys, ducks, geese and bees, other pets, such as, for example, dogs, cats, caged birds and aquarium fish, and also so-called test animals, such as, for example, hamsters, guinea pigs, rats and mice. By controlling these arthro-
- 15 pods, cases of death and reduction in productivity (for meat, milk, wool, hides, eggs, honey etc.) should be diminished, so that more economic and easier animal husbandry is possible by use of the active compounds according to the invention.

- The active compounds according to the invention are used in the veterinary sector and in animal husbandry in a known manner by enteral administration in the form of, for example, tablets, capsules, potions, drenches, granules, pastes, boluses, the feed-through process and suppositories, by
- 20 parenteral administration, such as, for example, by injection (intramuscular, subcutaneous, intravenous, intraperitoneal and the like), implants, by nasal administration, by dermal use in the form, for example, of dipping or bathing, spraying, pouring on and spotting on, washing and powdering, and also with the aid of moulded articles containing the active compound, such as collars, ear
 - 25 marks, tail marks, limb bands, halters, marking devices and the like.

When used for cattle, poultry, pets and the like, the active compounds of the formula (I) can be used as formulations (for example powders, emulsions, free-flowing compositions), which comprise the active compounds in an amount of 1 to 80% by weight, directly or after 100 to 10 000-fold dilution, or they can be used as a chemical bath.

- 30 It has furthermore been found that the active compounds according to the invention also have a strong insecticidal action against insects which destroy industrial materials.

The following insects may be mentioned as examples and as preferred - but without any limitation:

Beetles, such as *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon*
 5 *aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

Hymenopterons, such as *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

Termites, such as *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*,
 10 *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;

Bristletails, such as *Lepisma saccharina*.

Industrial materials in the present connection are to be understood as meaning non-living materials, such as, preferably, plastics, adhesives, sizes, papers and cardboards, leather, wood and processed wood products and coating compositions.

15 The ready-to-use compositions may, if appropriate, comprise further insecticides and, if appropriate, one or more fungicides.

With respect to possible additional additives, reference may be made to the insecticides and fungicides mentioned above.

The active compounds according to the invention can likewise be employed for protecting objects
 20 which come into contact with seawater or brackish water, such as hulls, screens, nets, buildings, moorings and signalling systems, against fouling.

Furthermore, the active compounds according to the invention, alone or in combinations with other active compounds, may be employed as antifouling agents.

In domestic, hygiene and stored-product protection, the active compounds are also suitable for
 25 controlling animal pests, in particular insects, arachnids and mites, which are found in enclosed spaces such as, for example, dwellings, factory halls, offices, vehicle cabins and the like. They can be employed alone or in combination with other active compounds and auxiliaries in domestic insecticide products for controlling these pests. They are active against sensitive and resistant species and against all developmental stages. These pests include:

From the order of the Scorpionidea, for example, *Buthus occitanus*.

From the order of the Acarina, for example, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

From the order of the Araneae, for example, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

From the order of the Opiliones, for example, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

From the order of the Isopoda, for example, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

10 From the order of the Diplopoda, for example, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

From the order of the Chilopoda, for example, *Geophilus* spp.

From the order of the Zygentoma, for example, *Ctenolepisma* spp., *Lepisina saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

15 From the order of the Blattaria, for example, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

From the order of the Saltatoria, for example, *Acheta domesticus*.

From the order of the Dermaptera, for example, *Forficula auricularia*.

From the order of the Isoptera, for example, *Kalotermes* spp., *Reticulitermes* spp.

20 From the order of the Psocoptera, for example, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

From the order of the Coleoptera, for example, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

25 From the order of the Diptera, for example, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

From the order of the Lepidoptera, for example, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

From the order of the Siphonaptera, for example, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

- 5 From the order of the Hymenoptera, for example, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

From the order of the Anoplura, for example, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

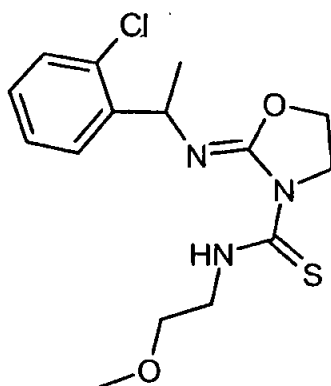
- 10 From the order of the Heteroptera, for example, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

In the field of household insecticides, the active compounds according to the invention are used alone or in combination with other suitable active compounds, such as phosphoric esters, carbamates, pyrethroids, neonicotinoids, growth regulators or active compounds from other known classes of insecticides.

- 15 The active compounds according to the invention are used in aerosols, pressure-free spray products, for example pump and atomizer sprays, automatic fogging systems, foggers, foams, gels, evaporator products with evaporator tablets made of cellulose or polymer, liquid evaporators, gel and membrane evaporators, propeller-driven evaporators, energy-free, or passive, evaporation systems, moth papers, moth bags and moth gels, as granules or dusts, in baits for spreading or in bait
20 stations.

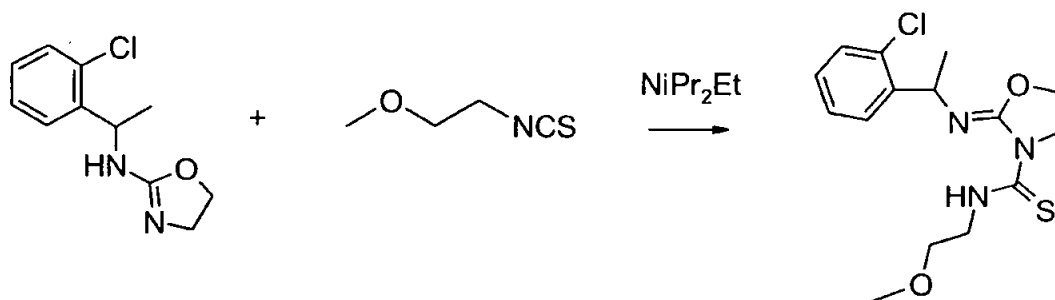
Preparation Examples:**Process 1**

(2Z)-2-[[1-(2-chlorophenyl)ethyl]imino]-N-(2-methoxyethyl)-1,3-oxazolidine-3-carbothioamide



Compound (10)

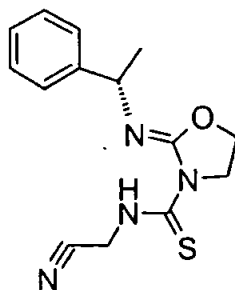
- 5 400 mg (1.78 mmol) N-[1-(2-chlorophenyl)ethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine were initially charged in 10 ml dichloromethane with 209 mg (1.78 mmol) methoxyethylisothiocyanate and subsequently, 214 mg (1.66 mmol) N,N-diisopropylethylamine, solved in 1 ml dichlormethane, were added tropwise. The reaction mixture was stirred 15 h at 20°C and finally all volatile ingredients were evaporated. The reaction gave 600 mg (99 % of theory) of compound 10. Log P acidic 4.08,
- 10 ¹H-NMR (CDCl₃) q 5.24 ppm.



- This procedure can be employed analogously for all compounds of formula (I) in which R⁸ is -C(S)NR¹¹R¹², and R¹² is hydrogen. If the oxazole-amine is present as chiral compound according to formula (IIb), this procedure can be employed analogously for all compounds of formula (Ib) in
- 15 which R⁸ is -C(S)NR¹¹R¹², and R¹² is hydrogen.

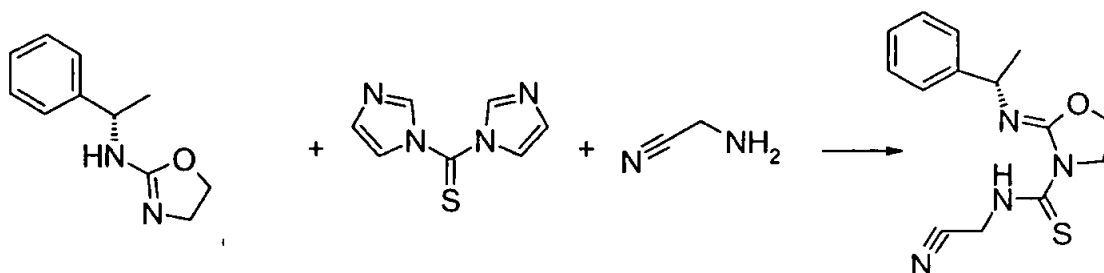
Process 2

(2Z)-N-(cyanomethyl)-2-[(1-phenylethyl)imino]-1,3-oxazolidine-3-carbothioamide



Compound (94*)

200 mg (1.05 mmol) N-[(1S)-1-phenylethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine and 206 mg (1.16 mmol) thiocarbonyldiimidazol were stirred in 40 ml dichloromethane for 1 ½ h at room temperature. Subsequently, 65 mg (1.16 mmol) aminoacetonitrile were added and the mixture was further stirred for 15 h at room temperature. For processing, water was added, the organic phase was removed, dried with sodium sulfate, filtered, and solvents were removed. The product obtained was purified by column chromatography with dichloromethane on aluminium oxide and 50 mg (16 % of theory) of compound 94* were thus isolated. LogP acidic 3.07, ¹H-NMR (DMSO-d₆) q 4.78 ppm.

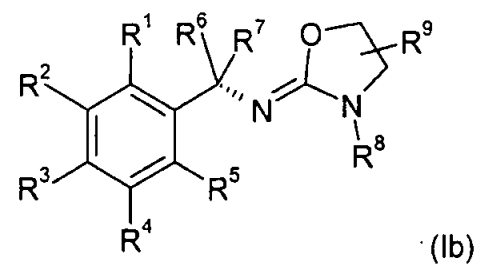
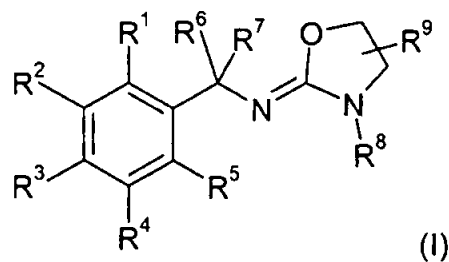


This procedure can be employed analogously for all compounds of formula (Ib) in which R⁸ is -C(S)NR¹¹R¹², and R¹² is hydrogen or alkyl. If the oxazole-amine is present as racemic mixture according to formula (II), this procedure can be employed analogously for all compounds of formula (I) in which R⁸ is -C(S)NR¹¹R¹², and R¹² is hydrogen or alkyl.

Further compounds of the formula (I) and (Ib) are listed in Table 1 below.

Table 1

Compounds of the formula (I) or (Ib)

wherein R⁹ represents hydrogen.

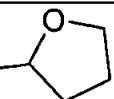
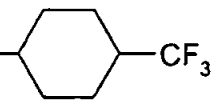
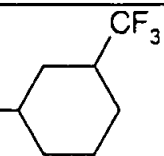
*: S-enantiomers

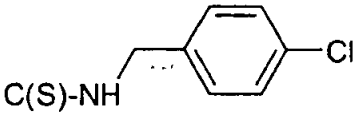
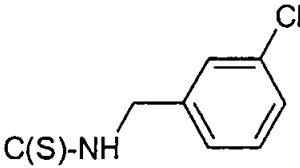
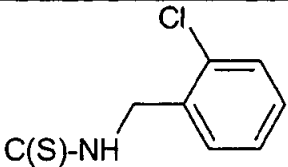
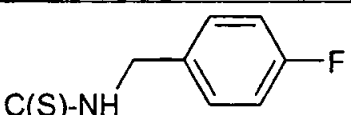
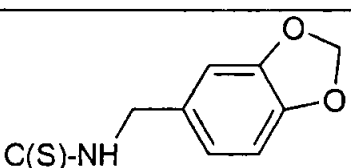
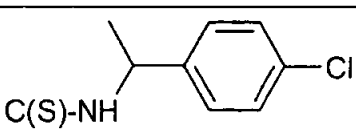
Phys.Data: ¹H-NMR δ in CDCl₃ (A) or DMSO D6 (B), or log P (acidic) (C)

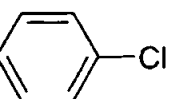
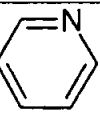
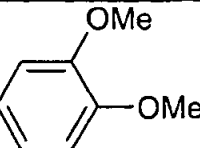
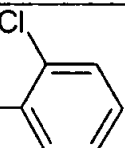
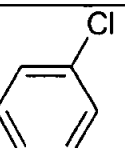
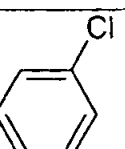
Abbreviations: Me = methyl, Et = ethyl, Pr = propyl, c-Pr = cyclopropyl, c-Pentyl = cyclopentyl, Ph = phenyl, Bu = butyl

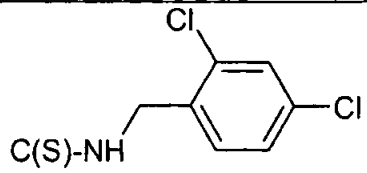
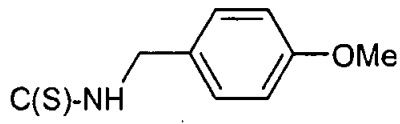
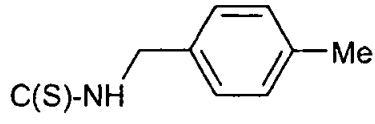
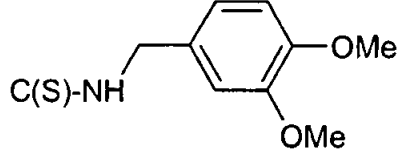
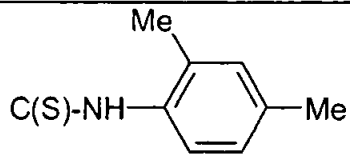
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
1	Me	F	H	H	H	H	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	3.72 m (A)
2*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.8 q (A)
3*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CF ₃	4.8 q (A)
4*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -S-Me	5.11 tr (A)
5*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ -S-Me	5.02 tr (B)

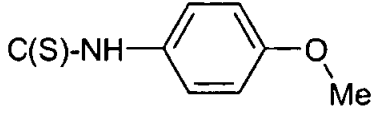
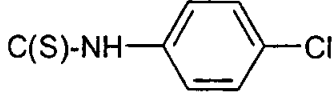
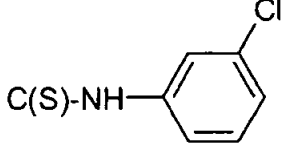
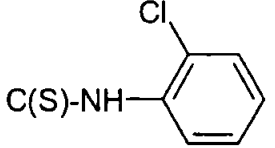
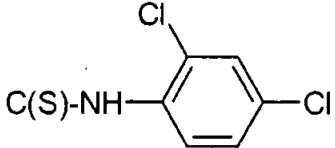
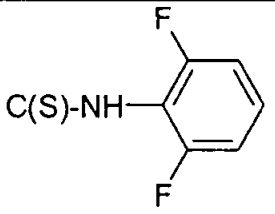
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
6	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.53 tr (B)
7	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CF ₃	4.6 m (B)
8	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	4.53 tr (B)
9	Cl	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	5.26 q (A)
10	Cl	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	5.24 q (A)
11	H	Cl	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.76 q (A)
12*	F	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	5.13 q (A)
13*	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	4.8 q (A)
14	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.8 q (A)
15*	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.8 q (A)
16*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH-(O-Me) ₂	3.42 (C)
17*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-n-C ₃ H ₇	4.77 (C)
18*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CHEt ₂	4.77 (C)
19*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	4.77 (C)
20*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -c-Pr	3.99 (C)
21*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	3.63 (C)
22*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-n-Pr	3.84 (C)
23*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-n-Bu	4.35 (C)
24*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CF ₃	4.51 (C)
25*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	4.35 (C)
26*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -COOMe	3.15 (C)

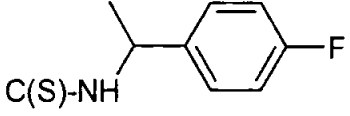
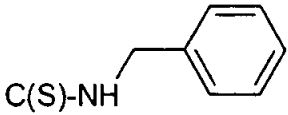
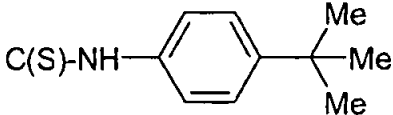
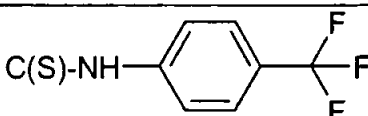
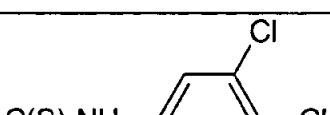
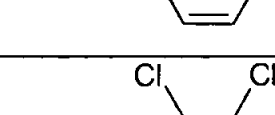
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
27*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ -COOEt	3.94 (C)
28*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -COOEt	3.58 (C)
29*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(i-Pr)-COOMe	4.25 (C)
30*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-COOEt	3.99 (C)
31*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(Et)-COOEt	3.94 (C)
32*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)NH-CH ₂ - 	3.58 (C)
33*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-  -CF ₃	4.92 (C)
34*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-i-Pr	3.94 (C)
35*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-c-Pr	3.37 (C)
36*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-c-Pentyl	4.56 (C)
37*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-  -CF ₃	5.03 (C)
38*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -Ph	4.30 (C)
39*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-Ph	4.67 (C)

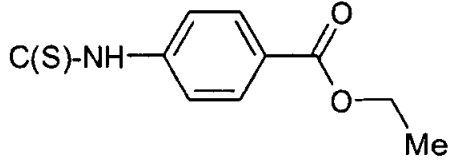
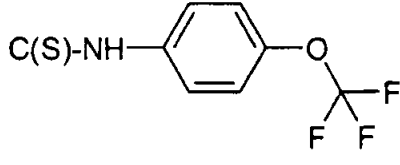
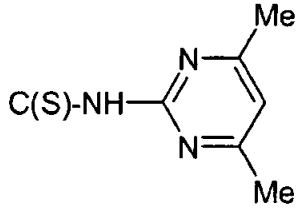
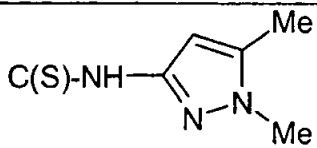
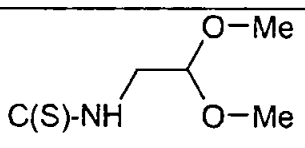
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
40*	H	H	H	H	H	Me	H		4.77 (C)
41*	H	H	H	H	H	Me	H		4.77 (C)
42*	H	H	H	H	H	Me	H		4.77 (C)
43*	H	H	H	H	H	Me	H		4.30 (C)
44*	H	H	H	H	H	Me	H		3.99 (C)
45*	H	H	H	H	H	Me	H		5.19 (C)
46*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -Ph	4.51 (C)

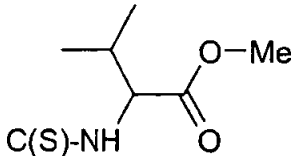
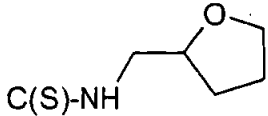
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
47*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ - 	4.92 (C)
48*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ - 	2.03 (C)
49*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ - 	3.63 (C)
50*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)- 	5.08 (C)
51*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)- 	5.14 (C)
52*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ - 	4.92 (C)

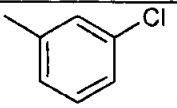
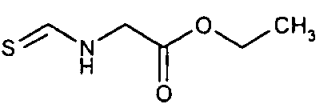
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
53*	H	H	H	H	H	Me	H		5.42 (C)
54*	H	H	H	H	H	Me	H		4.15 (C)
55*	H	H	H	H	H	Me	H		4.72 (C)
56*	H	H	H	H	H	Me	H		3.78 (C)
57	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃) ₂	4.41 (C)
58	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-c-Pr	3.85 (C)
59	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-t-Bu	5.08 (C)
60	H	H	H	H	H	Et	H		5.14 (C)

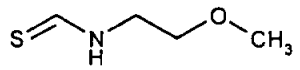
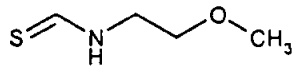
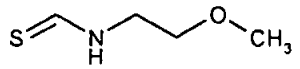
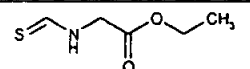
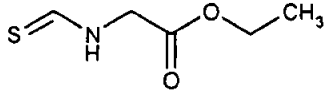
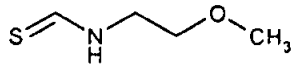
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
61	H	H	H	H	H	Et	H		4.51 (C)
62	H	H	H	H	H	Et	H		5.4 (C)
63	H	H	H	H	H	Et	H		5.4 (C)
64	H	H	H	H	H	Et	H		4.97 (C)
65	H	H	H	H	H	Et	H		5.78 (C)
66	H	H	H	H	H	Et	H		4.41 (C)

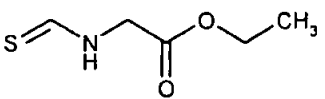
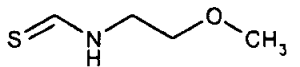
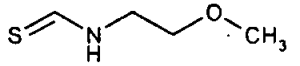
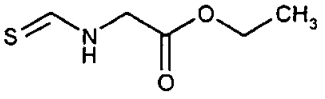
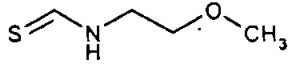
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
67	H	H	H	H	H	Et	H		5.02 (C)
68	H	H	H	H	H	Et	H		4.68 (C)
69	H	H	H	H	H	Et	H		6.09 (C)
70	H	H	H	H	H	Et	H		5.52 (C)
71	H	H	H	H	H	Et	H		6.03 (C)
72	H	H	H	H	H	Et	H		5.46 (C)

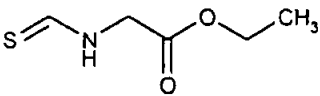
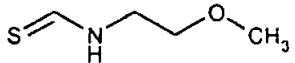
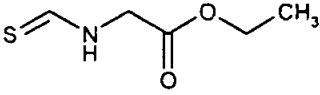
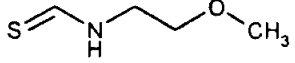
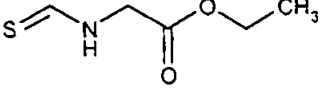
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
73	H	H	H	H	H	Et	H		5.21 (C)
74	H	H	H	H	H	Et	H		5.59 (C)
75	H	H	H	H	H	Et	H		2.05 (C)
76	H	H	H	H	H	Et	H		3.85 (C)
77	H	H	H	H	H	Et	H		3.89 (C)
78	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ CH ₃	5.31 (C)
79	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₂ CH ₃)-CH ₂ CH ₃	5.25 (C)

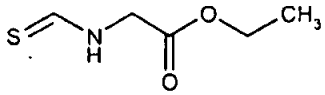
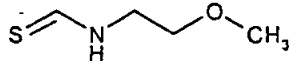
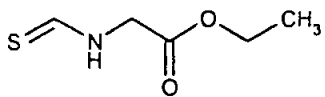
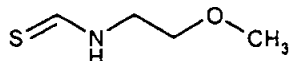
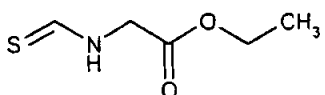
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
80	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃	5.25 (C)
81	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -c-Pr	4.51 (C)
82	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH(CH ₃)CH ₃	4.91 (C)
83	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	4.17 (C)
84	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ CH ₃	4.34 (C)
85	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	4.85 (C)
86	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CF ₃	4.97 (C)
87	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ C(O)OCH ₃	3.61 (C)
88	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ C(O)OEt	4.45 (C)
89	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(O)OEt	4.00 (C)
90	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-C(=O)OMe	4.68 (C)
91	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-C(O)OCH ₂ CH ₃	4.45 (C)
92	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₂ CH ₃)-C(O)OCH ₃	4.40 (C)
93	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O	4.05 (C)
94*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ CN	4.78 q (B)
95	H	F	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.56 tr (A)

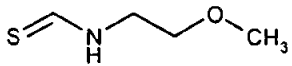
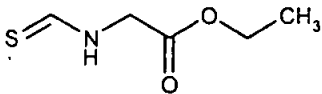
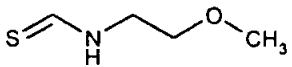
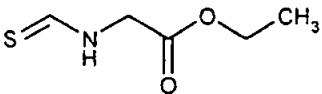
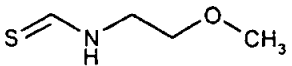
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
96	H	F	H	H	H	CF ₃	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
97	H	H	H	H	H	Ph	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
98*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -SO ₂ -Me	2.5 (C)
99*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -SO-Me	
100*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-C(CH ₃) ₂ -SO ₂ -Me	
101	H	Cl	H	H	H		H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
102	Cl	H	Cl	Cl	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
103	H	F	OMe	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
104	H	H	OMe	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
104	H	OMe	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
105	Me	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
106	OMe	H	H	OMe	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
107	Me	H	Me	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
108	Cl	H	Cl	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
109	H	CF ₃	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.1 (C)
110	H	F	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4.55 t (A)
111*	H	F	H	H	H	Me	H		3,9 (C)

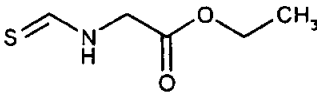
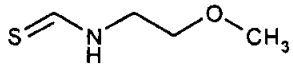
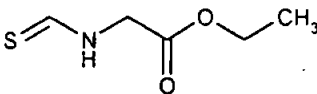
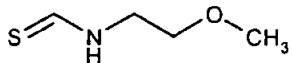
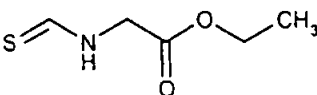
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
112	H	H	H	H	H	H	H		2,9 (C)
113	H	F	H	H	H	H	H		3,2 (C)
114	H	OMe	H	H	H	Me	H		3,3 (C)
115	H	OMe	H	H	H	Me	H		3,6 (C)
116	H	Me	H	H	H	Me	H		4,1 (C)
117	H	Me	H	H	H	Me	H		3,8 (C)

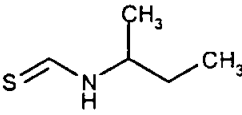
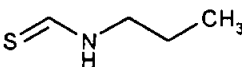
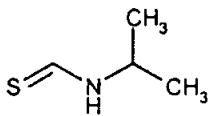
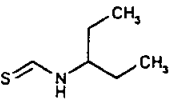
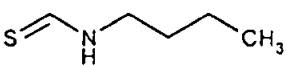
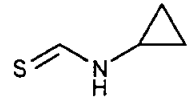
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
118	H	F	H	F	H	Me	H		4,1 (C)
119	H	F	H	F	H	Me	H		3,9 (C)
120	H	F	H	F	H	Et	H		4,3 (C)
121	H	F	H	F	H	Et	H		4,4 (C)
122	F	H	H	F	H	Et	H		4,1 (C)

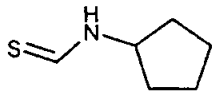
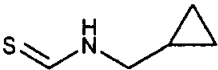
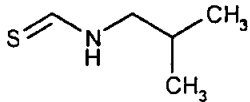
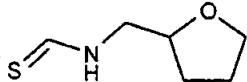
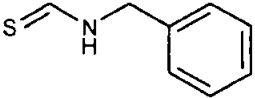
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
123	F	H	H	F	H	Et	H		4,3 (C)
124	F	H	H	F	H	Me	H		3,8 (C)
125	F	H	H	F	H	Me	H		4,0 (C)
126	H	CF ₃	H	H	H	Et	H		4,5 (C)
127	H	CF ₃	H	H	H	Et	H		4,7 (C)

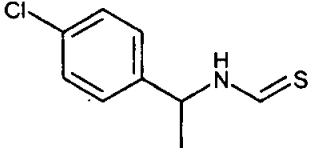
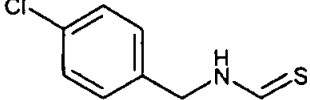
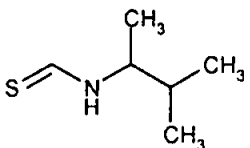
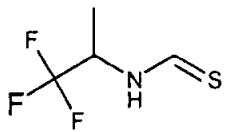
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
128	H	CF ₃	H	H	H	Me	H		4,4 (C)
129	H	OCF ₃	H	H	H	Me	H		4,3 (C)
130	H	OCF ₃	H	H	H	Me	H		4,5 (C)
131	H	Cl	H	Cl	H	Me	H		4,8 (C)
132	H	Cl	H	Cl	H	Me	H		5,0 (C)

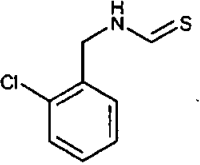
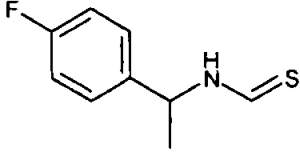
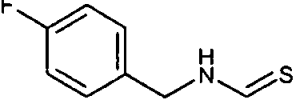
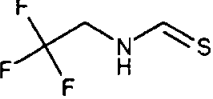
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
133	H	Cl	H	F	H	Me	H		4,3 (C)
134	H	Cl	H	F	H	Me	H		4,5 (C)
135	H	H	F	F	H	Me	H		3,7 (C)
136	H	H	F	F	H	Me	H		4,0 (C)
137	H	F	F	F	H	Me	H		4,0 (C)

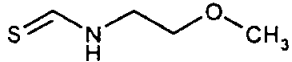
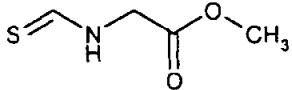
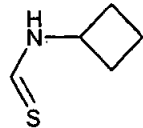
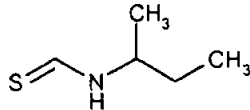
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
138	H	F	F	F	H	Me	H		4,3 (C)
139	H	Cl	H	F	H	Et	H		4,7 (C)
140	H	Cl	H	F	H	Et	H		4,9 (C)
141	H	Cl	H	H	H	CHF ₂	H		3,7 (C)
142	H	Cl	H	H	H	CHF ₂	H		3,9 (C)

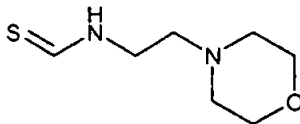
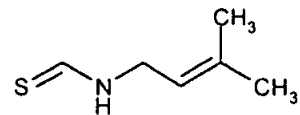
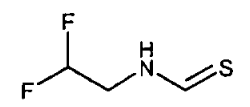
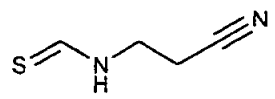
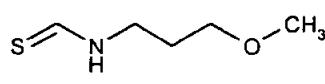
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
143*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)
144*	H	F	H	H	H	Me	H		4,11 (C)
145*	H	F	H	H	H	Me	H		4,11 (C)
146*	H	F	H	H	H	Me	H		4,94 (C)
147*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)
148*	H	F	H	H	H	Me	H		3,68 (C)

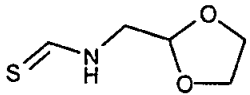
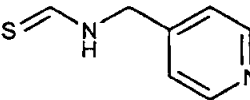
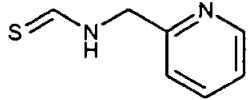
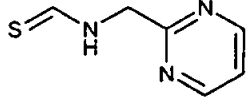
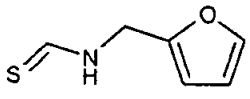
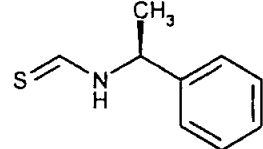
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
149*	H	F	H	H	H	Me	H		4,72 (C)
150*	H	F	H	H	H	Me	H		4,17 (C)
151*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)
152*	H	F	H	H	H	Me	H		3,78 (C)
153*	H	F	H	H	H	Me	H		4,40 (C)

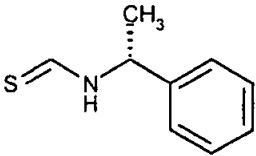
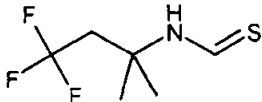
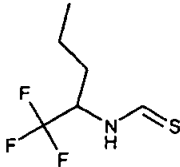
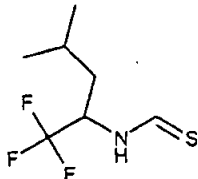
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
154*	H	F	H	H	H	Me	H		5,22 (C)
155*	H	F	H	H	H	Me	H		4,80 (C)
156*	H	F	H	H	H	Me	H		4,87 (C)
157*	H	F	H	H	H	Me	H		4,40 (C)

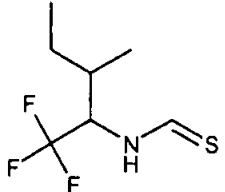
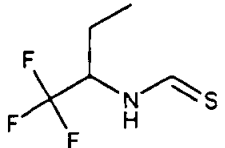
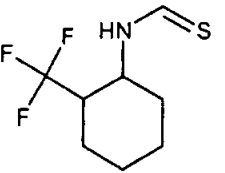
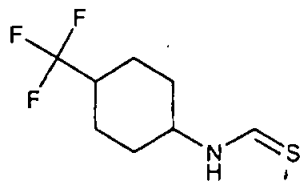
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
158*	H	F	H	H	H	Me	H		4,80 (C)
159*	H	F	H	H	H	Me	H		4,72 (C)
160*	H	F	H	H	H	Me	H		4,34 (C)
161*	H	F	H	H	H	Me	H		4,00 (C)

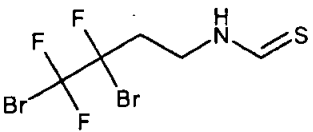
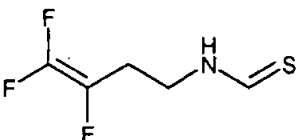
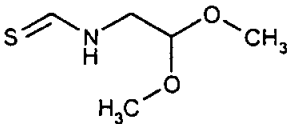
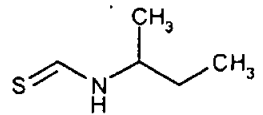
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
162*	H	F	H	H	H	Me	H		3,47 (C)
163*	H	F	H	H	H	Me	H		3,28 (C)
164*	H	H	H	H	H	Me	H		4,28 (C)
165*	H	H	H	H	H	Me	H		4,45 (C)

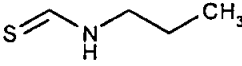
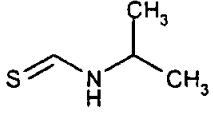
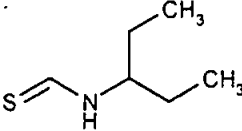
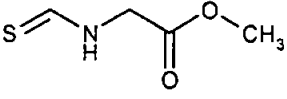
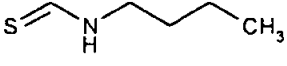
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
166*	H	H	H	H	H	Me	H		1,26 (C)
167*	H	H	H	H	H	Me	H		4,57 (C)
168*	H	H	H	H	H	Me	H		3,63 (C)
169*	H	H	H	H	H	Me	H		2,85 (C)
170*	H	H	H	H	H	Me	H		3,27 (C)

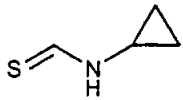
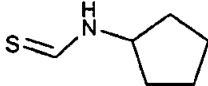
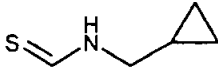
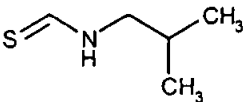
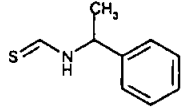
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
171*	H	H	H	H	H	Me	H		3,18 (C)
172*	H	H	H	H	H	Me	H		1,69 (C)
173*	H	H	H	H	H	Me	H		1,52 (C)
174*	H	H	H	H	H	Me	H		1,45 (C)
175*	H	H	H	H	H	Me	H		3,89 (C)
176*	H	H	H	H	H	Me	H		4,74 (C)

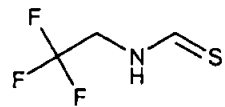
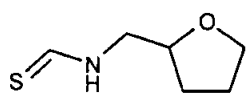
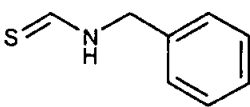
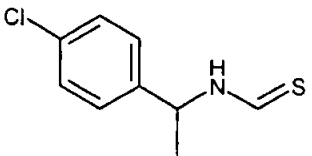
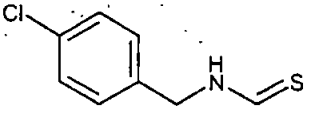
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
177*	H	H	H	H	H	Me	H		4,74 (C)
178*	H	H	H	H	H	Me	H		4,85 (C)
179*	H	H	H	H	H	Me	H		5,14 (C)
180*	H	H	H	H	H	Me	H		5,46 (C)

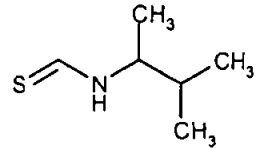
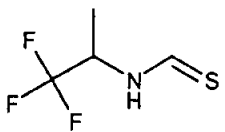
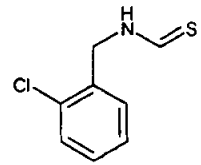
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
181*	H	H	H	H	H	Me	H		5,46 (C)
182*	H	H	H	H	H	Me	H		4,80 (C)
183*	H	H	H	H	H	Me	H		4,85 (C)
184*	H	H	H	H	H	Me	H		4,91 (C)

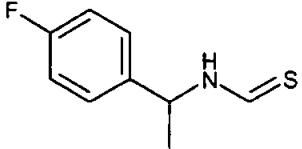
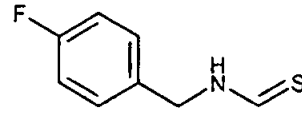
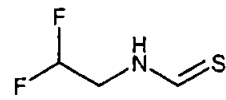
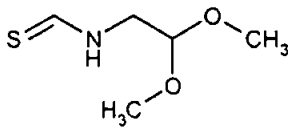
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
185*	H	H	H	H	H	Me	H		5,16 (C)
186*	H	H	H	H	H	Me	H		4,30 (C)
187	H	F	H	F	H	Me	H		3,85 (C)
188	H	F	H	F	H	Me	H		4,76 (C)

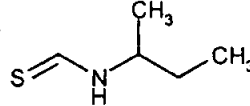
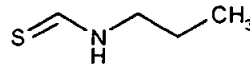
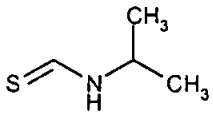
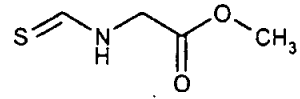
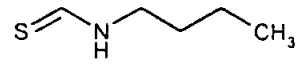
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
189	H	F	H	F	H	Me	H		4,40 (C)
190	H	F	H	F	H	Me	H		4,45 (C)
191	H	F	H	F	H	Me	H		5,15 (C)
192	H	F	H	F	H	Me	H		3,56 (C)
193	H	F	H	F	H	Me	H		4,85 (C)

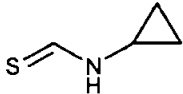
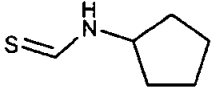
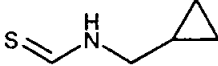
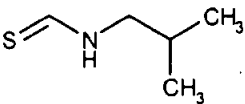
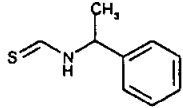
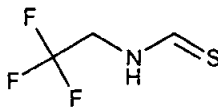
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
194	H	F	H	F	H	Me	H		4,00 (C)
195	H	F	H	F	H	Me	H		4,85 (C)
196	H	F	H	F	H	Me	H		4,45 (C)
197	H	F	H	F	H	Me	H		4,83 (C)
198	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)

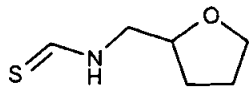
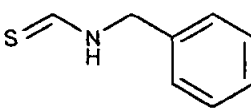
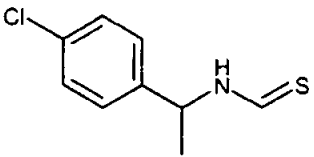
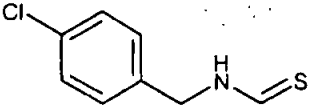
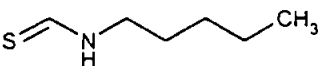
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
199	H	F	H	F	H	Me	H		4,17 (C)
200	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)
201	H	F	H	F	H	Me	H		4,64 (C)
202	H	F	H	F	H	Me	H		5,29 (C)
203	H	F	H	F	H	Me	H		5,02 (C)

Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
204	H	F	H	F	H	Me	H		5,22 (C)
205	H	F	H	F	H	Me	H		5,08 (C)
206	H	F	H	F	H	Me	H		4,57 (C)
207	H	F	H	F	H	Me	H		5,02 (C)

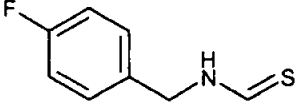
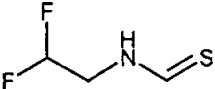
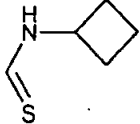
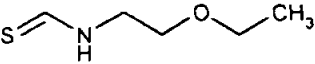
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
208	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
209	H	F	H	F	H	Me	H		4,57 (C)
210	H	F	H	F	H	Me	H		3,80 (C)
211	H	H	H	H	H	H	H		3,09 (C)

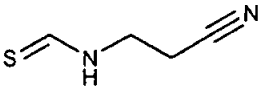
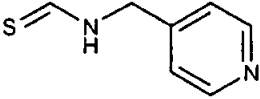
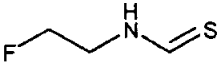
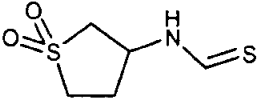
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
212	H	H	H	H	H	H	H		4,05 (C)
213	H	H	H	H	H	H	H		3,51 (C)
214	H	H	H	H	H	H	H		3,61 (C)
215	H	H	H	H	H	H	H		2,73 (C)
216	H	H	H	H	H	H	H		4,05 (C)

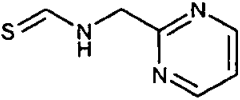
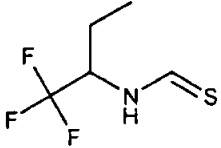
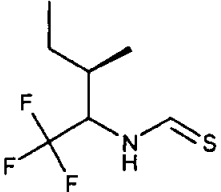
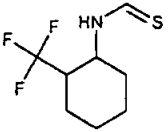
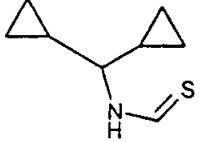
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
217	H	H	H	H	H	H	H		3,04 (C)
218	H	H	H	H	H	H	H		4,28 (C)
219	H	H	H	H	H	H	H		3,65 (C)
220	H	H	H	H	H	H	H		3,17 (C)
221	H	H	H	H	H	H	H		4,40 (C)
222	H	H	H	H	H	H	H		3,70 (C)

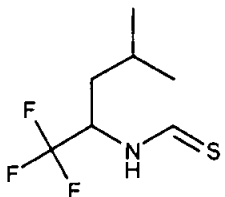
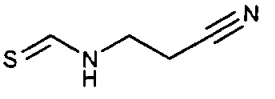
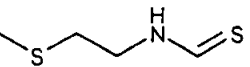
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
223	H	H	H	H	H	H	H		3,23 (C)
224	H	H	H	H	H	H	H		4,00 (C)
225	H	H	H	H	H	H	H		4,89 (C)
226	H	H	H	H	H	H	H		4,51 (C)
227	H	H	H	H	H	H	H		4,57 (C)

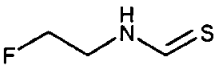
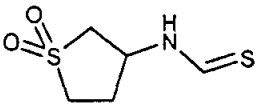
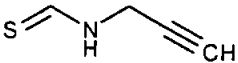
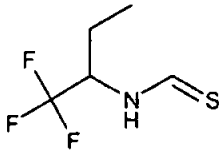
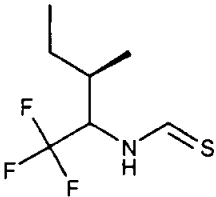
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
228	H	H	H	H	H	H	H		4,51 (C)
229	H	H	H	H	H	H	H		4,11 (C)
230	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
231	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)

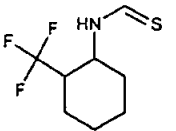
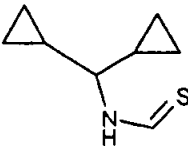
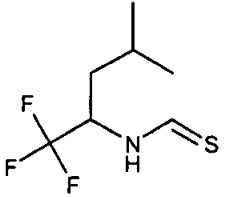
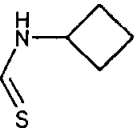
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
232	H	H	H	H	H	H	H		4,00 (C)
233	H	H	H	H	H	H	H		3,32 (C)
234	H	F	H	F	H	Me	H		4,64 (C)
235	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)

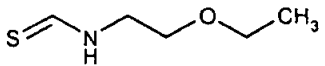
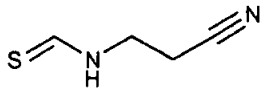
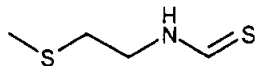
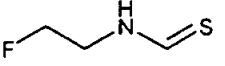
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
236	H	F	H	F	H	Me	H		3,19 (C)
237	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)
238	H	F	H	F	H	Me	H		1,96 (C)
239	H	F	H	F	H	Me	H		3,63 (C)
240	H	F	H	F	H	Me	H		2,93 (C)

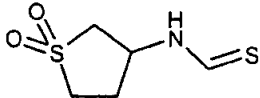
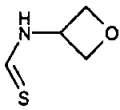
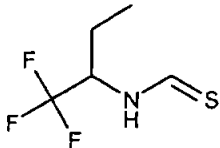
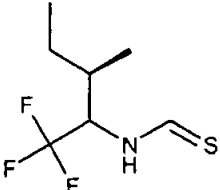
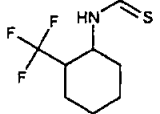
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
241	H	F	H	F	H	Me	H		1,66 (C)
242	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
243	H	F	H	F	H	Me	H		5,51 (C)
244	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
245	H	F	H	F	H	Me	H		5,08 (C)

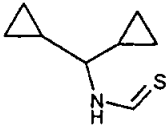
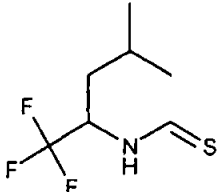
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
246	H	F	H	F	H	Me	H	 <chem>CC(C)C(C(F)(F)F)NC=S</chem>	5,51 (C)
247	H	H	H	H	H	H	H	 <chem>COCCNCS</chem>	3,33 (C)
248	H	H	H	H	H	H	H	 <chem>N#CCCCS</chem>	2,50 (C)
249	H	H	H	H	H	H	H	 <chem>CSCCNCS</chem>	3,37 (C)

Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
250	H	H	H	H	H	H	H		2,89 (C)
251	H	H	H	H	H	H	H		2,38 (C)
252	H	H	H	H	H	H	H		3,06 (C)
253	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
254	H	H	H	H	H	H	H		5,15 (C)

Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
255	H	H	H	H	H	H	H		4,57 (C)
256	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
257	H	H	H	H	H	H	H		5,15 (C)
258	H	F	H	H	H	H	H		4,05 (C)

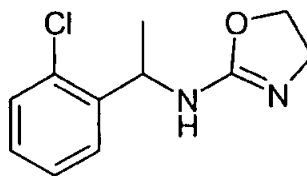
Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
259	H	F	H	H	H	H	H		3,47 (C)
260	H	F	H	H	H	H	H		2,69 (C)
261	H	F	H	H	H	H	H		3,53 (C)
262	H	F	H	H	H	H	H		3,06 (C)

Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
263	H	F	H	H	H	H	H		2,50 (C)
264	H	F	H	H	H	H	H		0,86 (C)
265	H	F	H	H	H	H	H		4,40 (C)
266	H	F	H	H	H	H	H		5,08 (C)
267	H	F	H	H	H	H	H		4,51 (C)

Compd. No	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Phys. Data
268	H	F	H	H	H	H	H		4,57 (C)
269	H	F	H	H	H	H	H		5,08 (C)

Preparation of starting materials

N-[1-(2-chlorophenyl)ethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine

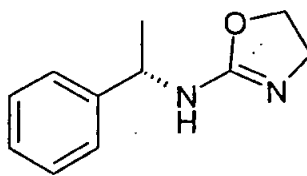
**Step 1:**

3.2 g (20.6mmol) 1-(2-chlorophenyl)ethanamine [CAS 39959-67-6] and 52.3 g (22.6 mmol) triethylamine were given into 20 ml dichloromethane and afterwards 2.4 g (22.6 mmol) 2-chloroethylisocyanat were added dropwise. The mixture was allowed to react 15 hours at 20°C. The volatile components were evaporated to give 1-(2-chloroethyl)-3-[1-(2-chlorophenyl)ethyl]urea (log p = 2.3) that was used in step 2 without further purification

Step 2:

7.2 g (27.5 mmol) 1-(2-chloroethyl)-3-[1-(2-chlorophenyl)ethyl]urea , 5.25 g (34.5 mmol) 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-en (DBU) were heated to 60 °C in 60 ml of acetonitrile for about 15 hours. The volatile components were evaporated, and the residue was dissolved in water and dichloromethane. The organic phase was dried with sodiumsulfate and after filtration evaporated. The remaining solid was washed with cold acetonitrile to give 2.4 g N-[1-(2-chlorophenyl)ethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine (39 % of theory). (1H-NMR (CDCl₃): 4.76 quartett)

N-[(1S)-1-phenylethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine



Step 1:

6.1 g (50.3 mmol) 1(S)-1-phenylethylamine [CAS 2627-86-3] and 5.6 g (55.3 mmol) triethylamine were given into 45 ml dichloromethane and afterwards 5.8 g (22.6 mmol) 2-chloroethylisocyanate were added dropwise. The mixture was allowed to react 15 hours at 20°C. The volatile components were evaporated to give 1-(2-chloroethyl)-3-[(1S)-1-phenylethyl]urea (log p = 1.76) that was used in step 2 without further purification.

Step 2:

11.4 g (50.3 mmol) 1-(2-chloroethyl)-3-[(1S)-1-phenylethyl]urea, and 9.6 g (63 mmol) 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-en (DBU) were heated to 60°C in 50 ml of acetonitrile for about 15 hours. The volatile components were evaporated; the residue was dissolved in ethyl acetate and washed three times with water. The organic phase was dried with sodiumsulfate and after filtration evaporated to give 8 g N-[(1S)-1-phenylethyl]-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-amine (79 % of theory). (1H-NMR (DMSO-d₆): 4.61 quartett)

Biological Examples**Example No. 1****Myzus test (spray treatment)**

Solvent: 78 parts by weight of acetone
 1.5 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 0.5 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Disks of Chinese cabbage (*Brassica pekinensis*) which are infested with all stages of the green peach aphid (*Myzus persicae*) are sprayed with a preparation of active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the effect in % is determined. 100% means that all aphids have been killed; 0% means that none of the aphids have been killed.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show at least 80 % activity at a concentration of 500 g/ha:

Compounds No. 1-8, 11-48, 51, 54-57, 59-69, 72, 74, 75, and 77-93.

Example No. 2**Tetranychus test, OP-resistant (spray treatment)**

Solvents: 78 parts by weight of acetone
 1.5 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 0.5 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvents and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Discs of bean leaves (*Phaseolus vulgaris*) which are infested by all stages of the greenhouse red spider mite (*Tetranychus urticae*) are sprayed with a preparation of active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the effect in % is determined. 100% means that all spider mites have been killed; 0% means that none of the spider mites have been killed.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show at least 80 % activity at a concentration of 20 g/ha:

Compounds No. 3, 5, 25, 32, and 34.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show at least 80 % activity at a concentration of 100 g/ha:

Compounds No. 2, 11, 15, 20, 21, 22, 24, 28, 33, 35-38, 40-42, 45, 47, and 78.

In this test, for example, the following compound of table 1 shows at least 80 % activity at a concentration of 500 g/ha:

Compound No. 27.

Example No. 3**Meloidogyne test (spray treatment)**

Solvent: 80 parts by weight of acetone

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Containers are filled with sand, active compound solution, *Meloidogyne incognita* egg/larvae suspension and lettuce seeds. The lettuce seeds germinate and the plants develop. On the roots, galls are formed.

After the desired period of time, the nematocidal activity is determined by the formation of galls in %. 100% means that no galls were found; 0% means that the number of galls on the treated plants corresponds to that of the untreated controls.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show at least 80 % activity at a concentration of 20 ppm:

Compounds No. 62-65.

Example No. 4**Aphis gossypii test (spray treatment)**

Solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 2 parts by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Cotton leaves (*Gossypium hirsutum*) which are heavily infested with the cotton aphid (*Aphis gossypii*) are sprayed with a preparation of active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the kill in % is determined. 100% means that all aphids have been killed; 0% means that none of the aphids have been killed.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show at least 80 % activity at a concentration of 100 ppm:

Compounds No. 6-8.

Example No. 5**Boophilus microplus test (injection)**

Solvent: dimethyl sulphoxide

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent, and the concentrate is diluted with solvent to the desired concentration.

The solution of active compound is injected into the abdomen (*Boophilus microplus*), and the animals are transferred into dishes and kept in a temperature-controlled room.

After the desired period of time, the effect in % is determined. 100% means that no tick has laid any fertile eggs.

In this test, for example, the following compound of table 1 shows at least 80 % activity at a concentration of 20 µg/animal:

Compound No. 78.

Comparative Biological Examples**Example No. 1****Myzus test (MYZUPE spray treatment)**

Solvent: 78 parts by weight of acetone
 1.5 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 0.5 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Disks of Chinese cabbage (*Brassica pekinensis*) which are infested with all stages of the green peach aphid (*Myzus persicae*) are sprayed with a preparation of active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the effect in % is determined. 100% means that all aphids have been killed; 0% means that none of the aphids have been killed.

In this test, for example, the following compounds of table 1 show an activity superior to the prior art: see table 2

Example No. 2**Tetranychus test; OP-resistant (TETRUR spray treatment)**

Solvents: 78 parts by weight of acetone
 1.5 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 0.5 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvents and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Discs of bean leaves (*Phaseolus vulgaris*) which are infested by all stages of the greenhouse red spider mite (*Tetranychus urticae*) are sprayed with a preparation of active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the effect in % is determined. 100% means that all spider mites have been killed; 0% means that none of the spider mites have been killed.

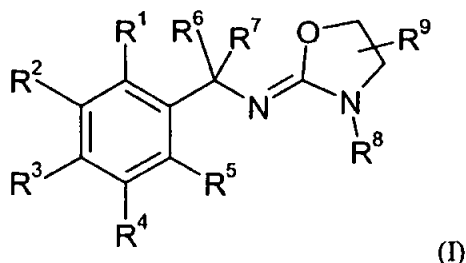
In this test, for example, the following compounds of table 1 show an activity superior to the prior art: see table 2

Table 2 Comparative examples

Compound	1. MYZUPE spray appl.		2. TETRUR spray appl.	
	g/ha	% 6 d	g/ha	% 6 d
2 according to invention (Table 1)	20	100	100	90
3 according to invention (Table 1)	20	100	100	70
B49 according to WO 2006/127426, p. 48	20	0	100	0

Patent claims

1. Compounds of the formula (I)



in which

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , and R^5 independently from each other represent hydrogen, halogen, hydroxy, alkyl, alkoxy, haloalkyl, alkoxyalkyl, cycloalkyl, cyanoalkyl, haloalkoxy, alkylthio, haloalkylthio, alkylsulfonyl, alkylsulfonyloxy, halogenalkylsulfonyl, halogenalkylsulfonyloxy, alkoxycarbonyl, acetyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, pentafluorosulfanyl, amino, mono- and dialkylamino, cycloalkylamino, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, cyano, or nitro, or represent independently from each other aryl, aryloxy or heteroaryl which are optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, alkoxycarbonyl, nitro, and cyano;

R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylmercaptoalkyl, alkenyl, or alkynyl, or represent independently from each other aryl, heteroaryl or heterocyclyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, alkoxy, nitro, and cyano;

R^8 represents $-C(Z)R^{10}$, $-C(Z)OR^{10}$, or $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z represents O or S;

R^9 represents hydrogen, alkyl, or haloalkyl;

R^{10} represents C_1 - C_2 alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto and cyano, or represents C_3 - C_6 alkyl, cycloalkyl, or benzyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, and alkoxy;

R^{11} represents C_1 - C_2 alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl and cyano, or represents C_3 - C_8 alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkenyl, or alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, heterocyclyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, $S(O)_n$ -alkyl, and $S(O)_n$ -halogenalkyl;

R^{12} represents hydrogen or alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, cyano, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, or heteroaryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, $S(O)_n$ -alkyl, and $S(O)_n$ -halogenalkyl;

n is 0, 1 or 2

2. Compounds of the formula (I) according to claim 1, in which

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , and R^5 independently from each other represent hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, haloalkyl, alkoxyalkyl, cycloalkyl, haloalkoxy, alkylthio, haloalkylthio, alkylsulfonyl, alkylsulfonyloxy, halogenalkylsulfonyl, alkoxycarbonyl, acetyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, dialkylamino, cycloalkylamino, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, cyano, or nitro;

R^6 and R^7 independently from each other represent hydrogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, alkoxyalkyl, alkylmercaptoalkyl, alkenyl, or alkynyl, or independently from each other represent aryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, alkoxy, nitro and cyano;

R^8 represents $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z represents O or S;

- R⁹ represents hydrogen, or alkyl;
- R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl and cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkenyl, or alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy, alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, heterocyclyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, S(O)_n-alkyl, and S(O)_n-halogenalkyl;
- R¹² represents hydrogen or alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, cyano, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, dialkylamino, alkoxycarbonyl, and dialkylaminocarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclylalkyl, aryl, or heteroaryl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, dialkylaminocarbonyl, cyano, nitro, dialkylamino, S(O)_n-alkyl, and S(O)_n-halogenalkyl;
- n is 0, 1 or 2

3. Compounds of the formula (I) according to claim 1 or 2, in which

- R¹, R², R³, R⁴, and R⁵ independently from each other represent hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, haloalkoxy or haloalkyl;
- R⁶ and R⁷ independently from each other represent hydrogen, alkyl, or haloalkyl;
- R⁸ represents -C(S)NR¹¹R¹²;
- R⁹ represents hydrogen;
- R¹¹ represents C₁-C₂ alkyl, substituted with one or more substituents selected from halogen, alkoxy, alkylmercapto, alkoxycarbonyl, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, or cyano, or represents C₃-C₈ alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, or alkenyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, haloalkyl, alkoxy,

alkylmercapto, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, and alkoxycarbonyl, or represents arylalkyl, heterocyclyl, heterocyclylalkyl, aryl, heteroaryl, or heteroarylalkyl, optionally substituted with one or more substituents selected from halogen, alkyl, halogenalkyl, alkoxy, halogenalkoxy, alkoxycarbonyl, and heterocyclyl; and

R^{12} represents hydrogen.

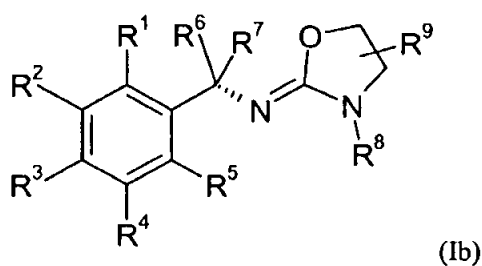
4. Compounds of the formula (I) according to claim 3, in which

R^6 represents alkyl,

R^7 represents hydrogen, and

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^8, R^9, R^{11}$ and R^{12} are as defined in claim 3.

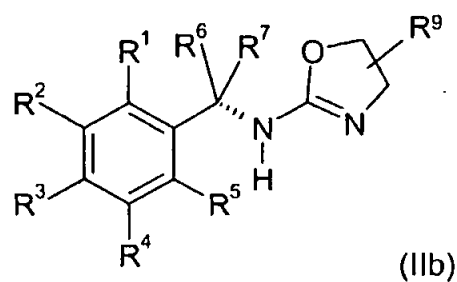
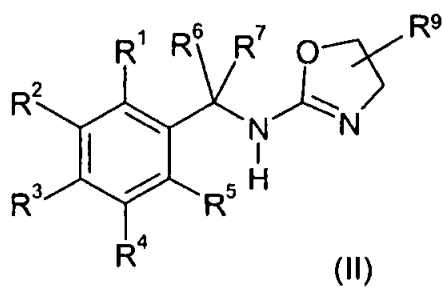
5. Compounds of formula (Ib)



in which R^1 to R^{12} are as defined in any of claims 1 to 4.

6. Method for the preparation of compounds of the formula (I) or (Ib) according to any of claims 1 to 5 in which R^8 is $-C(S)NR^{11}R^{12}$, and R^{12} is hydrogen, wherein

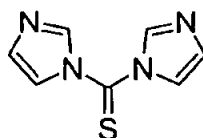
a compound of the formula (II) or (IIb)



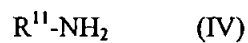
in which

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7$ and R^9 are as defined above

is reacted with thiocarbonyldiimidazole



and a compound of the formula (IV)



in which

R^{11} is as defined above,

in an aprotic solvent.

7. Composition comprising at least one compound of the formula (I) or (Ib) according to any of claims 1 to 5 and customary extenders and/or surfactants.

8. Method for controlling pests, wherein a compound of the formula (I) or (Ib) according to any of claims 1 to 5 or a composition according to claim 7 is allowed to act on the pests and/or their habitat.
9. Use of compounds of the formula (I) or (Ib) according to any of claims 1 to 5 or of compositions according to claim 7 for controlling pests.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2008/002475

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. A01N43/76 C07D263/28 A01P5/00 A01P7/00 A01P9/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI 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 2006/127426 A (FMC CORP [US]; DIXSON JOHN A [US]; THEODORIDIS GEORGE [US]; ELSHENAWY) 30 November 2006 (2006-11-30) cited in the application	1-5, 7-9
Y	claim 3; examples B1-B49	6
Y	WO 2005/007601 A (ACHILLION PHARMACEUTICALS INC [US]; PHADKE AVINASH [US]; QUINN JESSE []) 27 January 2005 (2005-01-27) cited in the application the whole document	6

☐ 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

- *I* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *G* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

17 July 2008

Date of mailing of the international search report

29/07/2008

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

Bertrand, Franck

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

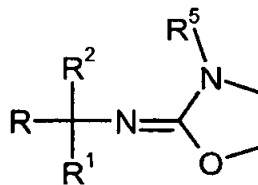
International application No
PCT/EP2008/002475

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2006127426 A	30-11-2006	AU 2006251901 A1	30-11-2006
		EP 1885180 A2	13-02-2008
		KR 20080018891 A	28-02-2008
WO 2005007601 A	27-01-2005	AU 2004257277 A1	27-01-2005
		BR PI0412502 A	19-09-2006
		CA 2531068 A1	27-01-2005
		EP 1648862 A2	26-04-2006
		JP 2007523868 T	23-08-2007
		KR 20070007759 A	16-01-2007
		MX PA06000418 A	05-04-2006

DERIVADOS INSECTICIDAS DE BENCILAMINAS SUSTITUIDAS

La presente solicitud se refiere a novedosos derivados insecticidas de bencilaminas sustituidas, a procedimientos para su preparación, y a su uso
5 para controlar plagas animales, especialmente artrópodos, en particular insectos.

Los derivados heterocíclicos de bencilamino insecticidas y acaricidas de fórmula general

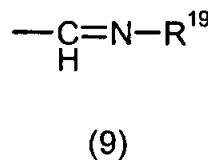
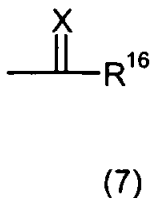
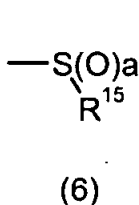
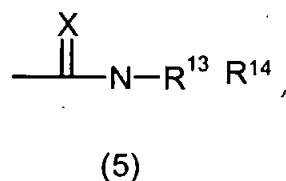
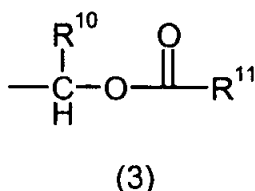
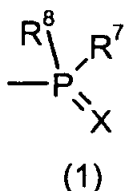


10 en la que

R es 1-naftilo, fenilo o fenilo sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de halógeno o alquilo (C₁-C₂);

R¹ se selecciona de hidrógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₂); R² es hidrógeno; R⁵ se selecciona de ciano, alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), 4-
15 alcoxi (C₁-C₂)-bencilo,

2



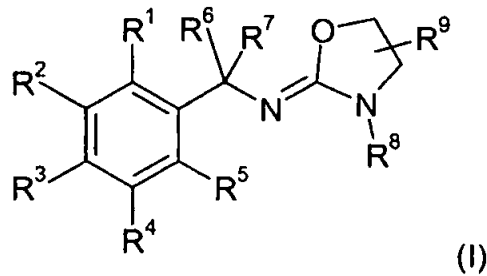
en las que

X es oxígeno o azufre; R⁷ y R⁸ son alcoxi (C₁-C₂) o haloalquilo (C₁-C₂); R¹⁰ es hidrógeno; R¹¹ es alquilo (C₁-C₄); R¹³ es alquilo (C₁-C₂); R¹⁴ es hidrógeno o alquilo (C₁-C₂); a es 2; R¹⁵ es alquilo (C₁-C₂) o dialquil (C₁-C₂)-amino; R¹⁶ es alquilo (C₁-C₂) o alcoxi (C₁-C₂); y R¹⁹ es alquilo (C₁-C₂) o alcoxi (C₁-C₂);

a condición de que cuando R sea 1-naftilo y R⁵ sea la fórmula (5) en la que X es azufre, R¹³ es metilo y R¹⁴ es hidrógeno, entonces R¹ sea distinto de alquilo (C₁-C₂); y cuando R sea 3-cloro-2-metilfenilo y R¹ sea hidrógeno, entonces R⁵ sea distinto de la fórmula (5) en la que X es oxígeno, R¹³ es metilo y R¹⁴ es hidrógeno o la fórmula (6) en la que a es 2 y R¹⁵ es metilo, se describen como una realización en el documento WO 2006/127426 (véase, por ejemplo, la fórmula IB, página 8).

15 Sin embargo, existe una demanda continua de nuevos insecticidas y acaricidas que no sólo son más seguros y menos costosos que los compuestos conocidos, sino que en particular son más eficaces.

La presente invención proporciona ahora compuestos novedosos de fórmula (I)



en la que

- 5 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo, alcoxi, haloalquilo, alcoxialquilo, cicloalquilo, cianoalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo, alcoxycarbonilo, acetilo, alquylcarbonilo, alquylcarbonilo, pentafluorosulfanilo, amino, mono y dialquilamino, cicloalquilamino, alquylamino, haloalquylamino, alquylamino, haloalquylamino, ciano o nitro, o
- 10 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 independientemente entre sí representan independientemente entre sí arilo, arilo o heteroarilo que están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxycarbonilo, nitro y ciano;
- 15 R^6 y R^7 independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alquylmercaptoalquilo, alquylamino o alquylamino, o representan independientemente entre sí arilo, heteroarilo o heterociclilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi, nitro y ciano;
- 20 R^6 y R^7 independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alquylmercaptoalquilo, alquylamino o alquylamino, o representan independientemente entre sí arilo, heteroarilo o heterociclilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi, nitro y ciano;

4

- R^8 representa $-C(Z)R^{10}$, $-C(Z)OR^{10}$ o $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;
- Z representa O o S;
- R^9 representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo;
- R^{10} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes
 5 seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmecapto y ciano, o representa alquilo C_3-C_6 , cicloalquilo o bencilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno y alcoxi;
- R^{11} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes
 10 seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmecapto, alcoxycarbonilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y ciano, o representa alquilo C_3-C_8 , cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenoilo o alquinoilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquilmecapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcoxycarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa
 15 arilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxycarbonilo, heterociclilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halogenoalquilo;
- R^{12} representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alquenoilo, alquinoilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados
 20 de halógeno, alcoxi, alquilmecapto, ciano, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcoxycarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterocicilalquilo, arilo o heteroarilo, opcionalmente
 25 sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno,

5

alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcóxicarbonilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halogenoalquilo; y

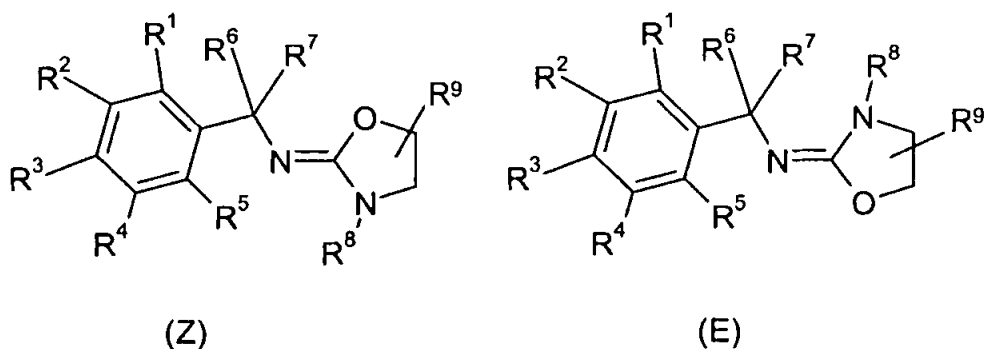
n es 0, 1 ó 2.

5 Dependiendo de, entre otras cosas, la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la presente invención puede estar presentes como isómeros geométricos y/o como ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes de composición variable. Las moléculas que no son superponibles sobre su imagen especular se llaman quirales; estas moléculas
10 son ópticamente activas. Si una molécula no es superponible sobre su imagen especular, la imagen especular debe ser una molécula diferente, ya que la capacidad de superposición es igual que la identidad. En cada caso de actividad óptica de un compuesto puro hay dos y sólo dos isómeros, llamados enantiómeros, que sólo se diferencian en la estructura en la quiralidad
15 izquierda y derecha de sus orientaciones. Los enantiómeros se diferencian en que giran el plano de la luz polarizada en direcciones opuestas y en que reaccionan a diferentes velocidades con otros compuestos quirales o en presencia de un catalizador quiral (véase March's Advanced Organic Chemistry 5ª edición; Wiley 2001 página 125-126).

20 Siempre que los sustituyentes R^6 y R^7 sean diferentes, el átomo de C al que están unidos es asimétrico o quiral y el compuesto respectivo es ópticamente activo. Según el sistema de Cahn-Ingold-Prelog que clasifica los cuatro grupos sobre un átomo de carbono asimétrico en orden de número atómico decreciente, el átomo de C asimétrico está presente en la
25 configuración S o R (véase March's Advanced Organic Chemistry 5ª edición;

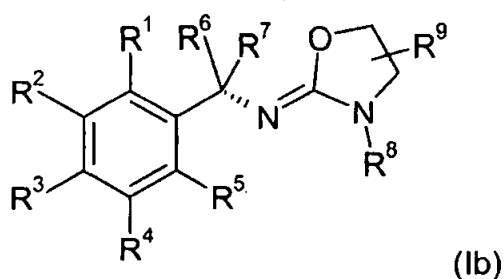
Wiley 2001 página 139).

Los compuestos cuya rotación está limitada pueden presentar isomería cis-trans. Un tipo de isomería cis-trans resulta de los dobles enlaces, tales como el doble enlace N=oxazolidina. Basándose en el sistema de Cahn-Ingold-Prelog, clasificando los grupos en cada átomo del doble enlace en orden de número atómico decreciente, los compuestos según la invención pueden estar presentes en la forma Z o E, siendo Z el isómero con los grupos de clasificación más altos sobre el mismo lado del doble enlace (véase March's Advanced Organic Chemistry 5ª edición; Wiley 2001 página 157-158).



10

La fórmula (I) de la presente invención comprende tanto los enantiómeros R y S puros como las mezclas de enantiómeros o racematos. Se prefieren compuestos de fórmula (Ib)



15 en la que R¹ a R⁹ son como se definen anteriormente para la fórmula (I).

Dependiendo de los sustituyentes R^1 a R^7 reales, el átomo de C asimétrico puede estar presente en la configuración R o S.

No hay divulgación o sugerencia en el documento WO 2006/127426 de las estructuras de los compuestos novedosos de fórmula (I) de la presente
5 invención. En particular, no hay divulgación o sugerencia en el documento WO 2006/127426 de la actividad insecticida sorprendente y significativamente mejorada de los compuestos de fórmula (Ib) respecto a sus antipodas ópticas o los racematos, respectivamente.

Como se usa en el presente documento, la "antípoda óptica" de un
10 enantiómero S se define como el enantiómero R correspondiente que sólo se diferencia en la configuración del átomo de C asimétrico y gira el plano de luz polarizada en la dirección opuesta. Por consiguiente, la antípoda óptica de un enantiómero R es el correspondiente enantiómero S.

La fórmula (I) proporciona una definición general de los compuestos
15 según la invención.

Los sustituyentes o intervalos preferidos de los radicales facilitados en las fórmulas mencionadas anteriormente y a continuación se ilustran a continuación.

Según una realización adicionalmente preferida de la invención,
20 R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 de fórmula (I) independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, preferentemente cloro o flúor, hidroxilo, alquilo C_1 - C_4 , preferentemente alquilo C_1 - C_2 , alcoxi C_1 - C_4 , preferentemente alcoxi C_1 - C_2 , haloalquilo C_1 - C_4 , preferentemente haloalquilo C_1 - C_2 , alcoxi (C_1 - C_4)-alquilo (C_1 - C_4), preferentemente alcoxi (C_1 - C_2)-alquilo (C_1 - C_2),
25 cicloalquilo C_3 - C_8 , preferentemente cicloalquilo C_3 - C_6 , cianoalquilo (C_1 -

- C₄), preferentemente cianoalquilo (C₁-C₂), haloalcoxi (C₁-C₄),
 preferentemente haloalcoxi (C₁-C₂), alquiltio C₁-C₄, preferentemente
 alquiltio C₁-C₂, haloalquiltio (C₁-C₄), preferentemente haloalquiltio (C₁-
 C₂), alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, alquil
 5 C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, halogenoalquil
 (C₁-C₄)-sulfonilo, preferentemente halogenoalquil (C₁-C₂)-sulfonilo,
 halogenoalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, preferentemente halogenoalquil (C₁-
 C₂)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-
 carbonilo, acetilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-
 10 carbonilo, alquenil C₂-C₄-carbonilo, pentafluorosulfanilo, amino, mono y
 dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente mono y dialquil (C₁-C₂)-amino,
 cicloalquil C₃-C₈-amino, preferentemente cicloalquil C₃-C₆-amino,
 alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo (C₂-
 C₄), ciano o nitro, o representan independientemente entre sí arilo C₅-C₈,
 15 preferentemente arilo C₅-C₆, ariloxi C₅-C₈, preferentemente ariloxi C₅-C₆,
 o heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene
 uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, que están
 opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados
 de halógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo
 20 (C₁-C₄), preferentemente haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄,
 preferentemente alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi (C₁-C₄), preferentemente
 haloalcoxi (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-
 carbonilo, nitro y ciano;
 R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo C₁-
 25 C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₄, preferentemente

- haloalquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₈, preferentemente cicloalquilo C₃-C₆, alcoxí (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), preferentemente alcoxí (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alquil C₁-C₄-mercaptoalquilo (C₁-C₄), preferentemente alquil C₁-C₂-mercaptoalquilo (C₁-C₂), alqueno C₂-C₄ o alquino C₂-C₄, o representan
 5 independientemente entre sí arilo C₅-C₈, preferentemente arilo C₅-C₆, heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o heterociclilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, opcionalmente sustituidos
 10 con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, alcoxí C₁-C₄, preferentemente alcoxí C₁-C₂, nitró y ciano;
- R⁸ representa -C(Z)R¹⁰, -C(Z)OR¹⁰ o -C(Z)NR¹¹R¹²;
- Z representa O o S;
- 15 R⁹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, o haloalquilo C₁-C₄, preferentemente haloalquilo C₁-C₂;
- R¹⁰ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxí C₁-C₄, preferentemente alcoxí C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, y ciano, o
 20 representa alquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o bencilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno y alcoxí C₁-C₄, preferentemente alcoxí C₁-C₂;
- R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxí C₁-C₄, preferentemente alcoxí C₁-C₂,
 25 alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alcoxí C₁-

C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, y ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo C₂-C₄,
5 o alquinilo C₂-C₄, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo,
10 preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo y dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, o representa aril C₅-C₈-alquilo (C₁-C₄), preferentemente aril C₅-C₆-alquilo (C₁-C₂), heterociclilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, heterociclilalquilo (C₁-C₄),
15 preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, arilo C₅-C₈, heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o heteroarilalquilo (C₁-C₄),
20 preferentemente heteroarilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heteroarilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente

25

- alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente halogenoalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, halogenoalcoxi (C₁-C₄), preferentemente halogenoalcoxi (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, heterociclilo que comprende un
- 5 anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, ciano, nitro, dialquil (C₁-C₄)amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, S(O)_n-alquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-alquilo (C₁-C₂) y S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₂);
- 10 R¹² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₈, preferentemente cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂,
- 15 alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, ciano, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo y dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, o representa aril C₅-C₈-alquilo (C₁-C₄), heterociclilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de
- 20 O, N, P y S, arilo C₅-C₈, o heteroarilo que comprende un anillo de 5-8
- 25 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de

O, N, P y S, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente halogenoalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, halogenoalcoxi (C₁-C₄),
 5 preferentemente halogenoalcoxi (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, ciano, nitro, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, S(O)_n-alquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-alquilo (C₁-C₂), y S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₂); y
 10 n es 0, 1 ó 2

Adicionalmente se prefieren compuestos de fórmula (Ib) en la que R¹ a R⁹ son como se definen anteriormente para la realización preferida de fórmula (I) y el grupo especial de la misma.

15 Como se usa en el presente documento,
 “alquilo” se define como un alquilo C₁₋₁₂ lineal o ramificado tal como, por ejemplo, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo y similares, preferentemente, un alquilo C₁₋₆, más preferentemente, un alquilo C₁₋₄.
 20 “alquenilo” se define como un alquenilo C₂₋₁₂ lineal o ramificado que comprende al menos un doble enlace tal como, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butanodienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-pentanodienilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1,4-hexanodienilo y similares,
 25 preferentemente, un alquenilo C₂₋₆, más preferentemente un alquenilo C₂₋₄.

“alquinilo” se define como un alquinilo C₂₋₁₂ que comprende al menos un triple enlace y que opcionalmente comprende además uno o más dobles enlaces tales como, por ejemplo, etinilo, 1-propinilo, propargilo y similares, preferentemente, un alquinilo C₂₋₆, más preferentemente un alquinilo C₂₋₄.

5 Las mismas partes que se describen en el “alquilo” anteriormente mencionado se ejemplifican como cada parte de alquilo en “alcoxi”, “haloalquilo”, “alcoxialquilo”, “alquilaminocarbonilo”, “dialquilaminoalquilo”, “haloalcoxi”, “alcoxycarbonilo”, “alcoxycarbonilo” y “alcoxycarbonilalquilo” y similares.

10 “cicloalquilo” se define como un cicloalquilo C₃₋₈ tal como, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y similares, preferentemente, un cicloalquilo C₃₋₆.

“heterocicloalquilo” (= “heterociclilo”) se define como un cicloalquilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más
15 heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, tales como tetrahydrofurano, tiolano, pirrolidino, oxatolano, oxazolidino, tetrahidropurano, piperidina, oxetano, tetrahidrotiofendióxido, dioxano y similares, se prefiere tetrahydrofurano.

“arilo” se define como un cicloalquilo C_{5-C12} insaturado, tal como fenilo, α o β-naftilo, preferentemente fenilo.
20

“heteroarilo” se define como un arilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, tales como furano, tiofeno, pirrol, oxazol, tiazol, pirazol, piridina, pirimidina, pirazol y similares, se prefieren pirimidina y pirazol.

25 “aralquilo” se define como, por ejemplo, bencilo, fenetilo o α-metilbencilo,

preferentemente bencilo,

"halógeno" se define como flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor o cloro.

Las mismas partes que se describen anteriormente se ejemplifican como
 5 cada parte de halógeno en "haloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio",
 "halogenoalquilsulfonilo", "halogenoalquilsulfoniloxi", "haloalquenilo",
 "haloalquinilo" y similares.

Según una realización particularmente preferida,

10 R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 de fórmula (I) independientemente entre sí representan
 hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, alcoxialquilo,
 cicloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo,
 alquilsulfoniloxi, halogenoalquilsulfonilo, alcoxycarbonilo, acetilo,
 alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, dialquilamino, cicloalquilamino,
 alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, ciano o nitro;

15 R^6 y R^7 independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo,
 haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alquilmercaptoalquilo, alquenilo o
 alquinilo, o independientemente entre sí representan arilo,
 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de
 halógeno, alquilo, alcoxi, nitro y ciano;

20 R^8 representa $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z representa O o S;

R^9 representa hidrógeno o alquilo;

R^{11} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes
 seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmercapto, alcoxycarbonilo,
 25 alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y ciano, o representa alquilo C_3-C_8 ,

- cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenilo o alquinilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquilmercapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcoxicarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa
- 5 arilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, heteroarilo, o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxicarbonilo, heterociclilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halogenoalquilo;
- 10 R^{12} representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmercapto, ciano, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcoxicarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilalquilo, arilo o heteroarilo, opcionalmente
- 15 sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxicarbonilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halogenoalquilo;
- n es 0, 1 ó 2
- 20 Según un grupo especial de compuestos de la realización particularmente preferida definida anteriormente,
- R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 de fórmula (I) independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, preferentemente cloro o flúor, alquilo C_1-C_4 , preferentemente alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_4 , preferentemente alcoxi C_1-
- 25 C_2 , haloalquilo C_1-C_4 , preferentemente haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi $(C_1-C_4)-$

- alquilo (C₁-C₄), preferentemente alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), cicloalquilo C₃-C₈, preferentemente cicloalquilo C₃-C₆, haloalcoxi (C₁-C₄), preferentemente haloalcoxi (C₁-C₂), alquiltio C₁-C₄, preferentemente alquiltio C₁-C₂, haloalquiltio (C₁-C₄), preferentemente haloalquiltio (C₁-C₂), alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, halogenoalquil (C₁-C₄)-sulfonilo, preferentemente halogenoalquil (C₁-C₂)-sulfonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, acetilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-carbonilo, alquenil C₂-C₄-carbonilo, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, cicloalquil C₃-C₈-amino, preferentemente cicloalquil C₃-C₆-amino, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo (C₂-C₄), ciano o nitro;
- R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₄, preferentemente haloalquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₈, preferentemente cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), preferentemente alcoxi (C₁-C₂)-alquilo (C₁-C₂), alquil C₁-C₄-mercaptoalquilo (C₁-C₄), preferentemente alquil C₁-C₂-mercaptoalquilo (C₁-C₂), alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, o representan independientemente entre sí arilo C₅-C₈, preferentemente arilo C₅-C₆, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, preferentemente cloro o flúor, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, nitro y ciano;
- R⁸ representa -C(Z)NR¹¹R¹²;
- Z representa O o S;

- R⁹ representa hidrógeno, o alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂;
- R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, y ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, y dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, o representa aril C₅-C₈-alquilo (C₁-C₄), preferentemente aril C₅-C₆-alquilo (C₁-C₂), heterociclilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, heterociclilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, arilo C₅-C₈, heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o

- heteroarilalquilo (C_1-C_4), preferentemente heteroarilalquilo (C_1-C_2), comprendiendo el heteroarilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados
- 5 de halógeno, alquilo C_1-C_4 , preferentemente alquilo C_1-C_2 , halogenoalquilo (C_1-C_4), preferentemente halogenoalquilo (C_1-C_2), alcoxi C_1-C_4 , preferentemente alcoxi C_1-C_2 , halogenoalcoxi (C_1-C_4), preferentemente halogenoalcoxi (C_1-C_2), alcoxi C_1-C_4 -carbonilo, preferentemente alcoxi C_1-C_2 -carbonilo, heterociclilo que comprende un
- 10 anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, dialquil (C_1-C_4)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C_1-C_2)-aminocarbonilo, ciano, nitro, dialquil (C_1-C_4)-amino, preferentemente dialquil (C_1-C_2)-amino, $S(O)_n$ -alquilo (C_1-C_4), preferentemente $S(O)_n$ -alquilo (C_1-C_2) y $S(O)_n$ -halogenoalquilo (C_1-C_4), preferentemente $S(O)_n$ -halogenoalquilo (C_1-C_2);
- 15 R^{12} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , preferentemente alquilo C_1-C_2 , cicloalquilo C_3-C_8 , preferentemente cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi C_1-C_4 , preferentemente alcoxi C_1-C_2 ,
- 20 alquil C_1-C_4 -mercapto, preferentemente alquil C_1-C_2 -mercapto, ciano, alquil C_1-C_4 -sulfinilo, preferentemente alquil C_1-C_2 -sulfinilo, alquil C_1-C_4 -sulfonilo, preferentemente alquil C_1-C_2 -sulfonilo, dialquil (C_1-C_4)-amino, preferentemente dialquil (C_1-C_2)-amino, alcoxi C_1-C_4 -carbonilo, preferentemente alcoxi C_1-C_2 -carbonilo y dialquil (C_1-C_4)-aminocarbonilo,
- 25 preferentemente dialquil (C_1-C_2)-aminocarbonilo, o representa aril C_5-C_8 -

alquilo (C₁-C₄), heterociclilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, arilo C₅-C₈, heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente halogenoalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, halogenoalcoxi (C₁-C₄), preferentemente halogenoalcoxi (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, dialquil (C₁-C₄)-aminocarbonilo, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-aminocarbonilo, ciano, nitro, dialquil (C₁-C₄)-amino, preferentemente dialquil (C₁-C₂)-amino, S(O)_n-alquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-alquilo (C₁-C₂), y S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₄), preferentemente S(O)_n-halogenoalquilo (C₁-C₂); y

n es 0, 1 ó 2

Adicionalmente preferidos son compuestos de fórmula (Ib) en la que R¹ a R⁹ son como se definen anteriormente para la realización particularmente preferida de fórmula (I) y el grupo especial de la misma.

Según una realización muy particularmente preferida de la invención, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ de fórmula (I) independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo; o haloalcoxi; R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo o haloalquilo;

R⁸ representa -C(S)NR¹¹R¹²;

- R⁹ representa hidrógeno;
- R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquiltercapto, alcoxycarbonilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o alquenoilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquiltercapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y alcoxycarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxycarbonilo y heterociclilo;
- R¹² representa hidrógeno;
- Según un grupo especial de compuestos de la realización muy particularmente preferida definida anteriormente,
- 15 R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ de fórmula (I) independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, preferentemente cloro o flúor, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₄, preferentemente haloalquilo C₁-C₂; haloalcoxi C₁-C₄, preferentemente haloalcoxi C₁-C₂;
- 20 R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₄, preferentemente haloalquilo C₁-C₂;
- R⁸ representa -C(S)NR¹¹R¹²;
- R⁹ representa hidrógeno;
- 25 R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes

- seleccionados de halógeno, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, y ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo C₂-C₄, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, o representa heterociclilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, heterociclilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o arilo C₅-C₈; heteroarilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o heteroarilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heteroarilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heteroarilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, y
- R¹² representa hidrógeno.
- Adicionalmente preferidos son compuestos de fórmula (Ib) en la que R¹

a R^9 son como se definen anteriormente para la realización muy particularmente preferida de fórmula (I) y el grupo especial de la misma.

Según la realización más preferida de la invención,

- R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 de fórmula (I) independientemente entre sí representan
- 5 hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo o haloalcoxi;
- R^6 representa alquilo;
- R^7 representa hidrógeno;
- R^8 representa $-C(S)NR^{11}R^{12}$;
- R^9 representa hidrógeno;
- 10 R^{11} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmecapto, alcóxicarbonilo, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo o ciano, o representa alquilo C_3-C_8 , cicloalquilo, cicloalquilalquilo o alquénilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi,
- 15 alquilmecapto, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo y alcóxicarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcóxicarbonilo y heterociclilo; y
- 20 R^{12} representa hidrógeno.

Según un grupo especial de compuestos de la realización más preferida definida anteriormente,

- R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 de fórmula (I) independientemente entre sí representan
- hidrógeno, halógeno, preferentemente cloro o flúor, alquilo C_1-C_4 ,
- 25 preferentemente alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_4 , preferentemente alcoxi C_1-

- C₂, haloalquilo C₁-C₄, preferentemente haloalquilo C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₄, preferentemente haloalcoxi C₁-C₂;
- R⁶ representa alquilo C₁-C₄, preferentemente alquilo C₁-C₂,
- R⁷ representa hidrógeno;
- 5 R⁸ representa -C(S)NR¹¹R¹²;
- R⁹ representa hidrógeno;
- R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, y ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil (C₃-C₆)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo C₂-C₄, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados
- 10 de halógeno, haloalquilo (C₁-C₄), preferentemente haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi C₁-C₄, preferentemente alcoxi C₁-C₂, alquil C₁-C₄-mercapto, preferentemente alquil C₁-C₂-mercapto, alquil C₁-C₄-sulfinilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, preferentemente alquil C₁-C₂-sulfonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo,
- 15 preferentemente alcoxi C₁-C₂-carbonilo, o representa heterociclilo que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, heterociclilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heterociclilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heterociclilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más
- 20 heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o arilo C₅-C₈; heteroarilo
- 25

que comprende un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, o heteroarilalquilo (C₁-C₄), preferentemente heteroarilalquilo (C₁-C₂), comprendiendo el heteroarilo un anillo de 5-8 miembros que contiene uno, dos o más heteroátomos seleccionados de O, N, P y S, y

5 R¹² representa hidrógeno.

Adicionalmente preferidos son compuestos de fórmula (Ib) en la que R¹ a R⁹ son como se definen anteriormente para la realización más preferida de fórmula (I) y el grupo especial de la misma. Todos los compuestos de fórmula

10 (Ib) en la que R¹ a R⁹ son como se definen anteriormente para la realización más preferida de fórmula (I) y el grupo especial de la misma están presentes en la configuración S.

Las definiciones o explicaciones de radicales generales o preferidas facilitadas anteriormente se aplican tanto a los productos finales como

15 correspondientemente a los precursores y productos intermedios. Estas definiciones de radicales pueden combinarse entre sí según se desee, es decir, incluyendo combinaciones entre los intervalos preferidos respectivos.

Se da preferencia según la invención a compuestos de fórmula (I) o (Ib) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente

20 como preferidos.

Se da particular preferencia según la invención a compuestos de fórmula (I) o (Ib) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como particularmente preferidos.

Se da preferencia muy particular según la invención a compuestos de

25 fórmula (I) o (Ib) que contienen una combinación de los significados

enumerados anteriormente como muy particularmente preferidos.

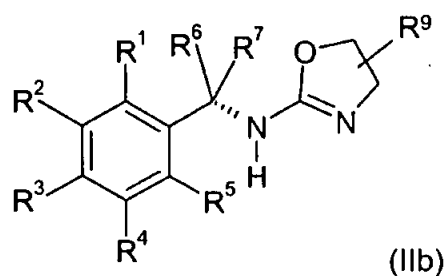
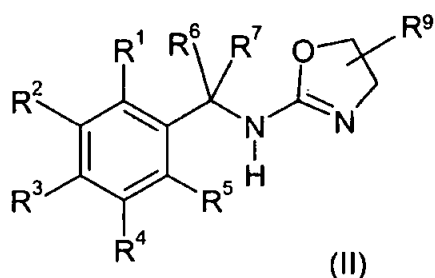
Se da mayor preferencia según la invención a compuestos de fórmula (I) o (Ib) que contienen una combinación de los significados enumerados anteriormente como los más preferidos.

5 La presente invención se refiere además a una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o (Ib) como se define en cualquier realización anterior y las sustancias de relleno y/o tensioactivos habituales. Las sustancias de relleno y los tensioactivos habituales se definen más adelante.

10 La presente invención también se refiere a un procedimiento para controlar plagas en el que un compuesto de fórmula (I) o (Ib) como se define en cualquier realización anterior o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o (Ib) como se define en cualquier realización anterior y sustancias de relleno y/o tensioactivos habituales se dejan actuar sobre las
15 plagas y/o su hábitat.

Además, la presente invención se refiere al uso de los compuestos de fórmula (I) o (Ib) como se define en cualquier realización anterior o de composiciones que comprenden al menos un compuesto de fórmula (I) o (Ib) como se define en cualquier realización anterior y sustancias de relleno y/o
20 tensioactivos habituales para controlar plagas.

Los novedosos compuestos sustituidos de fórmula (I) o (Ib) en las que R^8 es $-C(S)NR^{11}R^{12}$ y R^{12} es hidrógeno se obtienen cuando un compuesto de fórmula (II) o (IIb)



en las que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ y R^9 son como se definen anteriormente

se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III)



en la que

R^{11} es como se define anteriormente,

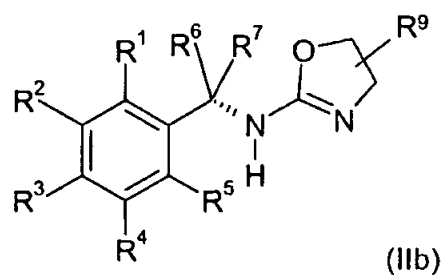
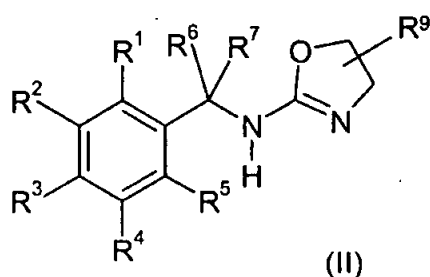
y N,N-diisopropiletilamina en un disolvente aprótico tal como diclorometano, cloroformo, acetonitrilo, dimetilformamida, tetrahidrofurano o acetato de etilo a

10 temperaturas de -20 a 120°C , preferentemente $20\text{-}60^\circ\text{C}$, dependiendo del disolvente. Los tiempos de reacción son $0,5$ a 20 h, las relaciones de los productos de partida son compuesto de fórmula II : compuesto de fórmula III de $1 : 1$ a $1 : 1,5$, preferentemente $1 : 1$ (procedimiento 1).

Además, se ha encontrado que los novedosos compuestos sustituidos de fórmula (I) o (Ib) en las que R^8 es $-\text{C}(\text{S})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ y R^{12} es hidrógeno también

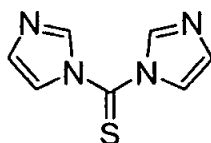
15 puede obtenerse cuando

un compuesto de fórmula (II) o (IIb)



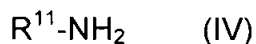
en las que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ y R^9 son como se definen anteriormente
se hace reaccionar con tiocarbonildiimidazol



5

y un compuesto de fórmula (IV)



en la que

R^{11} es como se define anteriormente,

- 10 en un disolvente aprótico tal como diclorometano, cloroformo, acetonitrilo, dimetilformamida, tetrahidrofurano o acetato de etilo a temperaturas de -20 a $120^\circ C$, preferentemente $0-40^\circ C$, dependiendo del disolvente. Los tiempos de reacción son 1 a 20 h, las relaciones de los productos de partida son compuesto de fórmula II : tiocarbonildiimidazol : compuesto de fórmula III de 1 : 1 : 1 a 1 : 2 : 2, preferentemente 1 : 1,1 : 1,1 (procedimiento 2).
- 15

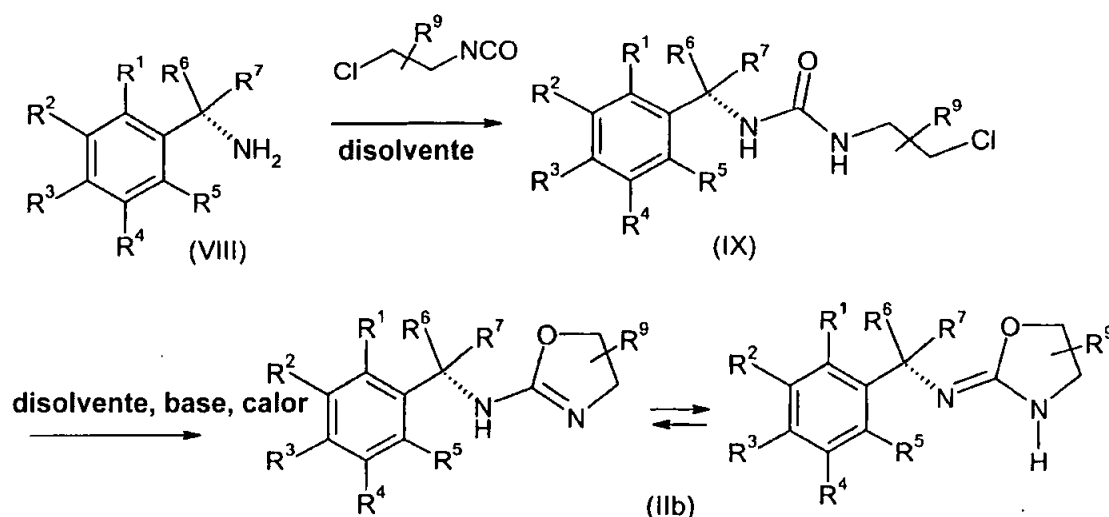
Este procedimiento se prefiere si un isotiocianato de una amina no está comercialmente disponible (por ejemplo, aminoacetonitrilo) y permite el uso de la propia amina correspondiente para acortar la ruta de síntesis.

En general, la síntesis de tioureas haciendo reaccionar aminas con tiocarbonildiimidazol se conoce en la técnica (véase, por ejemplo, el documento WO 2005/007601, páginas 50-52). Sin embargo, la síntesis de 2-(imino)-1,3-oxazolidin-3-carbotioamidas haciendo reaccionar una oxazolidina con tiocarbonildiimidazol y una amina primaria o secundaria no se ha descrito anteriormente. Sorprendentemente se encontró que esta reacción de una oxazolidina con tiocarbonildiimidazol y una amina primaria o secundaria es factible. En vista de la baja basicidad de las oxazolidinas, esto era inesperado para un experto en la materia.

Las aminas (IV), el tiocarbonildiimidazol y los isotiocianatos (III) son generalmente conocidos y están comercialmente disponibles.

Los compuestos de fórmulas generales (II) y (IIb) pueden obtenerse análogamente mediante procedimientos conocidos de la bibliografía (por ejemplo, el documento WO2006/127426).

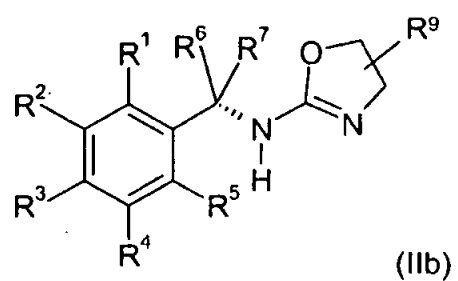
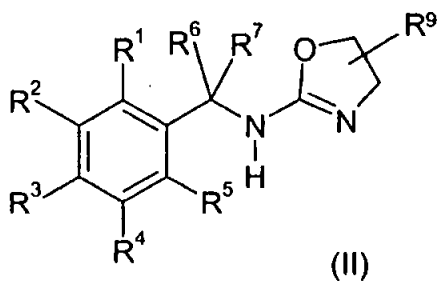
Esquema 1



Como se representa en el esquema 1, la reacción de una bencilamina

apropiadamente sustituida y un 2-cloroetilisocianato apropiadamente sustituido (por ejemplo, en 1,4-dioxano o diclorometano) dio la 1-bencil-3-(2-cloroetil)urea apropiadamente sustituida, que después de calentarse con una base (por ejemplo, NaOH, H₂O, 1,4-dioxano o diaza(1,3)biciclo[5.4.0]undecano (DBU), acetoniitrilo) dio la bencil-1,3-oxazinilamina apropiadamente sustituida (IIb), o (II) si (VIII) es una mezcla racémica de bencilaminas apropiadamente sustituidas. Estos procedimientos son generalmente conocidos para aquellos expertos en la materia (documento WO 2006/127426, páginas 22, 26; documento WO2005/063724, página 56, y bibliografía citada en ellos)

- 10 Los novedosos compuestos sustituidos de fórmula (I) o (Ib) en las que
 R^8 es $-C(O)R^{10}$ o $-C(O)OR^{10}$ y
 R^{12} es hidrógeno se obtienen cuando
 un compuesto de fórmula (II) o (IIb)

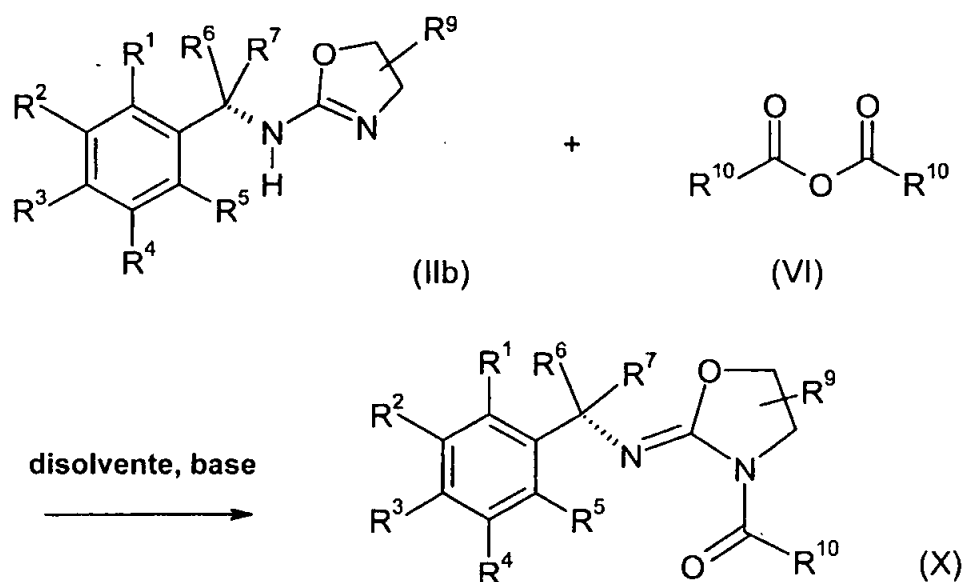


- 15 y un compuesto de fórmula (V)
 $X-C(O)R^{10}$ o $X-C(O)OR^{10}$ (V)
 en las que R^{10} y R^{11} son como se definen anteriormente y X es un grupo saliente como halógeno
 o un compuesto de fórmula (VI)
 20 $O(-C(O)R^{10})_2$ (VI)

se hacen reaccionar en condiciones básicas en un disolvente aprótico.

Estas reacciones son generalmente conocidas para un experto en la materia. (Véase el documento WO 2006/127426, página 23 y 32). Los compuestos de fórmula (VI) son generalmente conocidos y están
5 comercialmente disponibles.

Esquema 2



Dentro de este tipo de reacción representada en el esquema 2 son útiles bases orgánicas, además de inorgánicas (por ejemplo, diisopropiletilamina, carbonato de potasio), se prefieren disolventes apróticos. Las temperaturas de
10 reacción están entre -20 a 40°C, y se prefiere de -5°C a 20°C.

Finalmente se ha encontrado que los compuestos novedosos de fórmula (I) y (IIb) tienen marcadas propiedades biológicas y son especialmente adecuados para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos y
15 nematodos que se encuentran en la agricultura, en bosques, en la protección

de productos almacenados y en la protección de materiales, y también en el sector de la higiene.

Según corresponda, los compuestos de fórmula (I) y (Ib) puede estar presentes en diferentes formas polimórficas o como una mezcla de diferentes formas polimórficas. Tanto los polimorfos puros como las mezclas polimórficas se proporcionan por la invención y pueden usarse según la invención.

Los compuestos activos según la invención, en combinación con buena tolerancia por parte de las plantas y toxicidad favorable para animales de sangre caliente y siendo bien tolerados por el medioambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, para mejorar la calidad del material recolectado y para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales, y en el sector de la higiene. Pueden emplearse preferentemente como productos fitosanitarios. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o algunos estadios de desarrollo. Las plagas anteriormente mencionadas incluyen:

Del orden de los anopluros (ftirápteros), por ejemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

De la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*,

Metatetranychus spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp.,
Phyllocoptruta oleivora, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp.,
Rhipicephalus spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*,
Stenotarsonemus spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates*
 5 *lycopersici*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*,
Adoretus spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium*
 10 *punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia*
spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp.,
Ceuthorhynchus spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp.,
Costelytra zealandica, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp.,
Diabrotica spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*,
 15 *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*,
Hypothenemus spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*,
Lissorhoptrus oryzophilus, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*,
Melolontha melolontha, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus*
xanthographus, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus*
 20 *surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon*
cochleariae, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes*
chrysocephala, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*,
Sitophilus spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp.,
Tenebrio molitor, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus*
 25 spp., *Zabrus* spp.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

- Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp.,
- 5 *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp.,
Cochliomyia spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp.,
Dacus oleae, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus*
spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia*
spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia*
10 *hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula*
paludosa, *Wohlfahrtia* spp.

De la clase de los gastrópodos, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria*
spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania*
spp., *Succinea* spp.

- 15 De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*,
Ancylostoma ceylanicum, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris*
lubricoides, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp.,
Chabertia spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus*
filaria, *Diphyllbothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus*
20 *granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp.,
Haemonchus spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa*
Loa, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp.,
Onchocerca volvulus, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp.,
Strongyloides fuelleborni, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia*
25 *saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella*

britovi, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Además, es posible controlar protozoos tales como *Eimeria*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma* 5 *quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, 15 *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., 20 *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, 25 *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya*

- spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*,
 5 *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp.,
 10 *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioxa* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

- 20 Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

- Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua*
 25 *reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp.,

- Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp.,
- 5 *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp.,
- 10 *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

- 15 Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigerella immaculata*.

- Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*,
- 20 *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

- Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus*
- 25 *dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus*

spp., *Meloidogyne spp.*, *Pratylenchus spp.*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus spp.*, *Trichodorus spp.*, *Tylenchorhynchus spp.*, *Tylenchulus spp.*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema spp.*

Según corresponda, los compuestos activos según la invención también
5 pueden usarse, en ciertas concentraciones o dosis de aplicación, como
herbicidas, compuestos protectores, reguladores del crecimiento o agentes
para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo
como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes
contra los viroides) o como agentes contra OTM (organismos de tipo
10 micoplasma) y OTR (organismos de tipo *Rickettsia*). Según corresponda,
también pueden emplearse como productos intermedios o precursores para la
síntesis de otros compuestos activos.

Los compuestos activos pueden convertirse en las formulaciones
habituales, tales como disoluciones, emulsiones, polvos humectables,
15 suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, polvos para espolvorear,
pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para difusión, concentrados
de suspensión-emulsión, materiales naturales impregnados con compuesto
activo, materiales sintéticos impregnados con compuesto activo, fertilizantes y
microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

20 Estas formulaciones se producen de una manera conocida, por ejemplo
mezclando los compuestos activos con sustancias de relleno, es decir,
disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, opcionalmente con el uso de
tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o formadores de
espuma. Las formulaciones se preparan en o bien plantas adecuadas o antes
25 de o durante la aplicación.

Son adecuadas para su uso como coadyuvantes sustancias que son adecuadas para conferir a los propios compuestos activos y/o a las preparaciones derivadas de los mismos (por ejemplo, caldos de pulverización, revestimientos de semillas) propiedades particulares tales como ciertas
5 propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas particulares. Los coadyuvantes típicos adecuados son: sustancias de relleno, disolventes y vehículos.

Las sustancias de relleno adecuadas son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y apolares, por ejemplo de las clases de los
10 hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, según corresponda, también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas sin sustituir y
15 sustituidas, amidas, lactamas (tales como *N*-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

Si la sustancia de relleno usada es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Esencialmente, los disolventes líquidos adecuados son: compuestos aromáticos tales como xileno,
20 tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona,
25 metiletilcetona, metilisobutylcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente

polares tales como dimetilsulfóxido, y también agua.

Los vehículos sólidos adecuados son:

por ejemplo, sales de amonio y minerales naturales pulverizados tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos pulverizados tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos; los vehículos sólidos adecuados para gránulos son: por ejemplo, rocas naturales trituradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, y también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y gránulos de material orgánico tales como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; los emulsionantes y/o espumantes adecuados son: por ejemplo, emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, por ejemplo éteres poliglicólicos de alquilarilo, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos y también hidrolizados de proteínas; los dispersantes adecuados son sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres de alcohol-POE y/o -POP, ésteres de ácido y/o POP-POE, éteres de alquilarilo y/o POP-POE, aductos grasos y/o de POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitano- o -azúcar, alquil o arilsulfatos, alquil o arilsulfonatos y alquil o arilfosfatos o los aductos de PO-éter correspondientes. Además, oligo o polímeros adecuados, por ejemplo los derivados de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de OE y/o OP solos o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. También es posible emplear lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas sin modificar y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos y sus aductos con formaldehído.

En las formulaciones pueden usarse agentes de pegajosidad tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o retículas, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico) y poli(acetato de vinilo), además de fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y
5 fosfolípidos sintéticos.

Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y tintes orgánicos, tales como tintes de alizarina, tintes azo y tintes de ftalocianina metálica, y micronutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

10 Otros aditivos posibles son perfumes, aceites minerales o vegetales opcionalmente modificados, ceras y nutrientes (incluyendo micronutrientes), tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

También pueden estar presentes estabilizadores, tales como estabilizadores de baja temperatura, conservantes, antioxidantes, agentes
15 protectores contra la luz u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

Las formulaciones comprenden generalmente entre el 0,01 y el 98% en peso de compuesto activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90%.

El compuesto activo según la invención puede usarse en sus
20 formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso, preparadas a partir de estas formulaciones, como una mezcla con otros compuestos activos, tales como insecticidas, atrayentes, agentes de esterilización, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias de regulación del crecimiento, herbicidas, compuestos protectores, fertilizantes o semioquímicos.

25 Los componentes de mezcla particularmente favorables son, por

ejemplo, los siguientes compuestos:

Fungicidas:

Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

- 5 benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralexil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico

Inhibidores de la mitosis y división celular

- benomilo, carbendazima, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida

- 10 Inhibidores del complejo I de la cadena respiratoria

diflumentorim

Inhibidores del complejo II de la cadena respiratoria

- boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida

- 15 Inhibidores del complejo III de la cadena respiratoria

- azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina

Desacopladores

- 20 dinocap, fluazinam

Inhibidores de la producción de ATP

acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y la biosíntesis de proteínas

- 25 andoprim, blasticidina-S, ciprodinil, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanil

Inhibidores de la transducción de señales

fenpiclonilo, fludioxonil, quinoxifeno

Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas

clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina

- 5 ampropilfos, amprofilfos de potasio, edifenfos, iprobenfos (IBP),
isoprothiolano, pirazofos

tolclofos-metil, bifenilo

yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol

- 10 fenhexamida,

azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol,
difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol,
fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis,
hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol,
15 penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol,
triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de
imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina,
pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,

aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf,

- 20 fenpropidin, espiroxamina,

naftifina, piributicarb, terbinafina

Inhibidores de la síntesis de la pared celular

bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas,
polioxorim, validamicina A

- 25 Inhibidores de la biosíntesis de melanina

capropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilona, triciclazol

Inductores de resistencia

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil

Multisitio

- 5 captafol, captan, clorotalonilo, sales de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Bordeaux, diclofluanida, ditianona, dodina, base sin dodina, ferbam, folpet, fluorfolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocadina, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre y preparados de azufre que
- 10 contienen poli(sulfuro de calcio), tiram, tolilfluanida, zineb, ziram

Mecanismo desconocido

- amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropirina, cufranab, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb,
- 15 diclomezina, diclorofeno, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolid, fluoroimid, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropil, octilinona, oxamocarb,
- 20 oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrin, quintozena, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclámida, zarilamid y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-*N*-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-*N*-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-
- 25 piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-

clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-
[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etiliden]-amino]-oxi]-metil]-fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona
(185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato
de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-
5 metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)-benzoacetato de metilo, 4-
cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-
N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-
[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-
trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-
10 1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N[(1R)-1,2-
dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-
bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-
il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-
{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-
15 benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-
benzamida, 2-[[[1-[3(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-
(metoxiimino)-N-metil-alfa-E-benzacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-
2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-
(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)-
20 ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-
imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-
imidazol-1-carbotioico, 2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-
il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida

Bactericidas:

25 bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel,

kasugamicina, octilinona, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)

5 carbamatos,

por ejemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfan, cloetocarb, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato

organofosfatos,

por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), bromofos-etilo, bromfenvinfos (-metilo), butatíofos, cadusafos, carbofenotion, cloretoxifos, 15 clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metilo/-etilo), coumafos, cianofenfos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilán, 20 fostiazato, heptenofos, yodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, O-salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paration (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metilo/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, 25 piridafention, piridation, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos,

temefos, terbufos, tetraclorovinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion

Moduladores de los canales de sodio / bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje

piretroides,

- 5 por ejemplo, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovapoctrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrina, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato,
- 10 etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, kadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina,
- 15 tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretrum)

DDT

oxadiazinas,

por ejemplo indoxacarb

- 20 semicarbazona,

por ejemplo metaflumizona (BAS3201)

Agonistas / antagonistas de receptores de acetilcolina

cloronicotinilos,

por ejemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram,

- 25 nitiazina, tiacloprid, imidacloprid, AKD-1022, tiametoxam

- nicotina, bensultap, cartap
- Moduladores de los receptores de acetilcolina
- Espinosinas,
- por ejemplo espinosad, espinetoram (XDE-175)
- 5 Antagonistas de canales de cloruro controlados por GABA
- organocloros,
- por ejemplo, canfecloro, clordano, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro
- fiproles,
- 10 por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, piriprol, vaniliprol
- Activadores de canales de cloruro
- mectinas,
- por ejemplo, abarmectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina
- 15 Miméticos de la hormona juvenil,
- por ejemplo, diofenolan, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno
- Agonistas / disruptores de la ecdisona
- diacilhidrazinas,
- 20 por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida
- Inhibidores de la biosíntesis de quitina
- benzoilureas,
- por ejemplo, bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron,
- 25 penfluron, teflubenzuron, triflumuron

- buprofezina
- ciromazina
- Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP
- diafentiuron
- 5 Compuestos de organoestaño,
- por ejemplo azociclotina, cihexatin, óxidos de fenbutatina
- Desacopladores de la fosforilación oxidativa que actúan interrumpiendo el
- gradiente de protones H
- pirroles,
- 10 por ejemplo clorfenapir
- dinitrofenoles,
- por ejemplo binapacril, dinobuton, dinocap, DNOC
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio I
- METI,
- 15 por ejemplo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben,
- tebufenpirad, tolfenpirad
- hidrametilnona
- dicofol
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio II
- 20 rotenona
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio III
- acequinocilo, fluacripirim
- Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos
- cepas de *Bacillus thuringiensis*
- 25 Inhibidores de la síntesis de lípidos

- ácidos tetrónicos,
 por ejemplo, espiroclorfenol, espiromesifeno
 ácidos tetrámicos,
 por ejemplo spiroclorfenol
- 5 carboxamidas,
 por ejemplo flonicamida
 Agonistas octopaminérgicos,
 por ejemplo amitraz
 Inhibidores de la ATPasa estimulada con magnesio,
- 10 propargita
 Análogos de la nereistoxina,
 por ejemplo hidrogenooxalato de tiociclam, tiosultap-sodio
 Agonistas de los receptores de rianodina
 dicarboxamidas de ácido benzoico
- 15 por ejemplo flubendiamida
 antranilamidas,
 por ejemplo rinaxipir (3-bromo-N-{4-cloro-2-metil-6-
 [(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida)
 Productos biológicos, hormonas o feromonas
- 20 azadiractina, *Bacillus spec*, *Beauveria spec*, codlemona, *Metarrhizium spec*, *Paecilomyces spec*, turingiensina, *Verticillium spec*.
 Compuestos activos con mecanismos de acción desconocidos o no
 específicos
- 25 fumigantes,
 por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo

antinutritivos,

por ejemplo criolita, flonicamida, pimetrozina

inhibidores del crecimiento de ácaros,

por ejemplo clofentezina, etoxazol, hexitiazox

- 5 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezin, quinometionato, clordimeform, clorobencilato, cloropicrina, clotiazoben, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanilo, flubenzimina, flufenimer, flutenzina, gossypure, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridililo, 10 sulfluramida, tetradifon, tetrasul, triaraten, verbutina.

También es posible una mezcla con otros compuestos activos conocidos, tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, compuestos protectores, semioquímicos, o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

- 15 Cuando se usan como insecticidas, los compuestos activos según la invención también pueden presentarse en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones como una mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos que aumentan la acción de los compuestos activos sin que sea necesario que el 20 agente sinérgico añadido sea por sí mismo activo.

- 25 Cuando se usan como insecticidas, los compuestos activos según la invención también pueden presentarse en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones como una mezcla con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo después de su uso en el entorno de la planta, sobre la superficie de

partes de plantas o en tejidos de plantas.

El contenido de compuesto activo de las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones comercialmente disponibles puede variar dentro de amplios límites. La concentración de compuesto activo de las formas de uso puede ser del
5 0,00000001 al 95% en peso de compuesto activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1% en peso.

Los compuestos activos se emplean de un modo habitual apropiado para las formas de uso.

Todas las plantas y partes vegetales pueden tratarse según la invención.
10 Plantas se entiende que significa en el presente contexto todas las plantas y poblaciones vegetales tales como plantas deseadas y silvestres no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo las plantas de cultivo que se producen naturalmente). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante
15 procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades vegetales que pueden protegerse o pueden no protegerse por los derechos de obtención vegetal. Partes vegetales se entiende que significa todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas
20 tales como brote, hoja, flor y raíz, siendo ejemplos que pueden mencionarse hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes vegetales también incluyen el material recolectado y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, acodos, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

25 El tratamiento según la invención de las plantas y partes vegetales con

los compuestos activos se lleva a cabo directamente o dejando que los compuestos actúen sobre el entorno, hábitat o local de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulizado, esparcido, recubrimiento, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también aplicando uno o más recubrimientos.

Los compuestos activos según la invención son particularmente adecuados para tratar semillas. Aquí pueden mencionarse como preferidos los compuestos activos según la invención mencionados anteriormente como preferidos o particularmente preferidos. Así, una gran parte del daño causado por las plagas a las plantas de cultivo se produce tan temprano como cuando la semilla es atacada durante el almacenamiento y después de que la semilla se introduzca en la tierra, durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es particularmente crítica ya que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso un pequeño daño puede conducir a la muerte de toda la planta. Por tanto, es de un interés particularmente grande proteger la semilla y la planta en germinación mediante el uso de compuestos activos adecuados.

El control de plagas mediante el tratamiento de las semillas de las plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de continuas mejoras. Sin embargo, el tratamiento de semillas conlleva una serie de problemas que no siempre pueden resolverse de modo satisfactorio. Por tanto, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta en germinación que prescindan de la aplicación adicional de agentes de protección de cosechas después de la siembra o después de la emergencia de las plantas.

Además, es deseable optimizar la cantidad de compuesto activo empleada, de tal forma que se proporcione máxima protección contra el ataque de plagas a la semilla y la planta en germinación, pero sin que el compuesto activo empleado dañe la propia planta. En particular, los procedimientos para el tratamiento de
5 semillas también deberán tener en cuenta las propiedades insecticidas intrínsecas de plantas transgénicas a fin de lograr una protección óptima de las semillas y la planta en germinación empleando un mínimo de agentes de protección de cosechas.

Por tanto, la presente invención también se refiere en particular a un
10 procedimiento para la protección de semillas y plantas en germinación del ataque de plagas tratando la semilla con un compuesto activo según la invención. La invención se refiere asimismo al uso de los compuestos activos según la invención para el tratamiento de semilla para proteger la semilla y la planta resultante de plagas. Además, la invención se refiere a semillas que han
15 sido tratadas con un compuesto activo según la invención para proporcionar protección contra plagas.

Una de las ventajas de la presente invención es que las propiedades sistémicas particulares de los compuestos activos según la invención significan que el tratamiento de la semilla con estos compuestos activos no sólo protege
20 de plagas la propia semilla, sino también las plantas resultantes después de la emergencia. De este modo puede prescindirse del tratamiento inmediato de la cosecha en el momento de la siembra o poco después de ella.

Además, debe considerarse como ventajoso que los compuestos activos según la invención también puedan emplearse en particular en semillas
25 transgénicas, pudiendo expresar las plantas que proceden de esta semilla una

proteína dirigida contra plagas. Tratando tal semilla con los compuestos activos según la invención, ciertas plagas pueden controlarse únicamente mediante la expresión de, por ejemplo, la proteína insecticida, y protegerse adicionalmente por los compuestos activos según la invención contra el daño.

5 Los compuestos activos según la invención son adecuados para proteger semillas de cualquier variedad de planta que se emplea en agricultura, según se ha citado anteriormente, en invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, éstas toman la forma de semillas de maíz, cacahuete, canola, colza oleaginosa, adormidera, soja, algodón, remolacha
10 (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), arroz, sorgo y mijo, trigo, cebada, avena, centeno, girasol, tabaco, patatas o verduras (por ejemplo, tomates, crucíferas). Los compuestos activos según la invención son igualmente adecuados para tratar las semillas de plantas frutales y verduras como ya se ha mencionado anteriormente. El tratamiento de las semillas de
15 maíz, soja, algodón, trigo y canola o colza oleaginosa es de particular importancia.

Como ya se ha mencionado anteriormente, también es de particular importancia el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto activo según la invención. Éstas toman la forma de semillas de plantas que
20 generalmente comprenden al menos un gen heterólogo que gobierna la expresión de un polipéptido con en particular propiedades insecticidas. En este contexto, los genes heterólogos en semilla transgénica pueden derivarse de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es
25 particularmente adecuada para el tratamiento de semilla transgénica que

comprende al menos un gen heterólogo originario de *Bacillus sp.* y cuyo producto génico muestra actividad contra el insecto perforador del maíz europeo y/o el gusano de la raíz del maíz. Es particularmente preferentemente un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

5 En el contexto de la presente invención, el compuesto activo según la invención se aplica a la semilla tanto solo como en una formulación adecuada. Preferiblemente, la semilla se trata en un estado que es suficientemente estable para evitar daños durante el tratamiento. En general, la semilla puede tratarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. La semilla
10 normalmente usada se ha separado de la planta y liberado de mazorcas, cáscaras, tallos, cubiertas, pelos, o la carne de las frutas.

 Cuando se trata la semilla, por lo general debe tenerse cuidado de que la cantidad de compuesto activo según la invención aplicada a la semilla y/o la cantidad de otros aditivos se elija de forma que la germinación de la semilla no
15 se vea afectada de forma desfavorable ni se dañe la planta resultante. Esto debe tenerse particularmente en cuenta en el caso de compuestos activos que puedan tener efectos fitotóxicos a ciertas tasas de aplicación.

 Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes según la invención. En una realización preferida se tratan
20 especies de plantas silvestres y variedades vegetales o aquéllas obtenidas mediante procedimientos convencionales de cultivo biológico, tales como cruce o fusión de protoplastos, así como las partes de las mismas. En una realización preferida adicional se tratan plantas transgénicas y variedades vegetales obtenidas mediante procedimientos de ingeniería genética, según corresponda,
25 en combinación con procedimientos convencionales (organismos

genéticamente modificados), y las partes de las mismas. Los términos “partes”, “partes de plantas” y “partes vegetales” se han explicado anteriormente.

Con particularmente preferencia, las plantas de las variedades vegetales que están comercialmente disponibles o en uso en cada caso se tratan según la invención. Variedades vegetales se entiende que significa plantas que tienen propiedades novedosas (“rasgos”) que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades, biotipos, o genotipos.

Dependiendo de las especies vegetales o variedades vegetales, su localización y condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, alimentación), el tratamiento según la invención también puede dar como resultado efectos (“sinérgicos”) sobreañadidos. Así son posibles, por ejemplo, tasas de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un aumento en la actividad de los compuestos activos y composiciones que pueden usarse según la invención, mejor crecimiento vegetal, aumento de la tolerancia a temperaturas altas o bajas, aumento de la tolerancia a la sequía o al contenido de agua o sales en el suelo, aumento del rendimiento de floración, recolección más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mejor estabilidad durante el almacenamiento y/o procesado de los productos recolectados, que superan los efectos que realmente se esperaban.

Las plantas o variedades vegetales transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) que van a tratarse preferentemente según la invención incluyen todas las plantas que, en virtud de la modificación genética, recibieron el material genético que confiere a estas plantas rasgos útiles particularmente

ventajosos. Ejemplos de tales rasgos son mejor crecimiento vegetal, aumento de la tolerancia a temperaturas altas o bajas, aumento de la tolerancia a la sequía o al contenido de agua o sales en el suelo, aumento del rendimiento de floración, recolección más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mejor estabilidad durante el almacenamiento y/o procesado de los productos recolectados. Otros ejemplos y ejemplos particularmente destacados de tales rasgos son una mejor fitoprotección contra plagas animales y microbianas tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también un aumento de la fitotolerancia a ciertos compuestos herbicidamente activos. Ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las plantas de cultivo importantes tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de verduras, algodón, tabaco, colza oleaginosa y también plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, cítricos y uvas) y destaca particularmente maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza oleaginosa. Los rasgos que destacan son en particular el aumento de la fitoprotección contra insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles en virtud de toxinas formadas en las plantas, en particular aquellas formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de los mismos) (denominadas en lo sucesivo "plantas Bt"). Los rasgos que también destacan particularmente son el aumento de la fitoprotección contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores y genes

de resistencia y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas. Los rasgos que destacan además particularmente son el aumento de la fitotolerancia a ciertos compuestos herbicidamente activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, el gen

5 "PAT"). Los genes que confieren los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Ejemplos de "plantas Bt" que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan bajo los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz,

10 algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patatas). Ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan bajo los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo,

15 maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo semilla de colza oleaginosa), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas cultivadas de una forma convencional para la tolerancia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen las variedades comercializadas

20 bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Evidentemente, estas afirmaciones también se aplican a variedades vegetales que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos que todavía van a desarrollarse cuyas variedades vegetales se desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas enumeradas pueden tratarse según la invención de una

25 forma especialmente ventajosa con los compuestos activos de fórmula I

general según la invención. Los intervalos preferidos establecidos anteriormente para los compuestos activos también se aplican al tratamiento de estas plantas. Se hace especial hincapié al tratamiento de plantas con los compuestos activos específicamente mencionados en el presente texto.

- 5 Los compuestos activos según la invención no sólo actúan contra plagas vegetales, higiénicas y de productos almacenados, sino también en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos animales (ecto y endoparásitos), tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros de las hojas, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, 10 piojos del cabello, piojos de las plumas y pulgas. Estos parásitos incluyen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*

- Del orden de los malófagos y los subórdenes ambliceros e ischnóceros, por ejemplo, *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, 15 *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*

- Del orden de los dípteros y los subórdenes nematóceros y braquíceros, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops* 20 *spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, 25 *Melophagus spp.*

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*

- 5 Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*

- De la subclase de los ácaros (acáridos) y los órdenes de los metastigmados y mesostigmados, por ejemplo, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor*
10 *spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*

- Del orden de los actinédidos (prostigmados) y acarídidos (astigmados), por ejemplo, *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*,
15 *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, *Laminosioptes spp.*

- Los compuestos activos de fórmula (I) según la invención también son adecuados para controlar artrópodos que infestan animales de producción
20 agrícola tales como, por ejemplo, ganado, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos y abejas, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves enjauladas y peces de acuario, y también los denominados animales de ensayo tales como, por ejemplo, hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Mediante el control de estos
25 artrópodos deben reducirse los casos de muerte y la reducción en la

productividad (de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) de manera que sea posible una cría de animales más económica y más fácil mediante el uso de los compuestos activos según la invención.

Los compuestos activos según la invención se usan en el sector veterinario y en la cría de animales de manera conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, rociados, gránulos, pastas, bolos, el procedimiento a través del alimento y supositorios, mediante administración parenteral tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, mediante administración nasal, mediante uso dérmico en forma de, por ejemplo, inmersión o baño, pulverización, aplicación epicutánea y aplicación transcutánea, lavado y empolvado, y también con la ayuda de artículos moldeados que contienen el compuesto activo, tales como collares, marcas para las orejas, marcas para la cola, bandas para las extremidades, bozales, dispositivos de marcación, y similares.

Cuando se usan para ganado, aves, animales domésticos y similares, los compuestos activos de fórmula (I) pueden usarse como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, composiciones de libre fluidez) que comprenden los compuestos activos en una cantidad del 1 al 80% en peso, directamente o después de una dilución de 100 a 10.000 veces, o pueden usarse como un baño químico.

Además, se ha encontrado que los compuestos activos según la invención también tienen una fuerte acción insecticida contra los insectos que destruyen materiales industriales.

Los siguientes insectos pueden mencionarse como ejemplos y como

preferidos, pero sin limitación:

Escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*,
 5 *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

himenópteros, tales como *Sirex juvenicus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus*
 10 *gigas taignus*, *Urocerus augur*;

termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;

15 tisanuros, tales como *Lepisma saccharina*.

Materiales industriales en el presente contexto debe entenderse que significa materiales no vivos tales como preferiblemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, piel, madera y productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento.

20 Las composiciones listas para el uso también pueden comprender, según corresponda, otros insecticidas y, según corresponda, uno o más fungicidas.

Con respecto a posibles aditivos adicionales puede hacerse referencia a los insecticidas y fungicidas anteriormente mencionados.

25 Asimismo, los compuestos activos según la invención pueden emplearse

para proteger de incrustaciones objetos que se ponen en contacto con agua de mar o agua salobre, tales como cascos, tamices, redes, edificios, sistemas de amarre y señalización.

Además, los compuestos activos según la invención pueden emplearse
5 solos o en combinación con otros compuestos activos como agentes antiincrustantes.

En la protección doméstica, higiénica y de productos almacenados, los compuestos activos también son adecuados para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en espacios
10 cerrados tales como, por ejemplo, viviendas, naves de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos y similares. Pueden emplearse solos o en combinación con otros compuestos activos y coadyuvantes en productos insecticidas domésticos para el control de estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todos los estadios de desarrollo. Estas plagas
15 incluyen:

Del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los acarinos, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*,
Bryobia ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula*
20 *autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Del orden de las araneas, por ejemplo, avicularias, araneidas.

Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*,
Pseudoscorpiones cheiridium, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio*
25 *scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus spp.*

Del orden de los zigentomos, por ejemplo, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma*
5 *saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Del orden de los blataros, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella*
germanica, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*,
Parcoblatta spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta*
brunnea, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

10 Del orden de los saltamontes, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterms spp.*, *Reticulitermes*
spp.

Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis*
15 *spp.*

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus spp.*, *Attagenus*
spp., *Dermestes spp.*, *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*,
Rhizopertha dominica, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus*
zeamais, *Stegobium paniceum*.

20 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*,
Aedes taeniorhynchus, *Anopheles spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma*
pluvialis, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila spp.*,
Fannia canicularis, *Musca domestica*, *Phlebotomus spp.*, *Sarcophaga carnaria*,
Simulium spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

25 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria*

mellonella, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

- 5 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

- Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus*
10 *pubis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- En el campo de los insecticidas domésticos, los compuestos activos según la invención se usan solos o en combinación con otros compuestos
15 activos adecuados tales como ésteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o compuestos activos de otras clases conocidas de insecticidas.

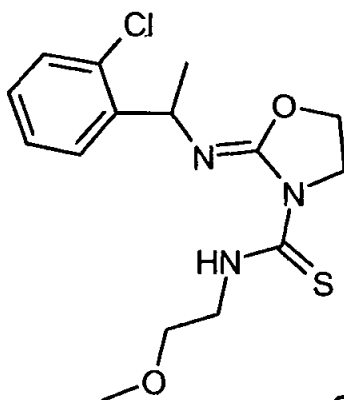
- Los compuestos activos según la invención se usan en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bomba y
20 atomizadores, sistemas de nebulización automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de evaporación con pastillas de evaporación hechas de celulosa o polímero, evaporadores de líquido, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados por propelentes, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles antipolillas, bolsas antipolillas y
25 geles antipolillas, como gránulos o polvos, en cebos para dispersión o en

estaciones de cebo.

Ejemplos de preparación:

Procedimiento 1

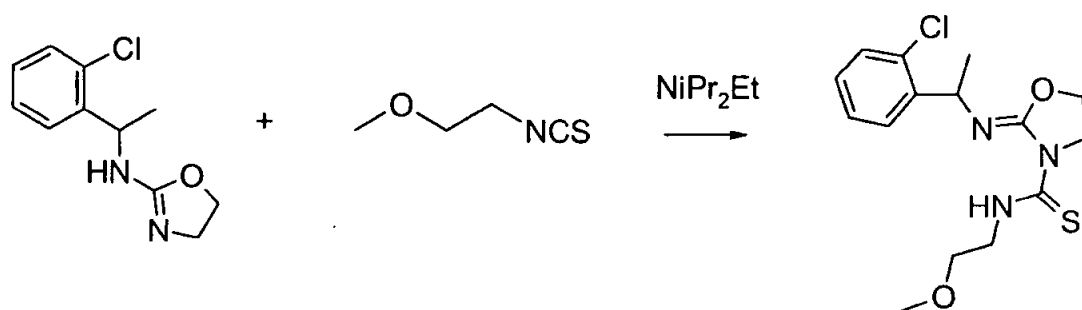
(2Z)-2-[[1-(2-clorofenil)etil]imino]-N-(2-metoxietil)-1,3-oxazolidin-3-carbotioamida



Compuesto (10)

Se cargaron inicialmente 400 mg (1,78 mmol) de N-[1-(2-clorofenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina en 10 ml de diclorometano con 209 mg (1,78 mmol) de metoxietilisotiocianato y posteriormente se añadieron gota a gota 214 mg (1,66 mmol) de N,N-diisopropiletilamina disueltos en 1 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó 15 h a 20°C y finalmente se evaporaron todos los componentes volátiles. La reacción dio 600 mg (99% del teórico) del compuesto 10. log p ácido 4,08, RMN ¹H (CDCl₃) q 5,24 ppm.

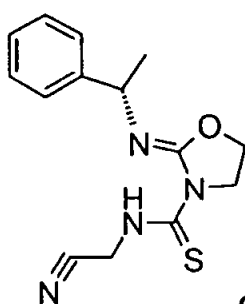
67



Este procedimiento puede emplearse análogamente para todos los compuestos de fórmula (I) en la que R^8 es $-C(S)NR^{11}R^{12}$ y R^{12} es hidrógeno. Si la oxazolamina está presente como compuesto quiral según la fórmula (IIb), este procedimiento puede emplearse análogamente para todos los compuestos de fórmula (Ib) en la que R^8 es $-C(S)NR^{11}R^{12}$ y R^{12} es hidrógeno.

Procedimiento 2

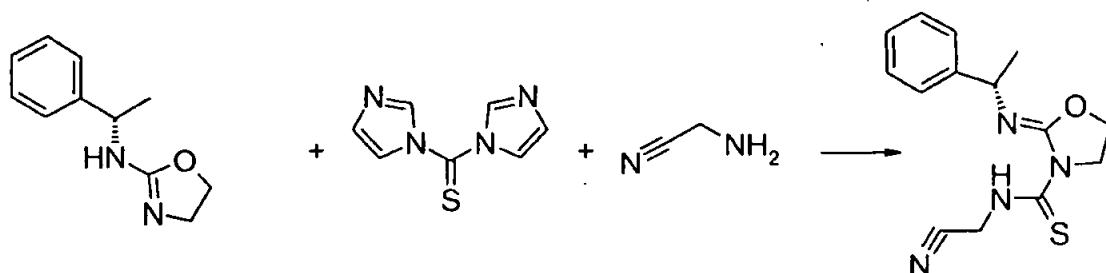
(2Z)-N-(cianometil)-2-[(1-feniletil)imino]-1,3-oxazolidin-3-carbotioamida



Compuesto (94*)

Se agitaron 200 mg (1,05 mmol) de N-[(1S)-1-feniletil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina y 206 mg (1,16 mmol) de tiocarbonildiimidazol en 40 ml diclorometano durante 1 ½ h a temperatura ambiente. Posteriormente se añadieron 65 mg (1,16 mmol) de aminoacetonitrilo y la mezcla se agitó adicionalmente durante 15 h a temperatura ambiente. Para el procesamiento se añadió agua, la fase orgánica se eliminó, se secó con sulfato de sodio, se filtró

y se eliminaron los disolventes. El producto obtenido se purificó por cromatografía en columna con diclorometano sobre óxido de aluminio y así se aislaron 50 mg (16% del teórico) del compuesto 94*. log p ácido 3,07, RMN ^1H (DMSO- d_6) δ 4,78 ppm.



5

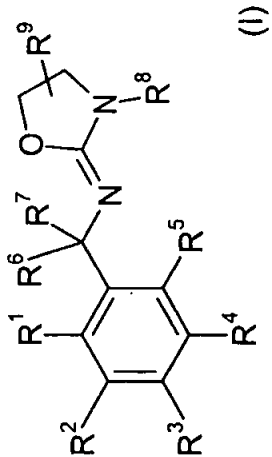
Este procedimiento puede emplearse análogamente para todos los compuestos de fórmula (Ib) en la que R^8 es $-\text{C}(\text{S})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ y R^{12} es hidrógeno o alquilo. Si la oxazolamina está presente como mezcla racémica según la fórmula (II), este procedimiento puede emplearse análogamente para todos los compuestos de fórmula (I) en la que R^8 es $-\text{C}(\text{S})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ y R^{12} es hidrógeno o alquilo.

10

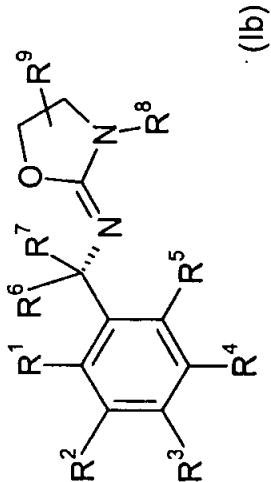
Otros compuestos de fórmula (I) y (Ib) se enumeran en la Tabla 1 a continuación.

Tabla 1

Compuestos de fórmula (I) o (Ib)



(I)



(Ib)

en las que R⁹ representa hidrógeno.

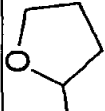
5 *: enantiómeros S

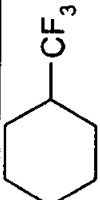
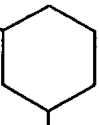
Datos físicos: RMN ¹H δ en CDCl₃ (A) o DMSO d₆ (B), o log P (ácido) (C)

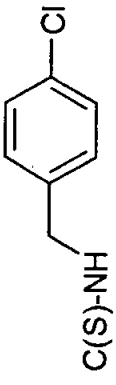
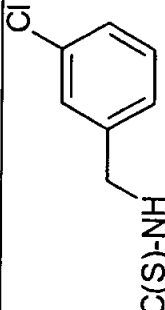
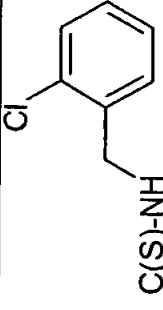
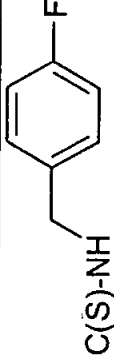
Abreviaturas: Me = metilo, Et = etilo, Pr = propilo, c-Pr = ciclopropilo, c-pentilo = ciclopentilo, Ph = fenilo, Bu = butilo

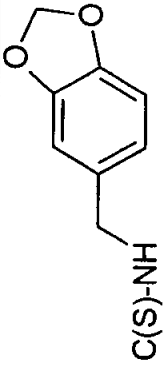
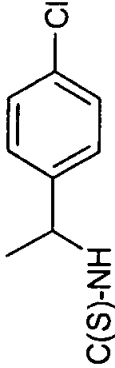
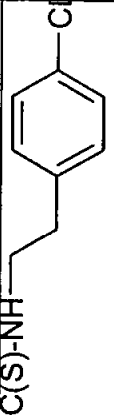
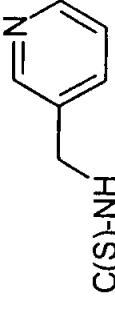
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
1	Me	F	H	H	H	H	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	3,72 m (A)
2*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	4,8 q (A)
3*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CF ₃	4,8 q (A)
4*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -S-Me	5,11 tr (A)
5*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ -S-Me	5,02 tr (B)
6	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	4,53 tr (B)
7	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CF ₃	4,6 m (B)
8	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	4,53 tr (B)
9	Cl	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	5,26 q (A)
10	Cl	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	5,24 q (A)
11	H	Cl	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	4,76 q (A)
12*	F	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ O-Me	5,13 q (A)

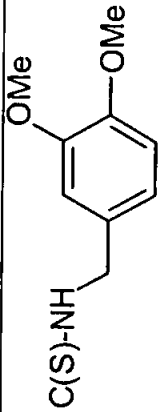
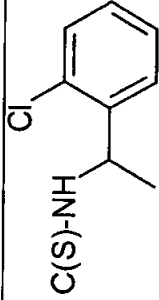
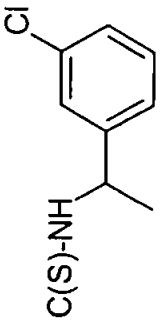
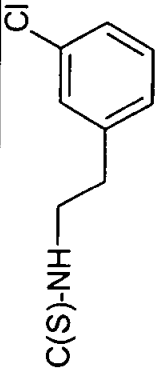
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
13*	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -COOEt	4,8 q (A)
14	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4,8 q (A)
15*	H	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4,8 q (A)
16*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH-(O-Me) ₂	3,42 (C)
17*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-n-C ₃ H ₇	4,77 (C)
18*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CHEt ₂	4,77 (C)
19*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	4,77 (C)
20*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -c-Pr	3,99 (C)
21*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	3,63 (C)
22*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-n-Pr	3,84 (C)
23*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-n-Bu	4,35 (C)
24*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CF ₃	4,51 (C)

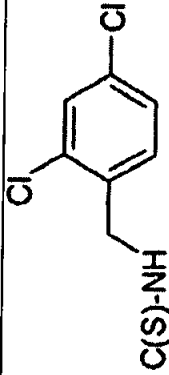
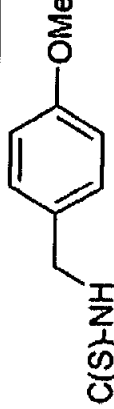
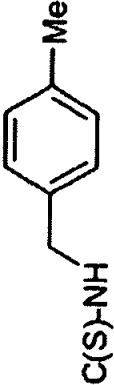
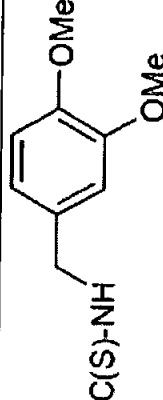
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
25*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	4,35 (C)
26*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -COOMe	3,15(C)
27*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ -COOEt	3,94 (C)
28*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -COOEt	3,58 (C)
29*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(i-Pr)-COOMe	4,25 (C)
30*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-COOEt	3,99 (C)
31*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(Et)-COOEt	3,94 (C)
32*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)NH-CH ₂ - 	3,58 (C)

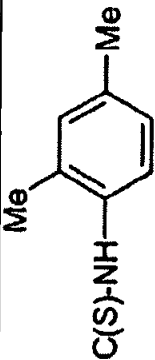
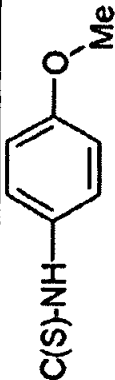
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
33*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-  -CF ₃	4,92 (C)
34*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-i-Pr	3,94 (C)
35*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-c-Pr	3,37 (C)
36*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-c-pentilo	4,56 (C)
37*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-  -CF ₃	5,03 (C)
38*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -Ph	4,30 (C)
39*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-Ph	4,67 (C)

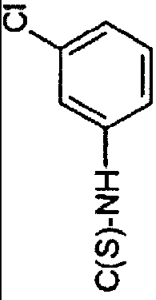
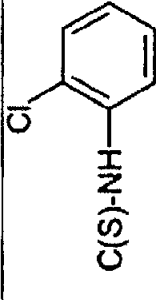
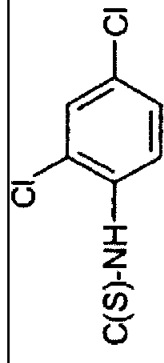
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
40*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,77 (C)
41*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,77 (C)
42*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,77 (C)
43*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,30 (C)

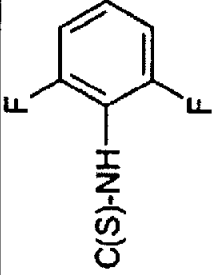
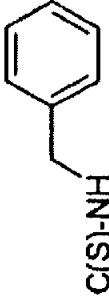
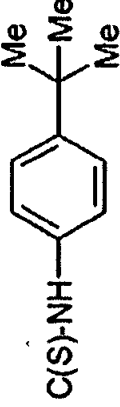
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
44*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	3,99 (C)
45*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	5,19(C)
46*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ -Ph	4,51 (C)
47*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,92 (C)
48*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	2,03 (C)

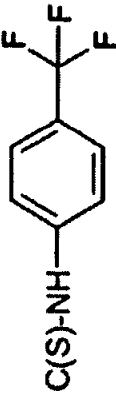
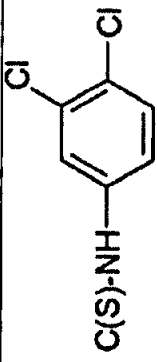
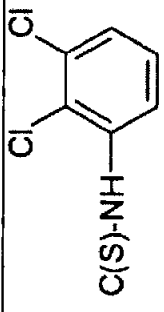
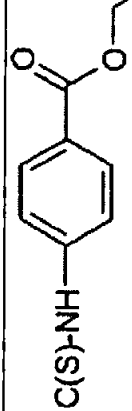
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
49*	H	H	H	H	H	Me	H		3,63 (C)
50*	H	H	H	H	H	Me	H		5,08 (C)
51*	H	H	H	H	H	Me	H		5,14(C)
52*	H	H	H	H	H	Me	H		4,92 (C)

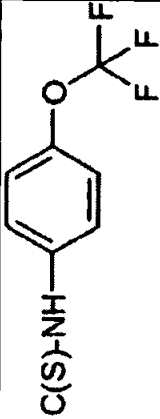
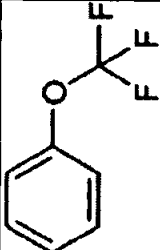
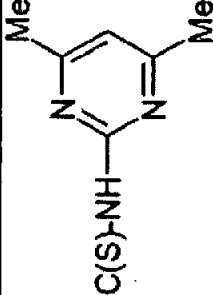
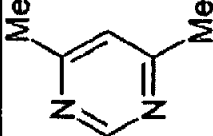
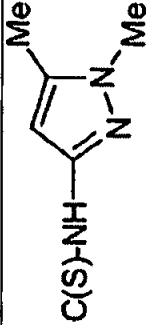
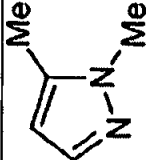
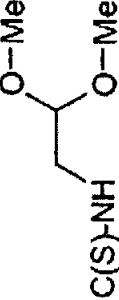
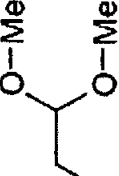
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
53*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	5,42 (C)
54*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,15 (C)
55*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	4,72 (C)
56*	H	H	H	H	H	Me	H	 C(S)-NH	3,78 (C)
57	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃) ₂	4,41 (C)

Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
58	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-c-Pr	3,85 (C)
59	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-t-Bu	5,08 (C)
60	H	H	H	H	H	Et	H		5,14(C)
61	H	H	H	H	H	Et	H		4,51 (C)
62	H	H	H	H	H	Et	H		5,4 (C)

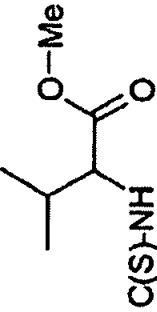
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
63	H	H	H	H	H	Et	H		5,4 (C)
64	H	H	H	H	H	Et	H		4,97 (C)
65	H	H	H	H	H	Et	H		5,78 (C)

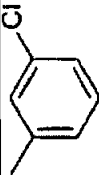
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
66	H	H	H	H	H	Et	H		4,41 (C)
67	H	H	H	H	H	Et	H		5,02 (C)
68	H	H	H	H	H	Et	H		4,68 (C)
69	H	H	H	H	H	Et	H		6,09 (C)

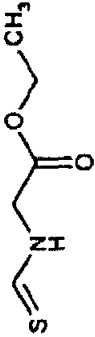
Comp. nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
70	H	H	H	H	H	Et	H		5,52 (C)
71	H	H	H	H	H	Et	H		6,03 (C)
72	H	H	H	H	H	Et	H		5,46 (C)
73	H	H	H	H	H	Et	H		5,21 (C)

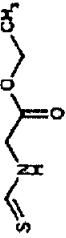
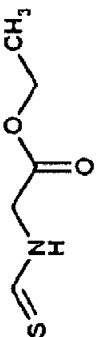
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
74	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH- 	5,59 (C)
75	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH- 	2,05 (C)
76	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH- 	3,85 (C)
77	H	H	H	H	H	Et	H	 C(S)-NH- 	3,89 (C)

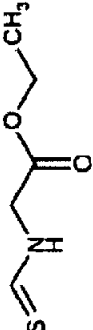
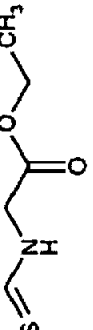
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
78	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)- CH ₂ CH ₂ CH ₃	5,31 (C)
79	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₂ CH ₃)- CH ₂ CH ₃	5,25 (C)
80	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)- CH ₃	5,25 (C)
81	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -c-Pr	4,51 (C)
82	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH(CH ₃)CH ₃	4,91 (C)
83	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	4,17(C)
84	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ CH ₃	4,34 (C)
85	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	4,85 (C)
86	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CF ₃	4,97 (C)

Comp. nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
87	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ C(O)OCH ₃	3,61 (C)
88	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-CH ₂ C(O)OEt	4,45 (C)
89	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ CH ₂ C(O)OEt	4,00 (C)
90	H	H	H	H	H	Et	H		4,68 (C)
91	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₃)-C(O)OCH ₂ CH ₃	4,45 (C)
92	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH(CH ₂ CH ₃)-C(O)OCH ₃	4,40(C)

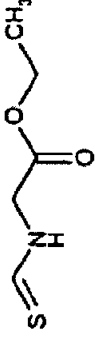
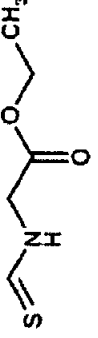
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
93	H	H	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-	4,05 (C)
94*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ CN	4,78 q (B)
95	H	F	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4,56 tr (A)
96	H	F	H	H	H	CF ₃	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
97	H	H	H	H	H	Ph	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
98*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -SO ₂ -Me	2,5 (C)
99*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -SO-Me	
100*	H	H	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-C(CH ₃) ₂ -SO ₂ -Me	
101	H	Cl	H	H	H		H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
102	Cl	H	Cl	Cl	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	

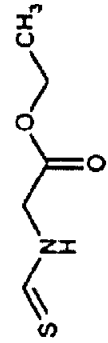
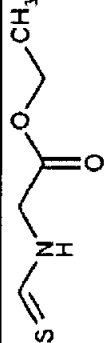
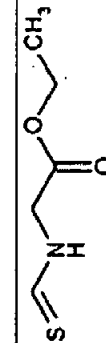
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
103	H	F	OMe	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
104	H	H	OMe	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
104	H	OMe	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
105	Me	F	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
106	OMe	H	H	OMe	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
107	Me	H	Me	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
108	Cl	H	Cl	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	
109	H	CF ₃	H	H	H	Me	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4,1 (C)
110	H	F	H	H	H	Et	H	C(S)-NH-CH ₂ -CH ₂ -O-Me	4,55 t (A)
111*	H	F	H	H	H	Me	H		3,9 (C)

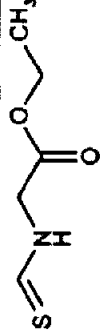
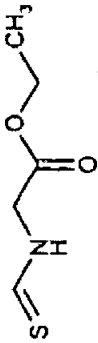
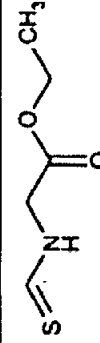
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
112	H	H	H	H	H	H	H		2,9 (C)
113	H	F	H	H	H	H	H		3,2 (C)
114	H	OMe	H	H	H	Me	H		3,3 (C)
115	H	OMe	H	H	H	Me	H		3,6 (C)
116	H	Me	H	H	H	Me	H		4,1 (C)

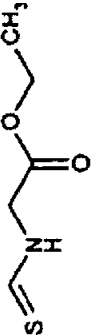
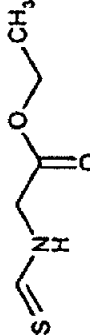
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
117	H	Me	H	H	H	Me	H		3,8 (C)
118	H	F	H	F	H	Me	H		4,1 (C)
119	H	F	H	F	H	Me	H		3,9 (C)
120	H	F	H	F	H	Et	H		4,3 (C)
121	H	F	H	F	H	Et	H		4,4 (C)

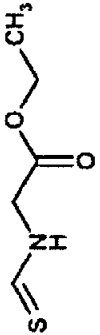
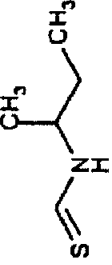
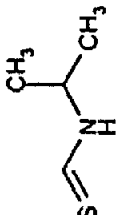
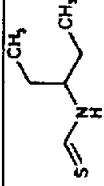


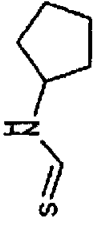
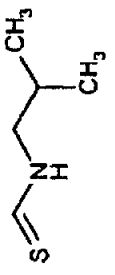
Comp. nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
122	F	H	H	F	H	Et	H		4,1 (C)
123	F	H	H	F	H	Et	H		4,3 (C)
124	F	H	H	F	H	Me	H		3,8 (C)
125	F	H	H	F	H	Me	H		4,0 (C)
126	H	CF ₃	H	H	H	Et	H		4,5 (C)

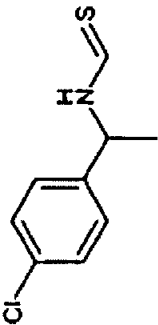
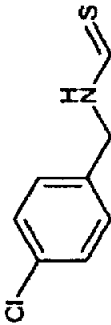
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
127	H	CF ₃	H	H	H	Et	H		4,7 (C)
128	H	CF ₃	H	H	H	Me	H		4,4 (C)
129	H	OCF ₃	H	H	H	Me	H		4,3 (C)
130	H	OCF ₃	H	H	H	Me	H		4,5 (C)
131	H	Cl	H	Cl	H	Me	H		4,8 (C)

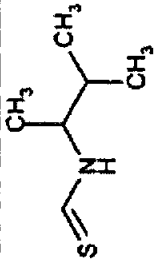
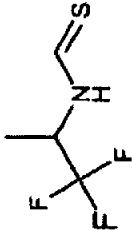
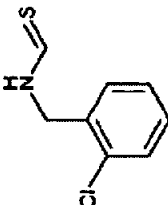
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
132	H	Cl	H	Cl	H	Me	H		5,0 (C)
133	H	Cl	H	F	H	Me	H		4,3 (C)
134	H	Cl	H	F	H	Me	H		4,5 (C)
135	H	H	F	F	H	Me	H		3,7 (C)
136	H	H	F	F	H	Me	H		4,0 (C)

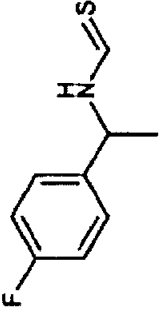
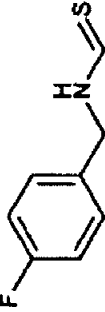
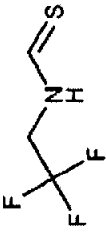
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
137	H	F	F	F	H	Me	H		4,0 (C)
138	H	F	F	F	H	Me	H		4,3 (C)
139	H	Cl	H	F	H	Et	H		4,7 (C)
140	H	Cl	H	F	H	Et	H		4,9 (C)
141	H	Cl	H	H	H	CHF ₂	H		3,7 (C)

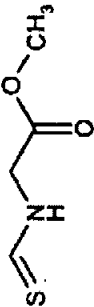
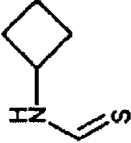
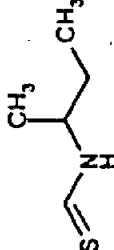
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
142	H	Cl	H	H	H	CHF ₂	H		3,9 (C)
143*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)
144*	H	F	H	H	H	Me	H		4,11 (C)
145*	H	F	H	H	H	Me	H		4,11(C)
146*	H	F	H	H	H	Me	H		4,94 (C)

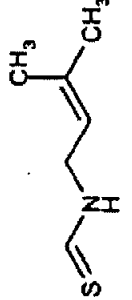
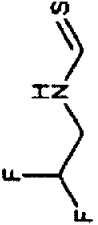
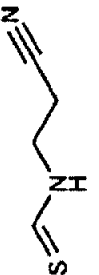
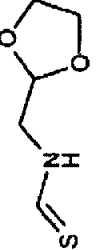
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
147*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)
148*	H	F	H	H	H	Me			3,68 (C)
149*	H	F	H	H	H	Me	H		4,72 (C)
150*	H	F	H	H	H	Me	H		4,17 (C)
151*	H	F	H	H	H	Me	H		4,51 (C)

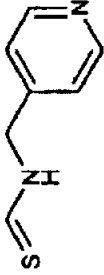
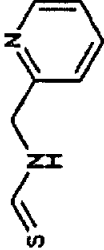
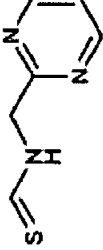
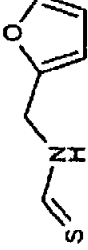
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
152*	H	F	H	H	H	Me	H		3,78 (C)
153*	H	F	H	H	H	Me	H		4,40 (C)
154*	H	F	H	H	H	Me	H		5,22 (C)
155*	H	F	H	H	H	Me	H		4,80 (C)

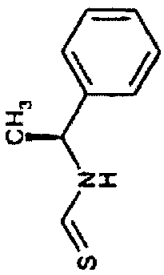
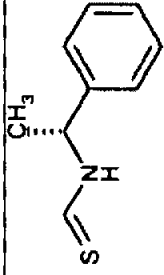
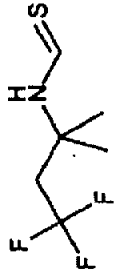
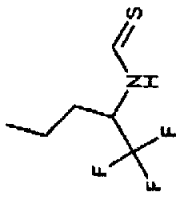
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
156*	H	F	H	H	H	Me	H		4,87 (C)
157*	H	F	H	H	H	Me	H		4,40 (C)
158*	H	F	H	H	H	Me	H		4,80 (C)

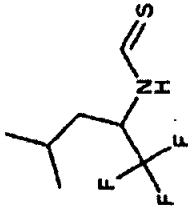
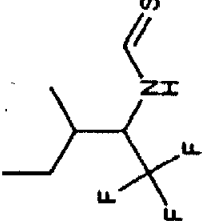
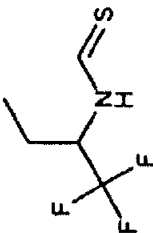
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
159*	H	F	H	H	H	Me	H		4,72 (C)
160*	H	F	H	H	H	Me	H		4,34 (C)
161*	H	F	H	H	H	Me	H		4,00 (C)
162*	H	F	H	H	H	Me	H		3,47 (C)

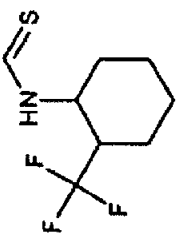
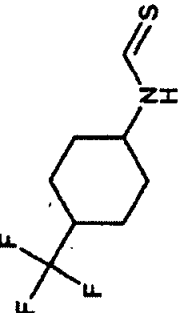
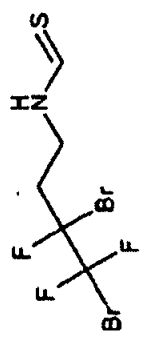
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
163*	H	F	H	H	H	Me	H		3,28 (C)
164*	H	H	H	H	H	Me	H		4,28 (C)
165*	H	H	H	H	H	Me	H		4,45 (C)
166*	H	H	H	H	H	Me	H		1,26 (C)

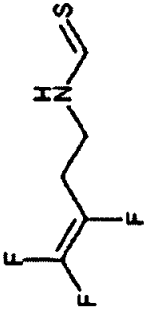
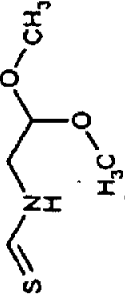
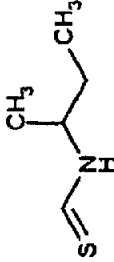
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
167*	H	H	H	H	H	Me	H		4,57 (C)
168*	H	H	H	H	H	Me	H		3,63 (C)
169*	H	H	H	H	H	Me	H		2,85 (C)
170*	H	H	H	H	H	Me	H		3,27 (C)
171*	H	H	H	H	H	Me	H		3,18(C)

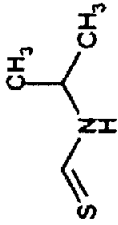
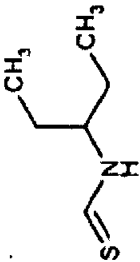
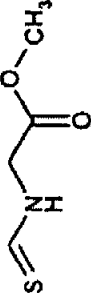
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
172*	H	H	H	H	H	Me	H		1,69 (C)
173*	H	H	H	H	H	Me	H		1,52 (C)
174*	H	H	H	H	H	Me	H		1,45 (C)
175*	H	H	H	H	H	Me	H		3,89 (C)

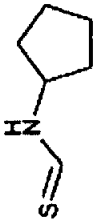
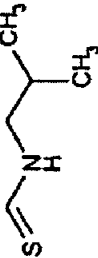
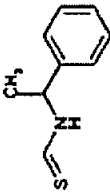
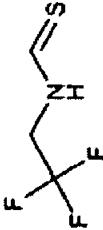
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
176*	H	H	H	H	H	Me	H		4,74 (C)
177*	H	H	H	H	H	Me	H		4,74 (C)
178*	H	H	H	H	H	Me	H		4,85 (C)
179*	H	H	H	H	H	Me	H		5,14 (C)

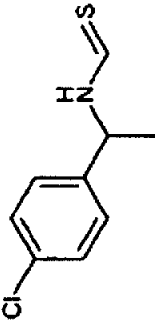
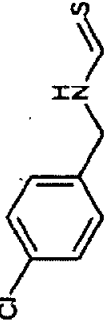
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
180*	H	H	H	H	H	Me	H		5,46 (C)
181*	H	H	H	H	H	Me	H		5,46 (C)
182*	H	H	H	H	H	Me	H		4,80 (C)

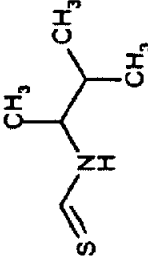
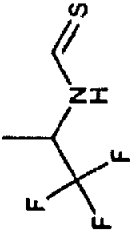
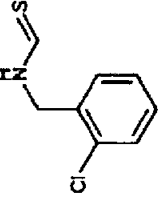
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
183*	H	H	H	H	H	Me	H		4,85 (C)
184*	H	H	H	H	H	Me	H		4,91 (C)
185*	H	H	H	H	H	Me	H		5,16(C)

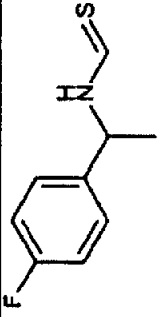
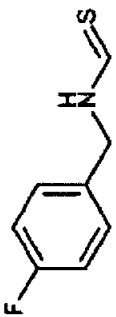
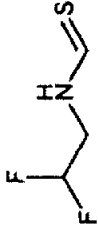
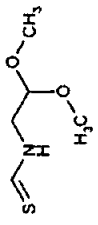
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
186*	H	H	H	H	H	Me	H		4,30 (C)
187	H	F	H	F	H	Me	H		3,85 (C)
188	H	F	H	F	H	Me	H		4,76 (C)
189	H	F	H	F	H	Me	H		4,40 (C)

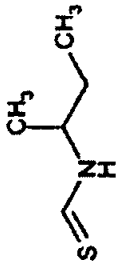
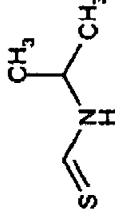
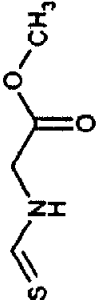
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
190	H	F	H	F	H	Me	H		4,45 (C)
191	H	F	H	F	H	Me	H		5,15 (C)
192	H	F	H	F	H	Me	H		3,56 (C)
193	H	F	H	F	H	Me	H		4,85 (C)
194	H	F	H	F	H	Me	H		4,00 (C)

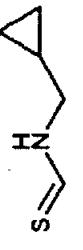
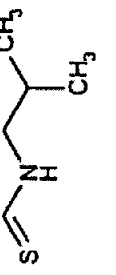
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
195	H	F	H	F	H	Me	H		4,85 (C)
196	H	F	H	F	H	Me	H		4,45 (C)
197	H	F	H	F	H	Me	H		4,83 (C)
198	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
199	H	F	H	F	H	Me	H		4,17(C)

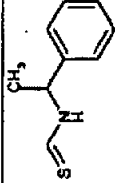
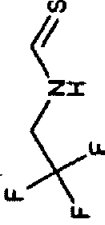
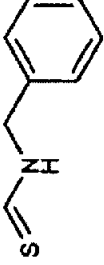
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
200	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)
201	H	F	H	F	H	Me	H		4,64 (C)
202	H	F	H	F	H	Me	H		5,29 (C)
203	H	F	H	F	H	Me	H		5,02 (C)

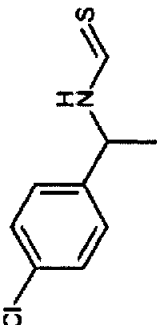
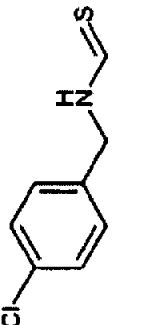
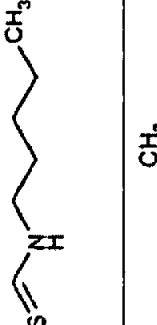
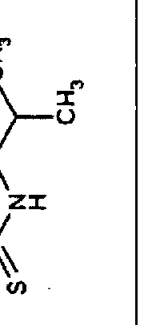
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
204	H	F	H	F	H	Me	H		5,22 (C)
205	H	F	H	F	H	Me	H		5,08 (C)
206	H	F	H	F	H	Me	H		4,57 (C)
207	H	F	H	F	H	Me	H		5,02 (C)

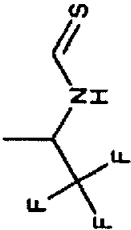
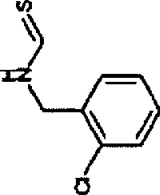
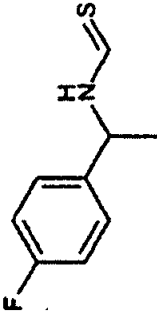
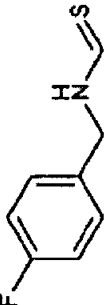
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
208	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
209	H	F	H	F	H	Me	H		4,57 (C)
210	H	F	H	F	H	Me	H		3,80 (C)
211	H	H	H	H	H	H	H		3,09 (C)

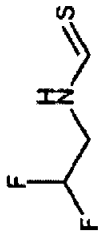
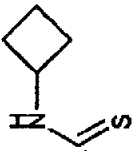
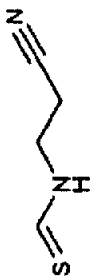
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
212	H	H	H	H	H	H	H		4,05 (C)
213	H	H	H	H	H	H	H		3,51 (C)
214	H	H	H	H	H	H	H		3,61 (C)
215	H	H	H	H	H	H	H		2,73 (C)

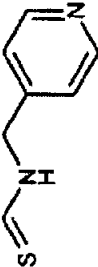
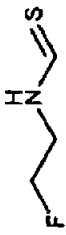
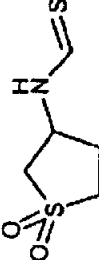
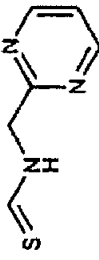
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
216	H	H	H	H	H	H	H		4,05 (C)
217	H	H	H	H	H	H	H		3,04(C)
218	H	H	H	H	H	H	H		4,28 (C)
219	H	H	H	H	H	H	H		3,65 (C)
220	H	H	H	H	H	H	H		3,17(C)

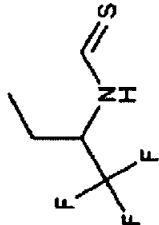
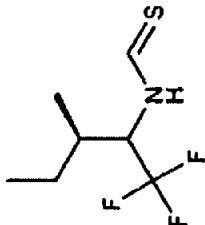
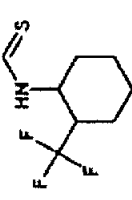
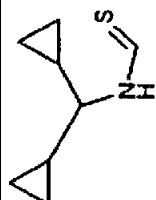
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
221	H	H	H	H	H	H	H		4,40 (C)
222	H	H	H	H	H	H	H		3,70 (C)
223	H	H	H	H	H	H	H		3,23 (C)
224	H	H	H	H	H	H	H		4,00 (C)

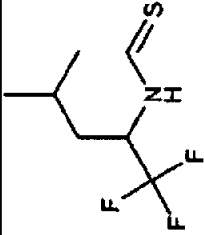
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
225	H	H	H	H	H	H	H		4,89 (C)
226	H	H	H	H	H	H	H		4,51 (C)
227	H	H	H	H	H	H	H		4,57 (C)
228	H	H	H	H	H	H	H		4,51 (C)

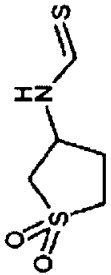
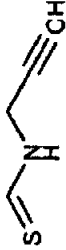
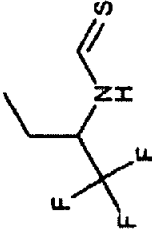
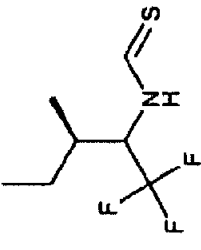
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
229	H	H	H	H	H	H	H		4,11 (C)
230	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
231	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
232	H	H	H	H	H	H	H		4,00 (C)

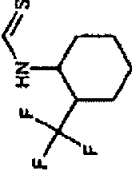
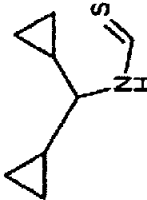
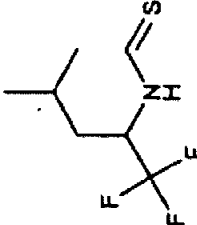
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
233	H	H	H	H	H	H	H		3,32 (C)
234	H	F	H	F	H	Me	H		4,64 (C)
235	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)
236	H	F	H	F	H	Me	H		3,19 (C)

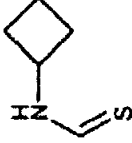
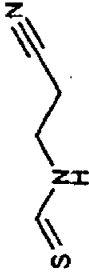
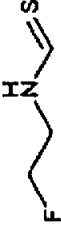
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
237	H	F	H	F	H	Me	H		4,11 (C)
238	H	F	H	F	H	Me	H		1,96 (C)
239	H	F	H	F	H	Me	H		3,63 (C)
240	H	F	H	F	H	Me	H		2,93 (C)
241	H	F	H	F	H	Me	H		1,66 (C)

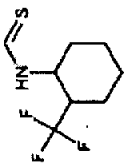
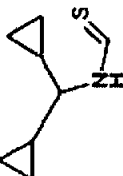
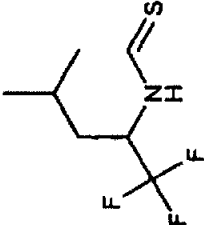
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
242	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
243	H	F	H	F	H	Me	H		5,51 (C)
244	H	F	H	F	H	Me	H		4,89 (C)
245	H	F	H	F	H	Me	H		5,08 (C)

Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
246	H	F	H	F	H	Me	H		5,51 (C)
247	H	H	H	H	H	H	H		3,33 (C)
248	H	H	H	H	H	H	H		2,50 (C)
249	H	H	H	H	H	H	H		3,37 (C)
250	H	H	H	H	H	H	H		2,89 (C)

Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
251	H	H	H	H	H	H	H		2,38 (C)
252	H	H	H	H	H	H	H		3,06 (C)
253	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
254	H	H	H	H	H	H	H		5,15 (C)

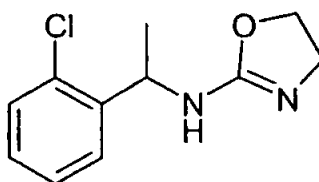
Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
255	H	H	H	H	H	H	H		4,57 (C)
256	H	H	H	H	H	H	H		4,45 (C)
257	H	H	H	H	H	H	H		5,15 (C)

Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
258	H	F	H	H	H	H	H		4,05 (C)
259	H	F	H	H	H	H	H		3,47 (C)
260	H	F	H	H	H	H	H		2,69 (C)
261	H	F	H	H	H	H	H		3,53 (C)
262	H	F	H	H	H	H	H		3,06 (C)

Comp. n°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Datos físicos
267	H	F	H	H	H	H	H		4,51 (C)
268	H	F	H	H	H	H	H		4,57 (C)
269	H	F	H	H	H	H	H		5,08 (C)

Preparación de materiales de partida

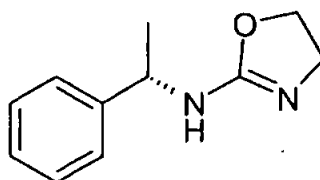
N-[1-(2-clorofenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina

**Etapa 1:**

- 5 Se añadieron 3,2 g (20,6 mmol) de 1-(2-clorofenil)etanamina [CAS 39959-67-6] y 52,3 g (22,6 mmol) de trietilamina a 20 ml de diclorometano y después se añadieron gota a gota 2,4 g (22,6 mmol) de 2-cloroetilisocianato. La mezcla se dejó reaccionar 15 horas a 20°C. Los componentes volátiles se evaporaron para dar 1-(2-cloroetil)-3-[1-(2-clorofenil)etil]urea (log p = 2,3) que
- 10 se usó en la etapa 2 sin más purificación

Etapa 2:

- Se calentaron 7,2 g (27,5 mmol) de 1-(2-cloroetil)-3-[1-(2-clorofenil)etil]urea, 5,25 g (34,5 mmol) de 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU) hasta 60°C en 60 ml de acetonitrilo durante aproximadamente 15 horas.
- 15 Los componentes volátiles se evaporaron y el residuo se disolvió en agua y diclorometano. La fase orgánica se secó con sulfato de sodio y después de la filtración se evaporó. El sólido restante se lavó con acetonitrilo frío para dar 2,4 g de N-[1-(2-clorofenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina (39% del teórico). (RMN ¹H (CDCl₃): 4,76 cuartete)
- 20 N-[(1S)-1-feniletil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina



Etapas 1:

Se añadieron 6,1 g (50,3 mmol) de 1(S)-1-feniletilamina [CAS 2627-86-3] y 5,6 g (55,3 mmol) de trietilamina a 45 ml de diclorometano y después se añadieron gota a gota 5,8 g (22,6 mmol) de 2-cloroetilisocianato. La mezcla se dejó reaccionar 15 horas a 20°C. Los componentes volátiles se evaporaron para dar 1-(2-cloroetil)-3-[(1S)-1-feniletil]urea ($\log p = 1,76$) que se usó en la etapa 2 sin más purificación.

Etapas 2:

Se calentaron 11,4 g (50,3 mmol) de 1-(2-cloroetil)-3-[(1S)-1-feniletil]urea y 9,6 g (63 mmol) de 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undec-7-eno (DBU) hasta 60°C en 50 ml de acetonitrilo durante aproximadamente 15 horas. Los componentes volátiles se evaporaron; el residuo se disolvió en acetato de etilo y se lavó tres veces con agua. La fase orgánica se secó con sulfato de sodio y después de la filtración se evaporó para dar 8 g de N-[(1S)-1-feniletil]-4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-amina (79% del teórico). (RMN ^1H (DMSO- d_6): 4,61 cuartete)

Ejemplos biológicos

Ejemplo nº 1

Prueba con *Myzus* (tratamiento por pulverización)

20	Disolvente:	78	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5	partes en peso de éter poliglicólico de alquilarilo

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 5 Discos de col china (*Brassica pekinensis*) que están infestados con todos los estadios del pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae*) se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %.

- 10 100% significa que se han eliminado todos los pulgones; 0% significa que no se ha eliminado ninguno de los pulgones.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran al menos el 80% de actividad a una concentración de 500 g/ha:

Compuestos nº 1-8, 11-48, 51, 54-57, 59-69, 72, 74, 75 y 77-93.

15 **Ejemplo nº 2**

Prueba con *Tetranychus*, resistente a OP (tratamiento por pulverización)

Disolventes: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de éter poliglicólico de alquilarilo

- 20 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 25 Discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*) que están infestados por todos los estadios de la arañuela roja de los invernaderos (*Tetranychus urticae*)

se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que se han eliminado todas las arañas; 0% significa que no se ha eliminado ninguna de las arañas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran al menos el 80% de actividad a una concentración de 20 g/ha: Compuestos nº 3, 5, 25, 32 y 34.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran al menos el 80% de actividad a una concentración de 100 g/ha: Compuestos nº 2, 11, 15, 20, 21, 22, 24, 28, 33, 35-38, 40-42, 45, 47 y 78.

En esta prueba, por ejemplo, el siguiente compuesto de la tabla 1 muestra al menos el 80% de actividad a una concentración de 500 g/ha: Compuesto nº 27.

15 **Ejemplo nº 3**

Prueba con *Meloidogyne* (tratamiento por pulverización)

Disolvente: 80 partes en peso de acetona

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolvente, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Los recipientes se llenan con arena, disolución de compuesto activo, suspensión de huevos/larvas de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantas se desarrollan. En las raíces se forman vesículas.

Después del periodo de tiempo deseado, la actividad nematocida se

determina por la formación de vesículas en %. 100% significa que no se encontraron vesículas; 0% significa que el número de vesículas en las plantas tratadas se corresponde con el de los controles sin tratar.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran al menos el 80% de actividad a una concentración de 20 ppm:

Compuestos nº 62-65.

Ejemplo nº 4

Prueba con *Aphis gossypii* (tratamiento por pulverización)

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida
10 Emulsionante: 2 partes en peso de éter poliglicólico de alquilarilo

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

15 Hojas de algodón (*Gossypium hirsutum*) que están muy infestadas con el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*) se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado se determina la eliminación en %. 100% significa que se han eliminado todos los pulgones; 0% significa que
20 no se ha eliminado ninguno de los pulgones.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran al menos el 80% de actividad a una concentración de 100 ppm:

Compuestos nº 6-8.

Ejemplo nº 5

25 **Prueba con *Boophilus microplus* (inyección)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de disolvente, y el concentrado se diluye con disolvente a la concentración deseada.

La disolución de compuesto activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*) y los animales se transfieren a platos y se guardan en un habitación de temperatura controlada.

10 Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que ninguna garrapata ha puesto huevos fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, el siguiente compuesto de la tabla 1 muestra al menos el 80% de actividad a una concentración de 20 µg/animal: Compuesto nº 78.

Ejemplos biológicos comparativos

15 **Ejemplo nº 1**

Prueba con *Myzus* (tratamiento por pulverización con MYZUPE)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona
 1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 0,5 partes en peso de éter poliglicólico de alquilarilo

20 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

25 Discos de col china (*Brassica pекinensis*) que están infestados con todos los estadios del pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae*) se

pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que se han eliminado todos los pulgones; 0% significa que no se ha eliminado ninguno de los pulgones.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1 muestran una actividad superior a la técnica anterior: véase la tabla 2.

Ejemplo nº 2

Prueba con *Tetranychus*; resistente a OP (tratamiento por pulverización con TETRUR)

Disolventes: 78 partes en peso de acetona
 1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 0,5 partes en peso de éter poliglicólico de alquilarilo

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con las cantidades establecidas de disolventes y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*) que están infestados por todos los estadios de la arañuela roja de los invernaderos (*Tetranychus urticae*) se pulverizan con una preparación de compuesto activo de la concentración deseada.

Después del periodo de tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que se han eliminado todas las arañuelas; 0% significa que no se ha eliminado ninguna de las arañuelas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de la tabla 1

muestran una actividad superior a la técnica anterior: véase la tabla 2

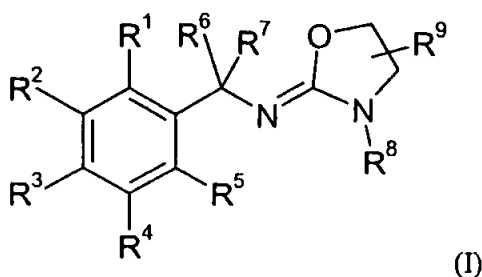
Tabla 2 Ejemplos comparativos

Compuesto	1. Aplicación por pulverización con MYZUPE		2. Aplicación por pulverización con TETRUR	
	g/ha	% 6 d	g/ha	% 6 d
2 según la invención (Tabla 1)	20	100	100	90
3 según la invención (Tabla 1)	20	100	100	70
B49 según el documento WO 2006/127426, pág. 48	20	0	100	0

Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

- 5 1. Compuestos de fórmula (I)



en la que

10 R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo, alcoxi, haloalquilo, alcóxialquilo, cicloalquilo, cianoalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo, halogenoalquilsulfonilo, alcoxycarbonilo, acetilo, alquylcarbonilo, alquylcarbonilo, pentafluorosulfanilo, amino, mono y dialquilamino, cicloalquilamino, alqueno, haloalqueno, alquino, haloalquino, ciano o nitro, o

15 representan independientemente entre sí arilo, arilo o heteroarilo que están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxycarbonilo, nitro y ciano;

20 R^6 y R^7 independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcóxialquilo, alquylmercaptoalquilo, alqueno o

- alquinilo, o representan independientemente entre sí arilo, heteroarilo o heterociclilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, alcoxi, nitro y ciano;
- R^8 representa $-C(Z)R^{10}$, $-C(Z)OR^{10}$ o $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;
- 5 Z representa O o S;
- R^9 representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo;
- R^{10} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmecapto y ciano, o representa alquilo C_3-C_6 , cicloalquilo o bencilo, opcionalmente sustituidos con uno o
- 10 más sustituyentes seleccionados de halógeno y alcoxi;
- R^{11} representa alquilo C_1-C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmecapto, alcoxycarbonilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y ciano, o representa alquilo C_3-C_8 , cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenilo o alquinilo, opcionalmente
- 15 sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquilmecapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcoxycarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes
- 20 seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxycarbonilo, heterociclilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halogenoalquilo;
- R^{12} representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados
- 25 de halógeno, alcoxi, alquilmecapto, ciano, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo,

dialquilamino, alcóxicarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilalquilo, arilo o heteroarilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halógenoalquilo, alcoxi, halógenoalcoxi, alcóxicarbonilo, 5 dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, $S(O)_n$ -alquilo y $S(O)_n$ -halógenoalquilo;

n es 0, 1 ó 2.

2. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

10 R^1, R^2, R^3, R^4 y R^5 independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, alcoxialquilo, cicloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfoniloxi, halógenoalquilsulfonilo, alcóxicarbonilo, acetilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, dialquilamino, cicloalquilamino, alquenilo, 15 haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, ciano o nitro;

R^6 y R^7 independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alquilmercaptoalquilo, alquenilo o alquinilo, o independientemente entre sí representan arilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de 20 halógeno, alquilo, alcoxi, nitro y ciano;

R^8 representa $-C(Z)NR^{11}R^{12}$;

Z representa O o S;

R^9 representa hidrógeno, o alquilo;

R^{11} representa alquilo C_1 - C_2 , sustituido con uno o más sustituyentes 25 seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmercapto, alcóxicarbonilo,

- alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenilo o alquinilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquilmercapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcóxicarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcóxicarbonilo, heterociclilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, S(O)_n-alquilo y S(O)_n-halogenoalquilo;
- 5 R¹² representa hidrógeno o alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquilmercapto, ciano, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, dialquilamino, alcóxicarbonilo y dialquilaminocarbonilo, o representa arilalquilo, heterociclilalquilo, arilo o heteroarilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcóxicarbonilo, dialquilaminocarbonilo, ciano, nitro, dialquilamino, S(O)_n-alquilo, y S(O)_n-halogenoalquilo;
- 10 n es 0, 1 ó 2

3. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 ó 2, en la que R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo o haloalcoxi;
- 25 R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan hidrógeno, alquilo o

haloalquilo;

R⁸ representa -C(S)NR¹¹R¹²;

R⁹ representa hidrógeno;

5 R¹¹ representa alquilo C₁-C₂, sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alcoxi, alquiltercapto, alcoxycarbonilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo o ciano, o representa alquilo C₃-C₈, cicloalquilo, cicloalquilalquilo o alqueno, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, haloalquilo, alcoxi, alquiltercapto, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo y alcoxycarbonilo, o
10 representa arilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, heteroarilo o heteroarilalquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, alcoxi, halogenoalcoxi, alcoxycarbonilo y heterociclilo; y

R¹² representa hidrógeno.

15

4. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 3, en la que

R⁶ representa alquilo,

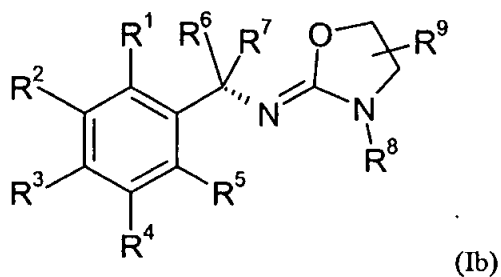
R⁷ representa hidrógeno y

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁸, R⁹, R¹¹ y R¹² son como se definen en la reivindicación 3.

20

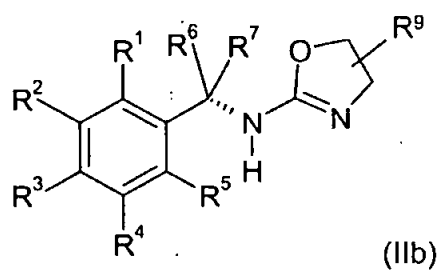
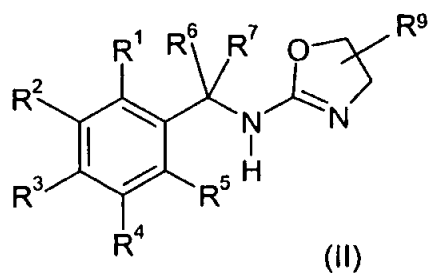
5. Compuestos de fórmula (Ib)

137

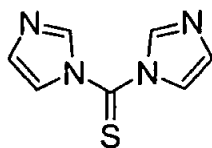


en la que R^1 a R^{12} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.

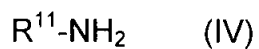
- 5 6. Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) o (Ib) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en las que R^8 es $-C(S)NR^{11}R^{12}$ y R^{12} es hidrógeno, en el que un compuesto de fórmula (II) o (IIb)



- 10 en las que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 y R^9 son como se definen anteriormente se hace reaccionar con tiocarbonildiimidazol



y un compuesto de fórmula (IV)



en la que

R^{11} es como se define anteriormente,

5 en un disolvente aprótico.

7. Composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o (Ib) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 y sustancias de relleno y/o tensioactivos habituales.

10

8. Procedimiento para controlar plagas, en el que un compuesto de fórmula (I) o (Ib) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o una composición según la reivindicación 7 se deja actuar sobre las plagas y/o su hábitat.

15

9. Uso de compuestos de fórmula (I) o (Ib) según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de composiciones según la reivindicación 7 para controlar plagas.

RESUMEN

La presente invención se refiere a derivados novedosos de bencilaminas sustituidas, a procedimientos para su preparación y a su uso para controlar plagas animales, especialmente artrópodos, en particular insectos.

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 22) Fecha de solicitud:		(51) Int Cl: (71)Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad 07006907.5 07007590.8	(32) Fecha 03/04/07 13/04/07	(33) País EP EP
		(72) Inventor(es) ARNOLD, Christian; GÖRGENS, Ulrich; SCHWARZ, Hans-Georg; HOLMWOOD, Graham; ANDREE, Roland; MALSAM, Olga; SCHALLNER, Otto; FRANKEN, Eva-Maria; ANTONICEK, Horst-Peter; WERNER, Stefan	
		(74) Apoderado: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 03-11-09 Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 28 - 03 -08 No. de solicitud PCT/ EP2008/002475		(87)Publicación Internacional Fecha: 09-10- 08 Fecha (dd/mm/aa) N° publicación: WO/08/ 119511 A1	
(54) Titulo: DERIVADOS INSECTICIDAS DE BENCILAMINAS SUSTITUIDAS			

Resumen:

La presente invención se refiere a derivados novedosos de bencilaminas sustituidas, a procedimientos para su preparación y a su uso para controlar plagas animales, especialmente artrópodos, en particular insectos.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

*Este recibo debe ser utilizado
Únicamente para tramites de
Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.*

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 62,104
FECHA : AGOSTO 21 DE 2009

Marca: PC/EP2008/002475

Expediente: _____

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MARIO DELGADO ECHEVERRY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111583883	21/08/2009	15,241,000.00

***** CONCEPTO *****

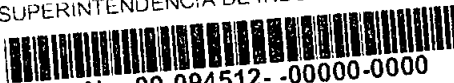
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
1		TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	540,000.00
		TOTAL :	\$ 540,000.00

SON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-094512- -00000-0000

Fecha: 2009-09-04 16:10:50

Tra 11 PATENTE IYII

Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACIONI

Eve: 378 FASENACIONALI

Folios: 257



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION

☒

MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente ☒
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud ☒
- ◆ Descripción de la invención ☒
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes ☒
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas ☒

COMPLETA

☒

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

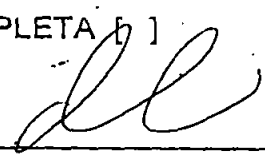
INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-094512- -00000-0000

Fecha: 2009-09-04 16:10:50 Dep. 2020 NUECREACION!
Tra. 11 PATENTE/II Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios 257

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



Bogotá,
2020

Doctor(a)
DELGADO VILLEGAS JAIME EDUARDO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPS SCIENCE AG

REFERENCIA	Radicación No.	09 94512
	Solicitud internacional	PCT/EP2008/002475
	Fecha inicio, fase nacional	03/11/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	905

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

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

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

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

ALIX CARMENZA CESPEDOS DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 29 ENE. 2010
adpall

Al contestar favor indique el número
de radicación consignado en el rótulo

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 587000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26 - 55 int.2. Tel 5880070
Call Center 6513240. Línea 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia