



Q + Nota

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organizacion CSA Ltda

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

09-112449

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO ARIL PIRROLIDINAS INSECTICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO MONHEIM, ALEMANIA

74. APODERADO JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

22. BOGOTÁ, D. C.,

Com. ^
FN. 23-11-2004

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-112449- -00000-0000

Fecha: 2009-10-09 15:58:04
Tra. 11 PATENTE I/II
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONAL
Folios: 296

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 CROPSOURCE 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/EP2008/003105**

Fecha: **14 - 04 - 08**

Publicacion Internacional No. **WO 2008/128711 A1**

Fecha: **30 - 10 - 08**

7

Título (54)

ARIL PIRROLIDINAS INSECTICIDAS

Clasificación internacional (51) _____

8

Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

JP

(32) Fecha

23/04/2007

(31) Número de Solicitud

2007-112855

9

Comprobante de pago No.

Fecha:

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

INVENTORES

- 1) **MIHARA, Jun**
2-11-1-603, Ekihigashidouri, Oyama-shi,
Tochigi 323-0022, JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 2) **MURATA, Tetsuya**
7-16-24-202, Joto, Oyama-shi,
Tochigi 323-0807, JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 3) **YAMAZAKI, Daiei**
5-10-5, Higashijonan, Oyama-shi,
Tochigi 323-0829, JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 4) **YONETA, Yasushi**
166-3, Kabagasaki Hanyu-shi,
Saitama, 348-0031 JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 5) **SHIBUYA, Katsuhiko**
6-14-4, Midori, Shimotsuke-shi
Tochigi 329-0433 JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 6) **SHIMOJO, Eiichi**
4-16-1 F-202, Nishijonan, Oyama-shi,
Tochigi 323-0820, JAPON
Nacionalidad: Japonesa
- 7) **GÖRGENS, Ulrich**
Fester Str. 37, 40882 Ratingen, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana

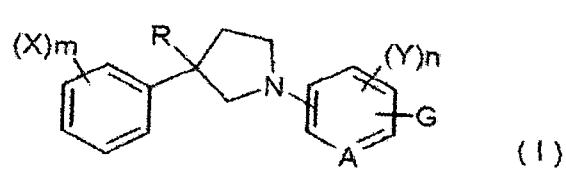
10

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.

11

FIGURA CARACTERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JAIME EDUARDO DEL GADO VILLEGAS

FIRMA: 

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

12336
Marcas - Patentes
Modelos - Diseños
Nombres Comerciales - Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA - ICA
Acciones Judiciales - Administrativas
Derecho Comercial - Industrial
Asesoría - Contratos - Otros
Corresponsalia 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 and 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 logotype, 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,

3371530Y Madrid
ID Card No. issued in

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 _____ on _____ 200_____

Notary Public. _____

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

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
DNI _____ Rcpdo en _____

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.

Dado y firmado en _____ el _____ de _____ de 200_____

Notario Público. _____

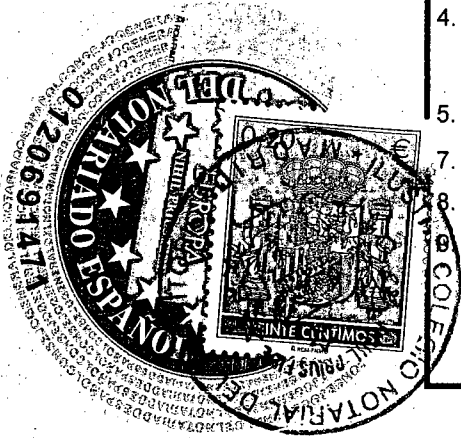
Autenticarlo ante Notario con el lleno de la Certificación Notarial y refrendarlo por Apostilla o Consulado.

COMO NOTARIO 71 DE
ESTE CIRCULO HAGO CONSTAR
QUE ESTA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL CON QUE HA
SIDO CONFRONTADO.
LE...//
MAR. 18 2009
MAURICIO GARCIA-HERREROS C.
NOTARIO 71 TITULAR
BOGOTA

...//GITIMACIÓN: Yo, SANTIAGO RUBIO LINIERS, Notario del Ilustre colegio de Madrid con residencia en esta Capital:-----

Conozco y considero legítima la firma que antecede 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.=.

Santiago Rubio Liniers



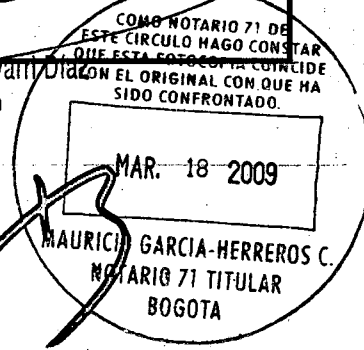
Apostille (o legalización única)
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
(Real Decreto 2433/1978, de 2 de octubre)

1. País: *España*
El presente documento público
2. Ha sido firmado por **D. Santiago Rubio Liniers**
3. Actuando en calidad de *NOTARIO*
4. 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:

[Signature]
Dona M^a Nieves González de Echavarría
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
Alfred-Nobel-Str. 50, Building 6100
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 23 May 2008 (23.05.2008)	
Applicant's or agent's file reference BCS077006-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2008/003105	International filing date (day/month/year) 14 April 2008 (14.04.2008)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 23 April 2007 (23.04.2007)
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
23 April 2007 (23.04.2007)	2007-112855	JP	19 May 2008 (19.05.2008)

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Yolaine Cussac

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail PT05.PCT@WIPO.INT
Telephone No. +41 22 338 74 05

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
30 October 2008 (30.10.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/128711 A1

(51) International Patent Classification:

C07C 205/06 (2006.01) C07D 403/10 (2006.01)
C07D 207/04 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) A01N 43/36 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01)

(JP). SHIMOJO, Eiichi [JP/JP]; 4-16-1-F202, Nishijonan, Oyama-shi, Tochigi 323-0820 (JP). GÖRGENS, Ulrich [DE/DE]; Fester Str. 37, 40882 Ratingen (DE).

(21) International Application Number:

PCT/EP2008/003105

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

(22) International Filing Date: 14 April 2008 (14.04.2008)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:

2007-112855 23 April 2007 (23.04.2007) JP

(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.

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

(72) Inventors; and

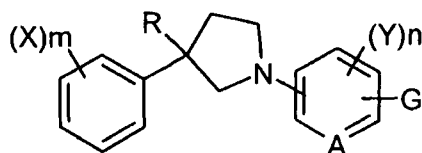
(75) Inventors/Applicants (for US only): MIHARA, Jun [JP/JP]; 2-11-1-603 Ekihigashidouri, Oyama-shi, Tochigi 323-0022 (JP). MURATA, Tetsuya [JP/JP]; 7-16-24-202, Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0807 (JP). YAMAZAKI, Daici [JP/JP]; 5-10-5 Higashijonan, Oyama-shi, Tochigi 323-0829 (JP). YONETA, Yasushi [JP/JP]; 1-10-3, Dote, Kazo-shi, Saitama 347-0056 (JP). SHIBUYA, Katsuhiko [JP/JP]; 6-14-4, Midori, Shimotsuke-shi, Tochigi 329-0433

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GI, 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

(54) Title: INSECTICIDAL ARYL PYRROLIDINES



(I)

(57) Abstract: The present invention provides novel aryl pyrrolidines having an excellent insecticidal action as insecticides. Aryl pyrrolidines represented by the formula (I) and use thereof as insecticide.

WO 2008/128711 A1

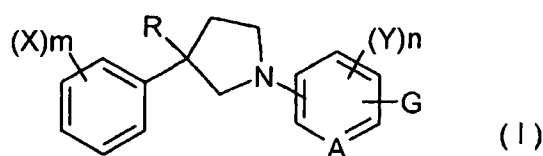
Insecticidal aryl pyrrolidines

The present invention relates to novel aryl pyrrolidines and the use thereof as insecticides.

WO2005/085216 describes that isoxazoline substituted benzamide compounds are useful as pest control agents.

- 5 The inventors were dedicated to studying to develop novel compounds exhibiting higher effects and a broad spectrum against animal pests, such as insects and acari. As a result, the inventors found novel aryl pyrrolidines showing an excellent, i.e. high activity, having a broad spectrum and are harmless to beneficial insects, such as bees, as well as effective against insect pests. Particularly to such insects which are resistant to insecticides, such as organophosphorus or
- 10 carbamate agents.

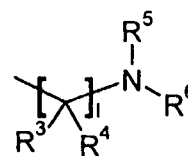
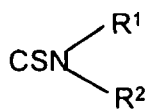
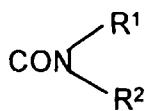
The compounds according to the invention are represented by formula (I)



wherein

- X which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, haloalkylthio, haloalkylsulfinyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, alkylcarbonylamino, haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, alkoxy-carbonylamino, haloalkoxycarbonylamino, alkylsulfonylamino or haloalkylsulfonylamino;
- 15
- Y which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, haloalkylthio, haloalkylsulfinyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, alkylcarbonylamino, haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, alkoxy-carbonylamino, haloalkoxycarbonylamino, alkylsulfonylamino or haloalkylsulfonylamino;
- 20
- R represents alkyl or haloalkyl;
- 25 m represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- n represents 1, 2, 3 or 4;

G is selected from the group consisting of



wherein

R¹ and R² each independently represents hydrogen; optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or alkylsulfonyl; haloalkylsulfonyl or CH₂-R⁷; or when taken together represent C₂₋₆ alkylene;

R³ and R⁴ each independently represents hydrogen; cyano; optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl; or when taken together represent C₂₋₆ alkylene;

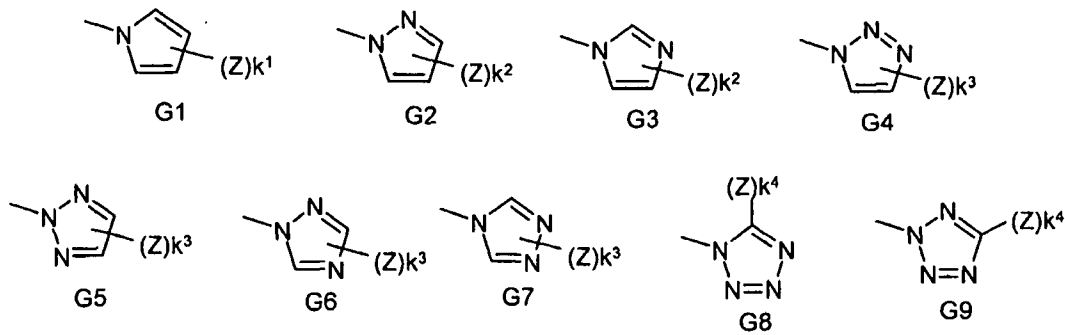
l represents 1, 2 or 3;

R⁵ represents hydrogen; alkyl; optionally substituted cycloalkyl; haloalkyl; cyano; alkenyl; alkynyl; alkylcarbonyl or CH₂-R⁷;

R⁶ represents formyl, cyano, alkylcarbonyl, alkylthiocarbonyl, haloalkylcarbonyl, haloalkylthiocarbonyl, alkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, alkoxyaminocarbonyl, alkoxyaminothiocarbonyl, alkoxycarbonyl, alkoxythiocarbonyl, thioalkoxycarbonyl, thioalkoxythiocarbonyl, CO-R⁷, CS-R⁷, alkylsulfonyl or haloalkylsulfonyl; or alternatively

R⁵ and R⁶ when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;

or the group consisting of the heterocycles G1 to G9:



Z which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylsulfonyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;

5 k¹ represents 0, 1, 2, 3 or 4;

k² represents 0, 1, 2 or 3;

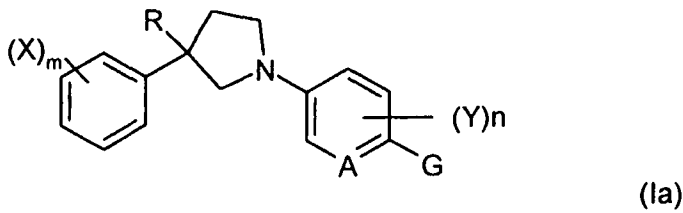
k³ represents 0, 1 or 2;

k⁴ represents 0 or 1;

10 R⁷ represents phenyl or heterocyclic ring, which are optionally substituted with at least one substituent selected from halogen and C₁₋₆ alkyl; and

A represents C or N.

Among the compounds of formula (I) of the invention, preferred compounds are compounds of formula (Ia)



15 wherein X, Y, R, A, G, Y, n and m are as defined above.

Among the compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the invention, further preferred compounds are those wherein

X which may be same or different, represents halogen, C₁₋₆ haloalkyl, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, C₁₋₆ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₆ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ alkylsulfonylamino or C₁₋₆ haloalkylsulfonylamino;

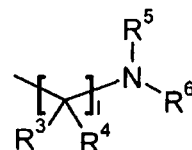
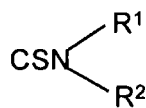
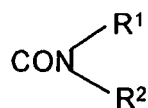
Y which may be same or different, represents halogen, C₁₋₆ haloalkyl, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, C₁₋₆ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₆ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ alkylsulfonylamino or C₁₋₆ haloalkylsulfonylamino;

R represents C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl;

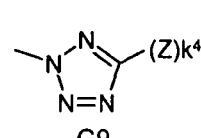
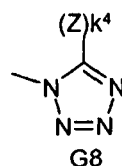
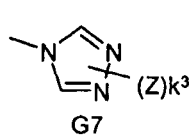
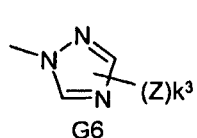
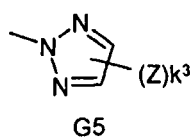
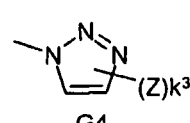
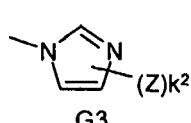
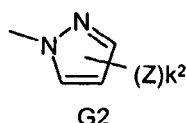
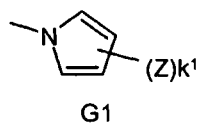
m represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;

15 n represents 0, 1, 2, or 4;

G is selected from the group consisting of



or group consisting of the G1 to G9:



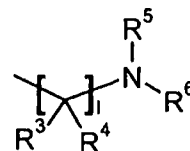
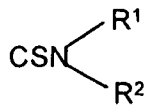
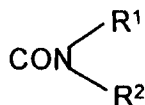
wherein

- R^1 and R^2 each independently represents hydrogen; optionally substituted C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl; C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl or CH_2-R^7 ; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;
- 5 R^3 and R^4 each independently represents hydrogen, cyano; optionally substituted C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl; or C_{1-6} alkoxy carbonyl; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;
- 1 l represents 1 or 2 or 3;
- R^5 represents hydrogen; C_{1-6} alkyl; optionally substituted C_{3-7} cycloalkyl; C_{1-6} haloalkyl; cyano; C_{2-6} alkenyl; C_{2-6} alkynyl; C_{1-6} alkylcarbonyl; or CH_2-R^7 ;
- 10 R^6 represents formyl, cyano, C_{1-6} alkylcarbonyl, C_{1-6} alkylthiocarbonyl, C_{1-6} haloalkylcarbonyl, C_{1-6} haloalkylthiocarbonyl, C_{1-6} alkylaminocarbonyl, C_{1-6} alkylaminothiocarbonyl, dialkylamino-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, dialkylaminothiocarbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, C_{1-6} alkoxyaminocarbonyl, C_{1-6} alkoxyaminothiocarbonyl, C_{1-6} alkoxy carbonyl, C_{1-6} alkoxythiocarbonyl, C_{1-6} thioalkoxy carbonyl, C_{1-6} thioalkoxythiocarbonyl, $CO-R^7$, $CS-R^7$, C_{1-6} alkylsulfonyl or C_{1-6} haloalkylsulfonyl; or
- 15 R^5 and R^6 when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;
- 20 Z which may be same or different, represents halogen, C_{1-6} haloalkyl, nitro, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy, cyano, C_{1-6} haloalkoxy, C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;
- k^1 represents 0, 1, 2, 3 or 4;
- 25 k^2 represents 0, 1, 2 or 3;
- k^3 represents 0 or 1;
- k^4 represents 0 or 1;
- R^7 represents phenyl or a heterocyclic ring, which are optionally substituted with at least one substituent selected from fluorine, chlorine, bromine, iodine and C_{1-6} alkyl; and

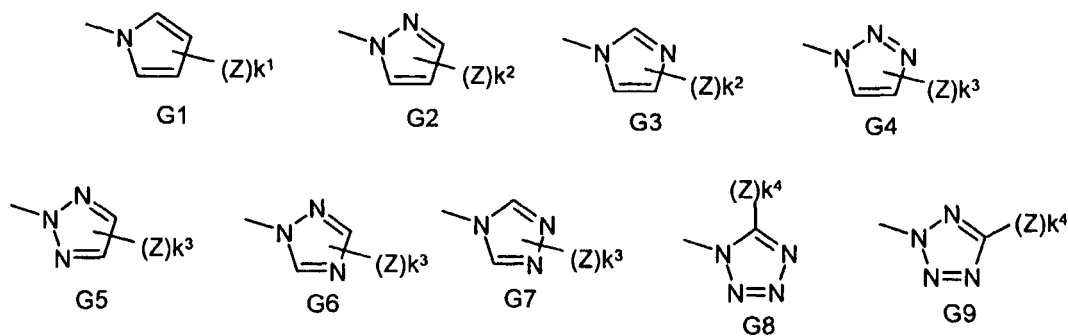
A represents C or N.

Further preferred compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the invention are such compounds wherein

- 5 X which may be same or different, represents halogen, C₁₋₆ haloalkyl, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, C₁₋₆ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₆ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ alkylsulfonylamino or C₁₋₆ haloalkylsulfonylamino;
- 10 Y which may be same or different, represents halogen, C₁₋₆ haloalkyl, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₆ alkylcarbonylamino, C₁₋₆ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₆ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₆ alkylsulfonylamino or C₁₋₆ haloalkylsulfonylamino;
- 15 R represents C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ haloalkyl;
- m represents 0, 1, 2 or 3;
- n represents 0, 1, 2 or 3;
- G is selected from the group consisting of



- 20 or the group consisting of the heterocycles G1 to G9:



R^1 and R^2 each independently represents hydrogen, C_{1-6} alkyl which may be substituted, C_{2-6} alkenyl which may be substituted, C_{2-6} alkynyl which may be substituted, C_{3-7} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl or CH_2-R^7 ; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

R^3 and R^4 each independently represents hydrogen, cyano, C_{1-6} alkyl which may be substituted, C_{2-6} alkenyl which may be substituted, C_{2-6} alkynyl which may be substituted, C_{3-7} cycloalkyl which may be substituted or C_{1-6} alkoxy-carbonyl; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

10 l represents 1 or 2;

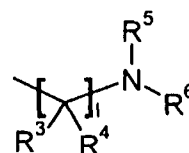
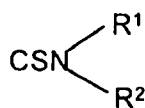
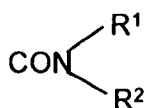
R^5 represents hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{3-7} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-6} haloalkyl, cyano, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{1-6} alkyl-carbonyl or CH_2-R^7 ;

R^6 represents formyl, cyano, C_{1-6} alkyl-carbonyl, C_{1-6} alkylthio-carbonyl, C_{1-6} haloalkyl-carbonyl, C_{1-6} haloalkylthio-carbonyl, C_{1-6} alkylamino-carbonyl, C_{1-6} alkylaminothio-carbonyl, dialkylamino-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, dialkylaminothio-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, C_{1-6} alkoxyamino-carbonyl, C_{1-6} alkoxyaminothio-carbonyl, C_{1-6} alkoxy-carbonyl, C_{1-6} alkoxythio-carbonyl, C_{1-6} thioalkoxy-carbonyl, C_{1-6} thioalkoxythio-carbonyl, $CO-R^7$, $CS-R^7$, C_{1-6} alkylsulfonyl or C_{1-6} haloalkylsulfonyl; or alternatively

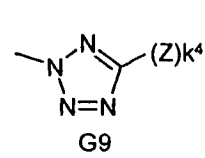
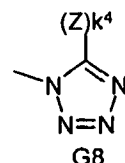
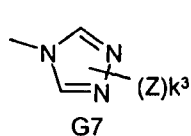
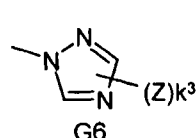
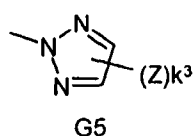
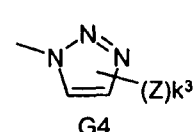
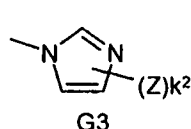
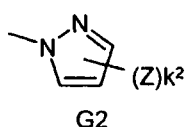
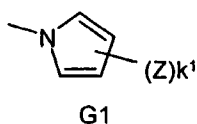
20 R^5 and R^6 when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;

- Z which may be same or different, represents halogen, C₁₋₆ haloalkyl, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, cyano, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;
- k¹ represents 0, 1, 2 or 3;
- 5 k² represents 0, 1 or 2;
- k³ represents 0 or 1;
- k⁴ represents 0 or 1;
- R⁷ represents phenyl or a heterocyclic ring, which are optionally substituted with at least one substituent selected from fluorine, chlorine, bromine, and C₁₋₆ alkyl; and
- 10 A represents C or N.
- Among those compounds of the formula (I) or formula (Ia), particularly preferable are compounds wherein
- 15 X which may be same or different, represents halogen, C₁₋₄ haloalkyl, nitro, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, cyano, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₄ alkyl-carbonylamino, C₁₋₄ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₄ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₄ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₄ alkylsulfonylamino or C₁₋₄ haloalkylsulfonylamino;
- 20 Y which may be same or different, represents halogen, C₁₋₄ haloalkyl, nitro, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, cyano, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C₁₋₄ alkyl-carbonylamino, C₁₋₄ haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C₁₋₄ alkoxy-carbonylamino, C₁₋₄ haloalkoxy-carbonylamino, C₁₋₄ alkylsulfonylamino or C₁₋₄ haloalkylsulfonylamino;
- 25 R represents C₁₋₄ alkyl or C₁₋₄ haloalkyl;
- m represents 0, 1, 2 or 3;
- n represents 0, 1, 2 or 3;
- G is selected from the group consisting of

- 9 -



or the group consisting of the heterocycles G1 to G9:



R^1 and R^2 each independently represents hydrogen, C_{1-4} alkyl which may be substituted, C_{2-4} alkenyl which may be substituted, C_{2-4} alkynyl which may be substituted, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-4} alkylsulfonyl, C_{1-4} haloalkylsulfonyl or $\text{CH}_2\text{-R}^7$; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

R^3 and R^4 each independently represents hydrogen, cyano, C_{1-4} alkyl which may be substituted, C_{2-4} alkenyl which may be substituted, C_{2-4} alkynyl which may be substituted, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted or C_{1-4} alkoxy-carbonyl; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

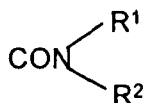
l represents 1 or 2;

R^5 represents hydrogen, C_{1-4} alkyl, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-4} haloalkyl, cyano, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, C_{1-4} alkyl-carbonyl or $\text{CH}_2\text{-R}^7$;

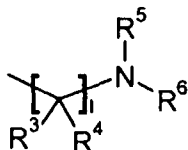
R^6 represents formyl, cyano, C_{1-4} alkyl-carbonyl, C_{1-4} alkylthio-carbonyl, C_{1-4} haloalkyl-carbonyl, C_{1-4} haloalkylthiocarbonyl, C_{1-4} alkylamino-carbonyl, C_{1-4} alkylaminothio-carbonyl, dialkylamino-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, dialkylaminothio-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, C_{1-4} alkoxyamino-carbonyl, C_{1-4} alkoxyaminothio-carbonyl, C_{1-4} alkoxy-carbonyl, C_{1-4} alkoxythio-carbonyl, C_{1-4} thioalkoxy-carbonyl, C_{1-4} thioalkoxythio-carbonyl, CO-R^7 , CS-R^7 , C_{1-4} alkylsulfonyl or C_{1-4} haloalkylsulfonyl; or alternatively

- R⁵ and R⁶ when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;
- 5 Z which may be same or different, represents halogen, C₁₋₄ haloalkyl, nitro, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, cyano, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;
- k¹ represents 0, 1, 2 or 3;
- k² represents 0, 1 or 2;
- 10 k³ represents 0 or 1;
- k⁴ represents 0 or 1;
- R⁷ represents phenyl or a heterocyclic ring, which are optionally substituted with at least one substituent selected from fluorine, chlorine, bromine, and C₁₋₄ alkyl; and
- In an embodiment of the invention the compounds of the the formula (I) or formula (Ia) are
- 15 compounds wherein
- X which may be same or different, represents chlorine, fluorine, bromine, trifluormethyl, difluormethyl, fluormethyl, nitro, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, t-butyl, 2-methyl-propyl, methoxy, ethoxy, propoxy, i-propoxy, n-butoxy, t-butoxy, 2-methyl-propoxy, cyano, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, fluormethoxy, thiomethyl, thioethyl,
- 20 thiopropyl, thio-i-propyl, thiobutyl, thio-t-butyl, 2-methyl-thiopropyl, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, propylsulfinyl, i-propylsulfinyl, butylsulfinyl, t-butylsulfinyl, 2-methyl-propylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, propylsulfonyl, i-propylsulfonyl, butylsulfonyl, t-butylsulfonyl, 2-methyl-propylsulfonyl, trifluoromethylthio, trifluoromethylsulfinyl, trifluoromethylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino,
- 25 methylcarbonylamino, ethylcarbonylamino, propylcarbonylamino, i-propylcarbonylamino, butylcarbonylamino, t-butylcarbonylamino, 2-methyl-propylcarbonylamino, benzoylamino, methoxy-carbonylamino, ethoxy-carbonylamino, propoxy-carbonylamino, i-propoxy-carbonylamino, butyloxy-carbonylamino, t-butyloxy-carbonylamino, 2-methyl-propoxy-carbonylamino, trifluoromethoxycarbonylamino, C₁₋₄ alkylsulfonylamino or C₁₋₄
- 30 haloalkylsulfonylamino;

- Y which may be same or different, represents chlorine, fluorine, bromine, iodine, trifluormethyl, difluormethyl, fluormethyl, nitro, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, t-butyl, 2-methyl-propyl, methoxy, ethoxy, propoxy, i-propoxy, n-butoxy, t-butoxy, 2-methyl-propoxy, cyano, trifluormethoxy, difluormethoxy, fluormethoxy, thiomethyl, thioethyl, thiopropyl, thio-i-propyl, thiobutyl, thio-t-butyl, 2-methyl-thiopropyl, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, propylsulfinyl, i-propylsulfinyl, butylsulfinyl, t-butylsulfinyl, 2-methyl-propylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, propylsulfonyl, i-propylsulfonyl, butylsulfonyl, t-butylsulfonyl, 2-methyl-propylsulfonyl, trifluormethylthio, trifluormethylsulfinyl, trifluormethylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, trifluormethylcarbonylamino, methylcarbonylamino, ethylcarbonylamino, propylcarbonylamino, i-propylcarbonylamino, butylcarbonylamino, t-butylcarbonylamino, 2-methyl-propylcarbonylamino, 2,2,2-trichlorethylcarbonylamino, benzoylamino, methoxy-carbonylamino, ethoxy-carbonylamino, propoxy-carbonylamino, i-propoxy-carbonylamino, butyloxy-carbonylamino, t-butyloxy-carbonylamino, 2-methyl-propoxy-carbonylamino, trifluormethoxycarbonylamino, C₁₋₄ alkylsulfonylamino or C₁₋₄ haloalkylsulfonylamino;
- R represents methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, t-butyl, 2-methyl-propyl or trifluormethyl, difluormethyl, fluormethyl;
- m represents 0, 1, 2 or 3;
- n represents 0, 1, 2 or 3;
- G represents:

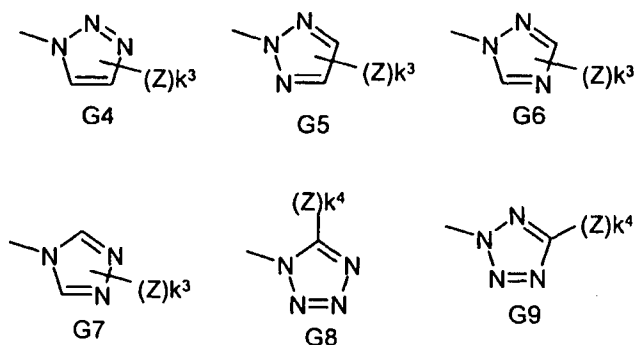


or



- or alternatively represents the following heterocycles of G1-G9:

- 12 -



5 R^1 and R^2 each independently represents hydrogen, C_{1-4} alkyl which may be substituted, C_{2-4} alkenyl which may be substituted, C_{2-4} alkynyl which may be substituted, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-4} alkylsulfonyl, C_{1-4} haloalkylsulfonyl or CH_2-R^7 ; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

R^3 and R^4 each independently represents hydrogen, cyano, C_{1-4} alkyl which may be substituted, C_{2-4} alkenyl which may be substituted, C_{2-4} alkynyl which may be substituted, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted or C_{1-4} alkoxy-carbonyl; or when taken together represent C_{3-5} alkylene;

10 I represents 1 or 2;

R^5 represents hydrogen, C_{1-4} alkyl, C_{3-6} cycloalkyl which may be substituted, C_{1-4} haloalkyl, cyano, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, C_{1-4} alkyl-carbonyl or CH_2-R^7 ;

15 R^6 represents formyl, cyano, C_{1-4} alkyl-carbonyl, C_{1-4} alkylthio-carbonyl, C_{1-4} haloalkyl-carbonyl, C_{1-4} haloalkylthio-carbonyl, C_{1-4} alkylamino-carbonyl, C_{1-4} alkylaminothio-carbonyl, dialkylamino-carbonyl having from 2 to 6 carbon atoms, dialkylaminothio-carbonyl having from 2 to 6 carbon atoms, C_{1-4} alkoxyamino-carbonyl, C_{1-4} alkoxyaminothio-carbonyl, C_{1-4} alkoxy-carbonyl, C_{1-4} alkoxythio-carbonyl, C_{1-4} thioalkoxy-carbonyl, C_{1-4} thioalkoxythio-carbonyl, $CO-R^7$, $CS-R^7$, C_{1-4} alkylsulfonyl or C_{1-4} haloalkylsulfonyl; or alternatively

20 Z which may be same or different, represents chlorine, bromine or iodine, trifluormethyl, nitro, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, t-butyl, 2-methyl-propyl, cyano;

k^3 represents 0 or 1;

k^4 represents 0 or 1;

R⁷ represents phenyl which may be substituted or a heterocyclic ring selected from the group consisting of pyridyl, pyrrolidinyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, tetrazolyl, pyrimidinyl, and triazinyl which may be substituted, wherein the substituent is at least one selected from chlorine, bromine, iodine and methyl, ethyl, i-propyl, n-propyl, 2-methyl
5 propyl, n-butyl and t-butyl; and

A represents C.

The compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the present invention have asymmetric carbons, and thus encompass optical isomers.

As used herein, "alkyl" refers to linear or branched C₁₋₁₂ alkyl such as methyl, ethyl, n- or iso-
10 propyl, 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 refers to C₁₋₆ alkyl.

As used herein, "haloalkyl" refers to alkyl groups having 1 to 12 carbonatoms, preferably 1 to 6 or
1 to 4 carbon atoms in which at least on hydrogen atom is exchanged by a halogen. Suitable
haloalkyls are for example CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₂Cl, CFCI₂, CF₂Br, CF₂CF₃, CFHCF₃,
15 CH₂CF₃, CFCICF₃, CCI₂CF₃, CF₂CH₃, CF₂CH₂F, CF₂CHF₂, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂Br,
CFHCH₃, CFHCH₂F, CFHCHF₂, CHFCF₃, CHFCF₂Cl, CHFCF₂Br, CH₂CF₃, CFCICF₃,
CCI₂CF₃, CF₂CF₂CF₃, CH₂CF₂CF₃, CF₂CH₂CF₃, CF₂CF₂CH₃, CHFCF₂CF₃, CF₂CHFCF₃,
CF₂CF₂CHF₂, CF₂CF₂CH₂F, CF₂CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₂Br. The haloalkyl moiety can be
substituted by at least one suitable substituent.

20 As used herein, "alkoxy" refers to alkoxy groups having 1 to 12 carbonatoms, preferably 1 to 6 or
1 to 4 carbon atoms. Suitable alkoxy groups are for example methoxy, ethoxy, n-propoxy, i-
propoxy, n-, iso-, sec- oder tert-butoxy, pentyloxy, oder hexyloxy. The alkoxy moiety can be
substituted by at least one suitable substituent.

Each alkyl moiety in each group having alkyl as a part of its configuration may additionally be
25 illustrated by those same as described for "alkyl" above.

"Acylamino" represents, for example, alkylcarbonylamino, cyclopropylcarbonylamino and
benzoylamino, wherein alkyl moiety may be illustrated by those same as described for "alkyl"
above.

"Halogen" and each halogen moiety in each group substituted with halogen refer to fluorine,
30 chlorine, bromine and iodine, preferably refer to fluorine, chlorine or bromine.

"Cycloalkyl" refers to C₃₋₈ cycloalkyl such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl, preferably refers to C₃₋₇ cycloalkyl.

"Alkenyl" refers to C₂₋₅ alkenyl such as vinyl, allyl, 1-propenyl, 1- (or 2- or 3-) butenyl, 1-pentenyl, preferably refers to C₂₋₄ alkenyl.

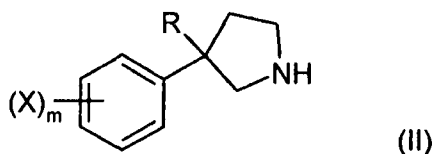
- 5 "Alkynyl" refers to C₂₋₅ alkynyl such as ethynyl, propargyl, 1-propynyl, butane-3-ynyl, pentane-4-ynyl and the like, preferably refers to C₂₋₄ alkynyl.

A "heterocyclic group" refers to a 5 or 6-membered heterocyclic group containing at least one hetero atom selected from N, O or S, wherein said ring also refers to a condensed heterocyclic group which may be benzo-condensed.

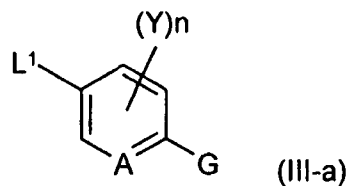
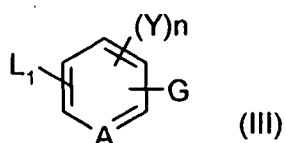
- 10 Heterocyclic groups are for example furyl, thienyl, pyrrolyl, isoxazolyl, pyrazolyl, oxazolyl, oxathiazolyl, imidazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrrolidinyl, pyrimidinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl, indolyl, benzoxazolyl, quinolyl and the like.

The compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the invention may be obtained, for example, by the preparation methods (a) to (j) described below.

- 15 Preparation method (a) comprises reacting a compound of formula (II)



wherein X, R and m have the same meanings as defined herein, with a compound of formula (III) or formula (III-a)



wherein

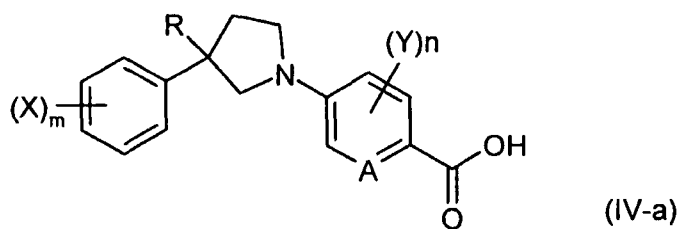
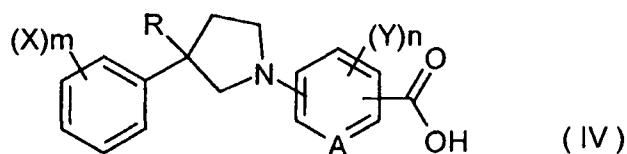
- 5 Y, A, G and n have the same meanings as defined herein,

L¹ represents halogen or a C₁-C₄ haloalkylsulfonyloxy group.

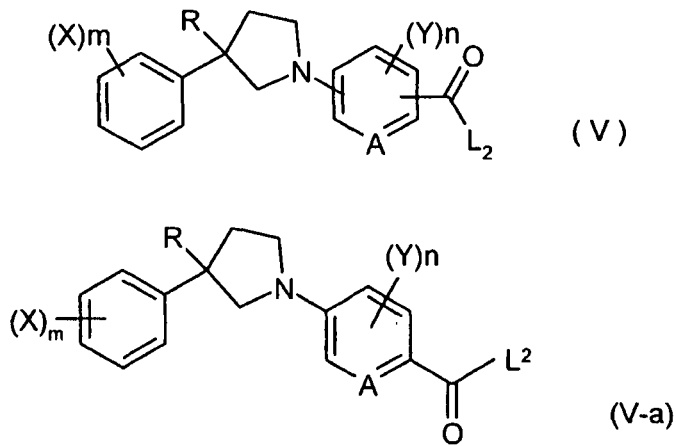
In an embodiment of the preparation method (a), the compounds of formula (II) and formula (III) or or formula (III-a) are reacted in the presence of a base or in the presence of at least one metallic catalyst.

- 10 Preparation methods (b) and (c) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for a group -CONR¹R² :

Method (b) comprises reacting a compound represented by the formula (IV) or formula (IV-a)

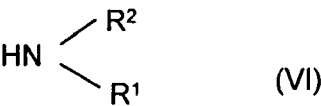


- 15 wherein X, Y, R, A, m and n have the same meanings as defined herein, or
a compound represented by the formula (V) or formula (V-a)



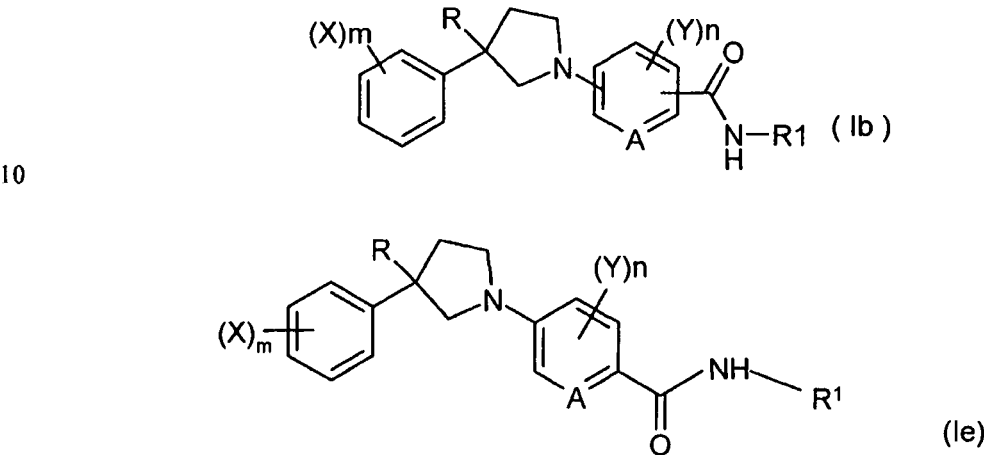
wherein X, Y, R, A, m and n have the same meanings as defined herein and L² represents chlorine, bromine, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, C₁₋₄ alkoxy carbonyloxy or azolyl,

5 with a compound represented by the formula (VI):



wherein R¹ and R² have the same meanings as defined herein, using a condensation agents, if desired, in the presence of base.

Method (c) comprises reacting a compound represented by the formula (Ib) or formula (Ie):



10 wherein X, Y, R, R¹, A, m and n have the same meanings as defined herein,

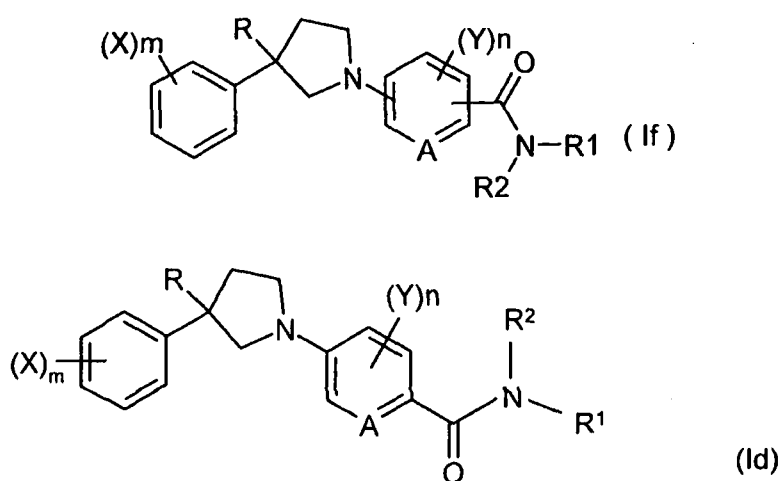
- 17 -

with a compound represented by the formula:

R^2-L^3 (VII), wherein R^2 has the same meaning as defined herein and L^3 represents chlorine, bromine, iodine, C_{1-4} alkylsulfonyloxy, C_{1-4} haloalkylsulfonyloxy, arylsulfonyloxy or azolyl, if desired, in the presence of base.

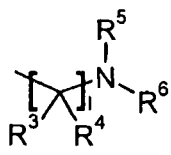
- 5 Preparation method (d) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for a group $-CSNR^1R^2$:

Method (d) comprises reacting a compound represented by the formula (If) or formula (Id):

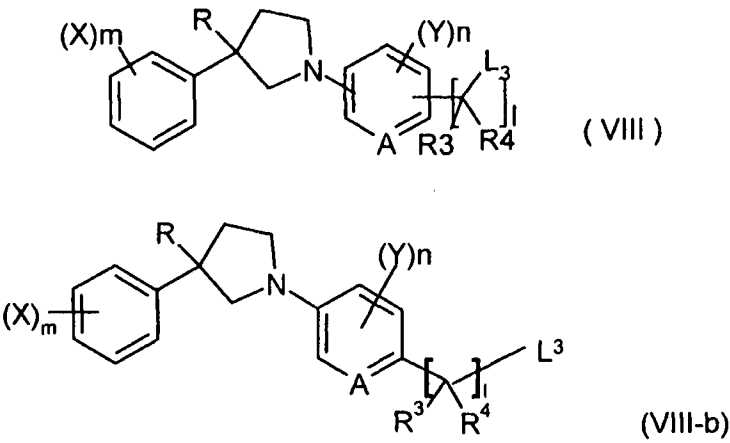


- 10 wherein X, Y, R, R^1 , R^2 , A, m and n have the same meanings as defined herein, with sulfating agents.

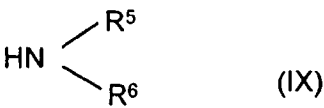
Preparation methods (e), (f) and (g) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for



- 15 Method (e) comprises reacting a compound represented by the formula (VIII) or formula (VIII-b):

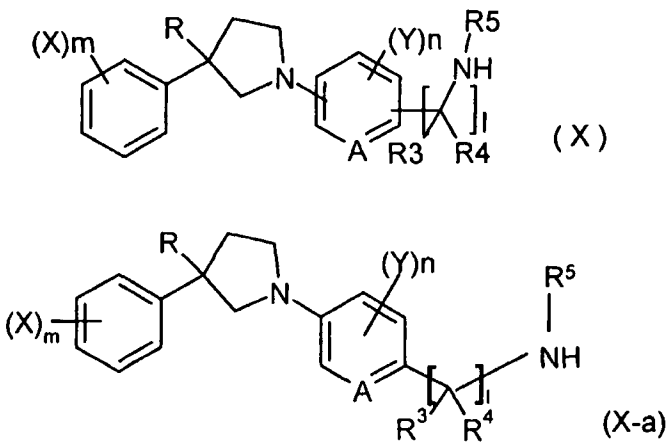


wherein X, Y, R, R³, R⁴, A, l, m, n and L³ have the same meanings as defined herein, with a compound represented by the formula (IX):

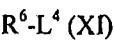


wherein R⁵ and R⁶ have the same meanings as defined herein, if desired, in the presence of base.

Method (f) comprises reacting a compound represented by the formula (X) or formula (X-a):

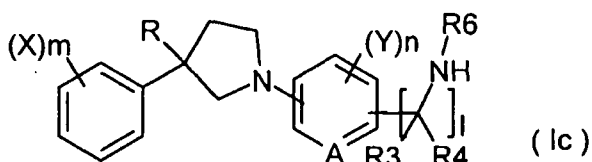


wherein X, Y, R, R³, R⁴, R⁵, A, l, m and n have the meanings as defined herein, with a compound represented by the formula:

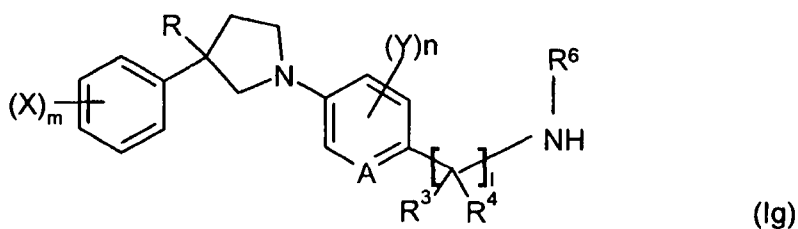


wherein R^6 has the same meanings as defined herein and L^4 represents fluorine, chlorine, bromine, C_{1-4} alkyl-carboxyloxy, C_{1-4} alkoxy-carboxyloxy, azolyl, C_{1-4} alkylsulfonyloxy, C_{1-4} haloalkylsulfonyloxy, arylsulfonyloxy, if desired, in the presence of base.

Method (g) comprises reacting a compound represented by the formula (Ic) or formula (Ig):



5



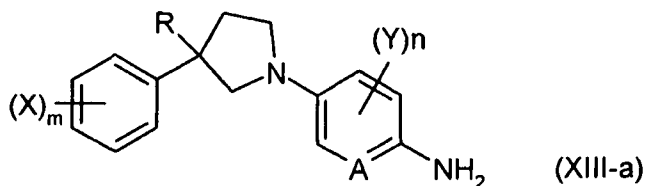
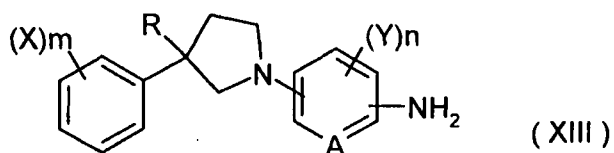
wherein X, Y, R, R^3 , R^4 , R^6 , A, l, m and n have the same meanings as defined herein, with a compound represented by the formula

R^5-L^4 (XII),

10 wherein R^5 and L^4 have the same meanings as defined herein, if desired, in the presence of base.

Preparation method (h) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for G1, G6 or G8:

Method (h) comprises reacting a compound represented by the formula (XIII) or formula (XIII-a):

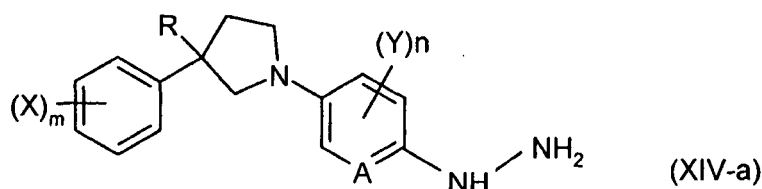
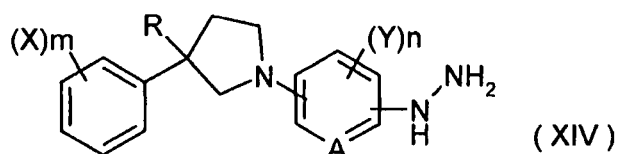


15

wherein X, Y, A, m and n have the same meanings as defined herein, with dialkoxytetrahydrofuran, 1,2-diformylhydrazine or sodium azide and trialkyl orthoformate.

Preparation method (i) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for G2:

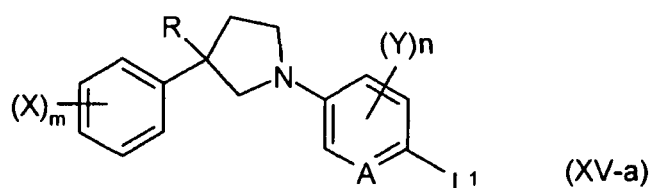
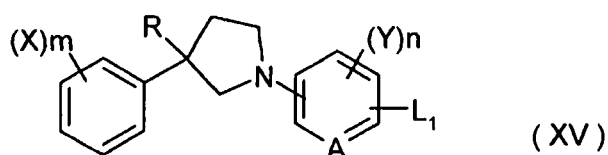
- 5 Method (i) comprises reacting a compound represented by the formula (XIV) or formula (XIV-a):



wherein X, Y, A, m and n have the same meanings as defined herein, with 1,1,3,3-tetraalkoxypropane.

- 10 Preparation method (j) for the preparation of compounds according to formula (I) or formula (Ia), wherein G stands for G2, G3, G4, G5, G6, G8 or G9:

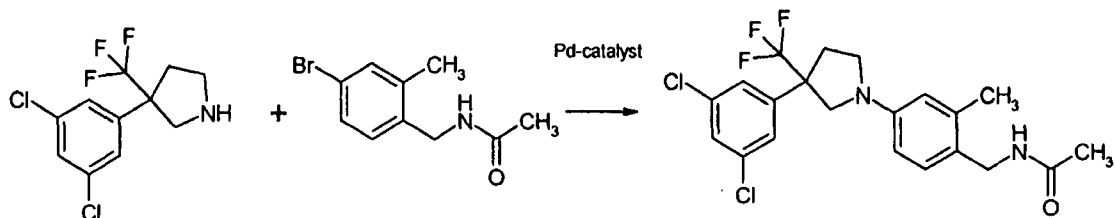
Method (j) comprises reacting a compound represented by the formula (XV) or formula (XV-a):



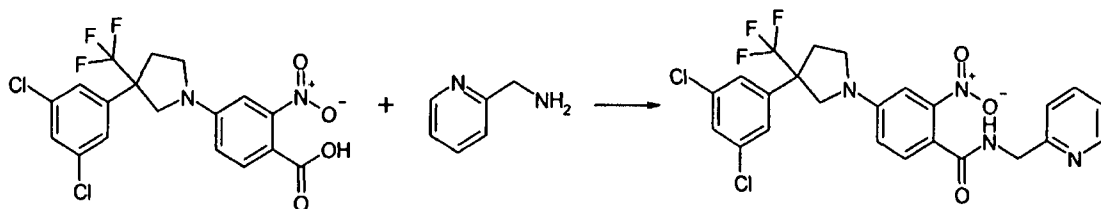
- 15 wherein X, Y, R, A, m, n and L¹ have the same meanings as defined herein, with the protonated groups named G2, G3, G4, G5, G6, G8 or G9, namely G2-H, G3-H, G4-H, G5-H, G6-H or G8-H.

According to the present invention, aryl pyrrolidines of the above formula (I) or formula (Ia) of the invention exhibit a potent insecticidal action.

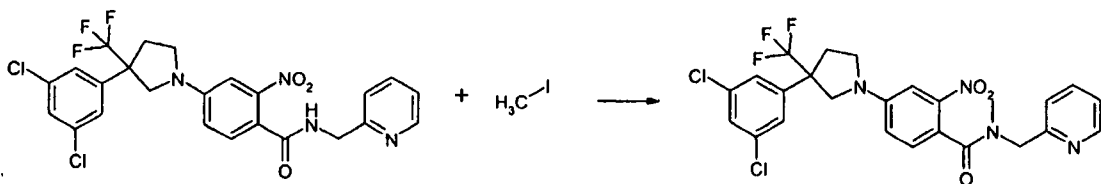
Above mentioned preparation method (a), when using, for example, 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine and N-(4-bromo-2-methylbenzyl)acetamide as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



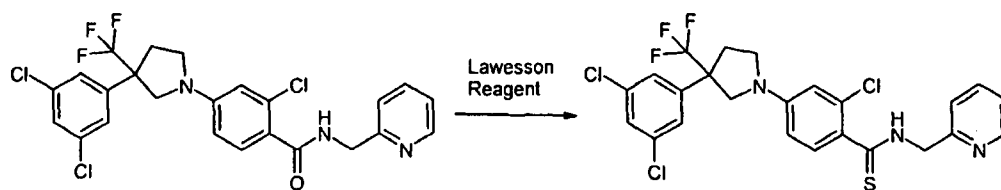
The preparation method (b), when using, for example, 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoic acid and 2-picolylamine as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



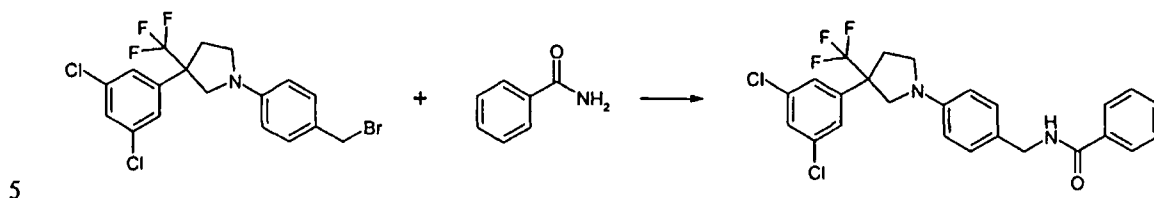
The preparation method (c), when using, for example, 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitro-N-(pyridine-2-yl-methyl)benzamide and iodomethane as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



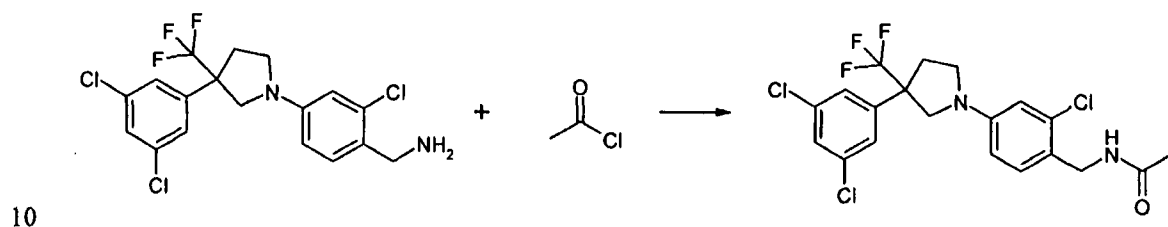
The preparation method (d), when using, for example, 2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-N-(pyridine-2-yl-methyl)benzamide and Lawesson reagent as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



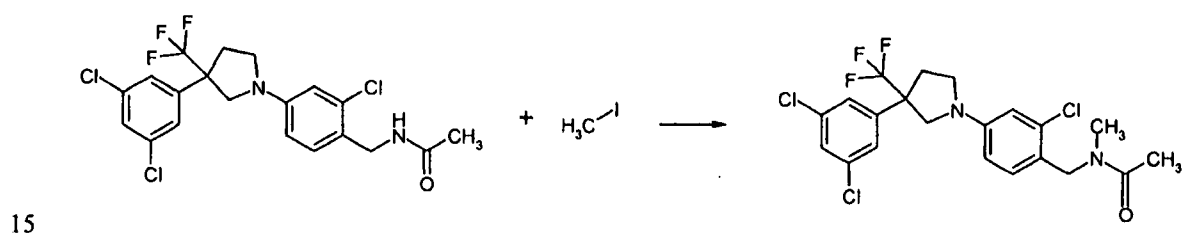
The preparation method (e), when using, for example, 1-[4-(bromomethyl)phenyl]-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine and benzamide as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



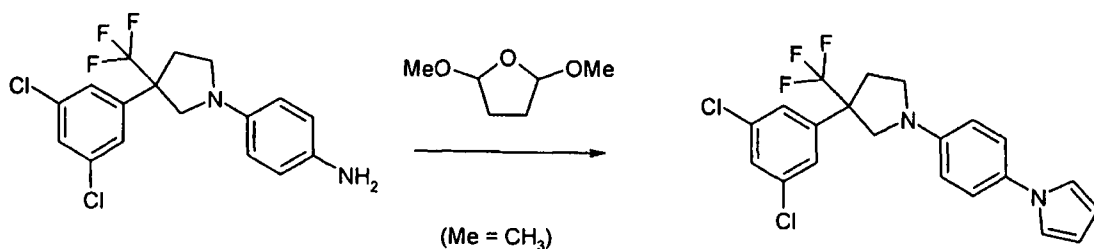
The preparation method (f), when using, for example, 1-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine and acetyl chloride as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



The preparation method (g), when using, for example, N-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]benzyl}acetamide and iodomethane as starting materials, may be represented by the reaction formula below.

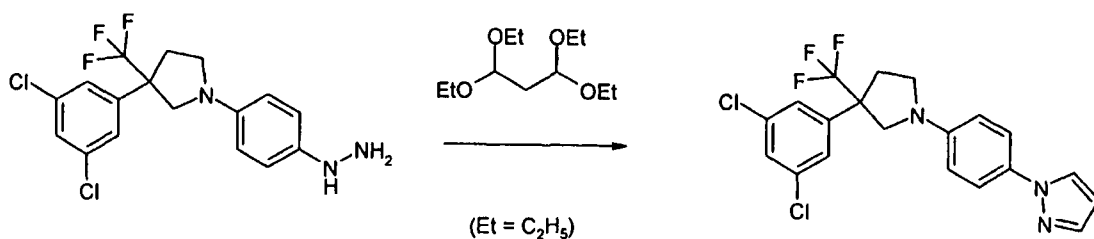


The preparation method (h), when using, for example, 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] aniline and 2,5-dimethoxytetrahydrofuran as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



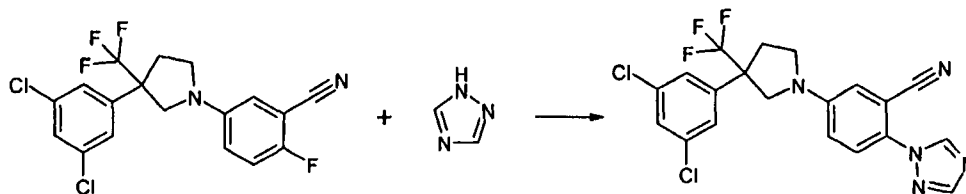
5

The preparation method (i), when using, for example, 3-(3,5-dichlorophenyl)-1-(4-hydrazinophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine and 1,1,3,3-tetraethoxypropane as starting materials, may be represented by the reaction formula below.

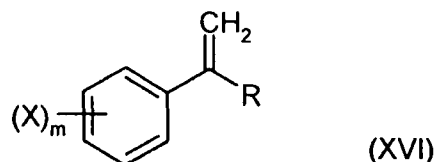


10

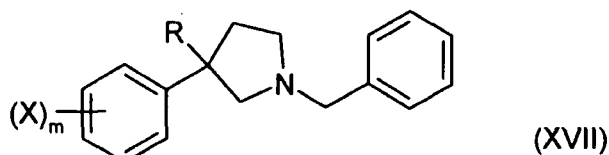
The preparation method (j), when using, for example, 5-(3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl)-2-fluorobenzonitrile and 1H-1,2,4-triazole as starting materials, may be represented by the reaction formula below.



- 15 Many of the compounds of the formula (II), which are the starting materials in the preparation method (a), are novel compounds and may be synthesized by the method described below. The compound represented by the formula (XVI):



wherein X, m and R have the same meanings as defined herein is reacted with, for example, N-benzyl-1-methoxy-N-[(trimethylsilyl)methyl]methanamine in the presence of catalysts to obtain the compound represented by the formula (XVII) below:



5

wherein X, m and R have the same meanings as defined herein, which is then debenzylated to obtain the compound of the formula (II).

Known compounds having formula (XVI) are for example described in "The Journal of Organic Chemistry, 1991, vol.56, pp.7336-7340"; "The Journal of Organic Chemistry, 1994, vol.59, pp.2898-2901"; "Journal of Fluorine Chemistry, 1999, vol.95, pp.167-170";
 10 "WO2005/05085216A". Such compounds may also be synthesized by the methods described in these publications.

Representative examples of the compounds of the formula (XVI) include [1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1-chloro-3-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1-bromo-3-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1-nitro-3-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1-trifluoromethyl-3-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1,3-dichloro-5-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1-fluoro-2-(trifluoromethyl)-4-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; 1,2,3-trichloro-5-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene; or 1,3-dimethyl-2-nitro-5-[1-(trifluoromethyl)vinyl]benzene.

20 Instead of N-benzyl-1-methoxy-N-[(trimethylsilyl)methyl] methanamine in the above reaction, N-benzyl-1-butoxy-N-[(trimethylsilyl)methyl] methanamine or N-(butoxymethyl)-N-[(trimethylsilyl)methyl] cyclohexylamine may be used. These are well known compounds.

The catalysts used in the above reaction may include trifluoroacetic acid, trimethylsilyl trifluoromethanesulfonate, iodotrimethylsilane, cesium fluoride and the like.

The above reaction may be performed according to the methods described in "Chemistry Letters, 1984, 1117-1120" and "Tetrahedron Letters, 1993,34,3279-3282", and the deprotection reaction such as debenzylation may be performed according to the methods described in "Journal of the Organic Chemistry, 1984,49,2081" and "PROTECTIVE GRUOS in ORGANIC CHEMISTRY
5 THIRD EDITION, JOHN WILEY & SONS,INC".

Representative examples of the compounds of the formula (II) in the preparation method (a) include: 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine; 3-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine; 3-(3,4,5-trichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine; 3-(3,5-dimethyl-4-nitrophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine.

10 Many of the compounds of the formula (III) or formula (III-a), which are the starting materials in the preparation method (a), are known compounds, which may be synthesized by the methods well known in organic chemistry.

Representative examples of the compounds of the formula (III) and formula (III-a), respectively, include: N-(4-bromobenzyl)acetamide, N-(4-iodobenzyl)acetamide.

15 The reaction of the preparation methods (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) and (j) may be performed in a suitable diluent such as aliphatic hydrocarbons (e.g. hexane, cyclohexane, heptane etc.), aliphatic halogenated hydrocarbons (e.g. dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane), aromatic hydrocarbons (e.g. benzene, toluene, xylene, chlorobenzene etc.), ethers (e.g. diethylether, dibutylether, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran, dioxane etc.), esters
20 (e.g. ethyl acetate, ethyl propionate etc.), amides (e.g. dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide (DMA), N-methylpyrrolidone etc.), nitriles (e.g. acetonitrile, propionitrile etc.), dimethylsulfoxide (DMSO), water or mixed solvents thereof.

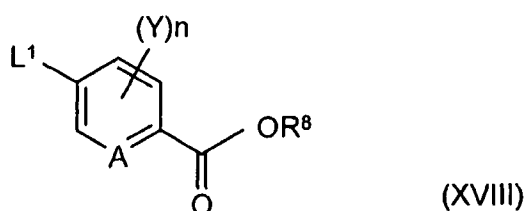
The reaction of the preparation methods (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) and (j) may be performed using the following bases such as alkali metal bases (e.g. lithium hydride, sodium
25 hydride, potassium hydride, butyl lithium, tert-butyl lithium, trimethylsilyl lithium, lithium hexamethyldisilazide, sodium carbonate, potassium carbonate, cesium carbonate, tripotassium phosphate, sodium acetate, potassium acetate, sodium methoxide, sodium ethoxide, sodium-tert-butoxide and potassium-tert-butoxide etc.), organic bases (e.g. triethylamine, diisopropylethylamine, tributylamine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline,
30 4-tert-butyl-N,N-dimethylaniline, pyridine, picoline, lutidine, diazabicycloundecene, diazabicyclooctane, imidazole etc.).

The preparation methods (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) and (j) may be performed within in wide temperature range. Generally, it may be performed at the temperature in the range from about -78 °C to about 200 °C, preferably from about -10 °C to about 150 °C. Said reaction is preferably performed at normal pressure although it may be performed under high pressure or reduced pressure. The reaction time is from 0.1 to 72 hours, preferably from 0.1 to 24 hours.

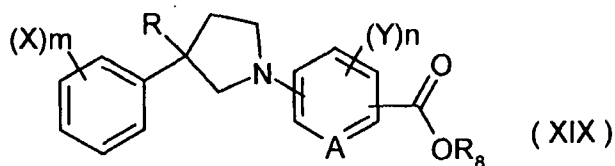
The reaction of preparation method (a) may also be performed using suitable metal catalysts such as transition metal catalysts like for example $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$, $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ (dba=dibenzylidene acetone), $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, CuI , or Cu_2O . If desired, it may be performed using phosphine ligands such as 2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthalene (BINAP), 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene (Xantphos) tributylphosphine and the like or amine ligands such as 8-quinolinol, proline, N,N-dimethylglycine and the like.

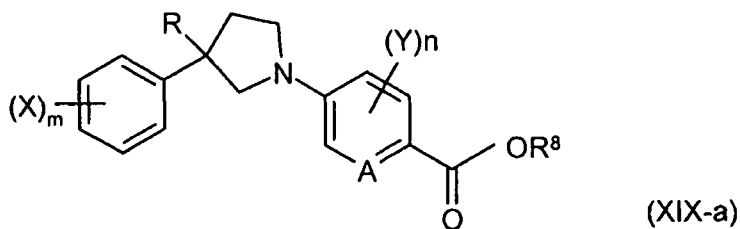
In performing the preparation method (a), for example, 1 mole of the compound of the formula (II) is reacted with 1 to 3 moles of the compound of the formula (III) or formula (III-a) in the presence of 1 to 3 moles of base and catalytic amount of $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ and Xantphos in a diluent such as toluene to obtain the respective compound of the formula (I) or formula (Ia) of the invention.

The compounds of the formula (IV) or formula (IV-a), which are used in the preparation method (b), are novel compounds. They can be synthesized by the methods described below. The compound of formula (II) may be reacted with a compound represented by the formula (XVIII):



wherein Y, A, n and L^1 have the same meanings as defined herein, R^8 represents hydrogen or C_{1-4} alkyl, to obtain a compound represented by the formula (XIX) or formula (XIX-a):





wherein X, Y, R, A, m, n and R⁸ have the same meanings as defined herein. When R⁸ represents C₁₋₄ alkyl, the compound of above formula (XIX) or formula (XIX-a) may be hydrolyzed to obtain the compound of the formula (IV) or formula (IV-a).

- 5 The compounds of the formula (XVIII) are known and include for example, the following compounds: methyl 4-iodobenzoate; methyl 4-bromo-2-methylbenzoate; ethyl 2-fluoro-4-iodobenzoate; methyl 2-chloro-4-iodobenzoate; methyl 2-bromo-4-iodobenzoate; methyl 4-fluoro-2-nitrobenzoate; and ethyl 4-fluoro-2-(trifluoromethyl) benzoate.

10 The compounds of the formula (V) or formula (V-a), which are the starting materials in the preparation method (b), are well known compounds.

For example, the compound of formula (IV) or formula (IV-a) may be easily obtained by the method comprising a reaction with a chlorinating agent such as thionyl chloride, oxalyl chloride or phosphorus pentachloride, or the method comprising a reaction with an organic halide such as pivaloyl chloride, or the method comprising a reaction with carbonyl diimidazole or sulfonyl imidazole etc.

15

Representative compounds of the formula (IV) and formula (IV-a), respectively, in the preparation method (b) include:

- 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] benzoic acid; 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] -2-nitrobenzoic acid; 4-{3-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl}-2-nitrobenzoic acid; 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] -2-(trifluoromethyl) benzoic acid and the like.
- 20

Representative compounds of the formula (V) and formula (V-a), respectively, include: 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] benzoyl chloride; 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoyl chloride; 4-{3-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl}-2-nitrobenzoyl chloride and the like.

25

The compounds of the formula (VI), which are the starting materials in the preparation method (b), are well known compounds.

Representative examples include: methylamine; ethylamine, cyclopropylamine, propargylamine, 2,2,2-trifluoroethylamine, 2-picolylamine, 3-aminomethyl-6-chloropyridine and the like.

The reaction of the preparation method (b) may be performed using the following condensation agents: 1,3-dicyclohexyl carbodiimide(DCC), 1-ethyl-3-(3'-dimethylaminopropyl)-carbodiimide
5 hydrochloride (WSCl), carbonyldiimidazole (CDI), diethyl cyanophosphate (DEPC), 2-chloro-1-methylpyridinium iodide (Mukouyama Reagent) and the like.

In performing the preparation method (b), for example, 1 mole of the compound of the formula (IV) or formula (IV-a) may be reacted with 1 to 3 moles of the compound of the formula (VI) using 1 mole to 3 moles of a condensation agent and, if desired, with catalytic amount of an
10 additive such as 1-hydroxybenzotriazole in a diluent (e.g. DMF) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

The compounds of the formula (Ib) or formula (Ie), which are the starting materials in the preparation method (c), are encompassed in the formula (I) or formula (Ia) of the present invention obtained by preparation method (b).

15 The compounds of the formula (VII), which are the starting materials are well known compounds and specific examples include iodomethane, iodoethane and the like.

In performing the preparation method (c), for example, 1 mole of the compound of the formula (Ib) or formula (Ie) may be reacted with 1 to 5 moles of the compound of the formula (VII) in the presence of base in a diluent (e.g. THF) to obtain the corresponding compound of the formula (I)
20 or formula (Ia).

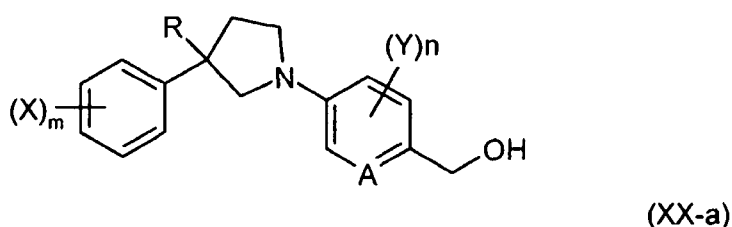
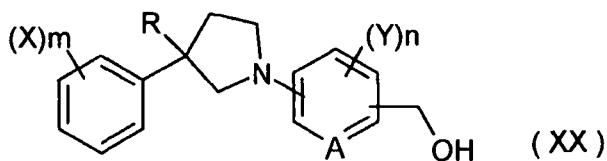
The compounds of the formula (If) or formula (Id), which are the starting materials in the preparation method (d), are encompassed in the formula (I) or formula (Ia) of the present invention obtained by above preparation method (b) or (c).

Sulfurizing agents used in the preparation method (d) may include phosphorus pentasulfide,
25 Lawesson reagent and the like.

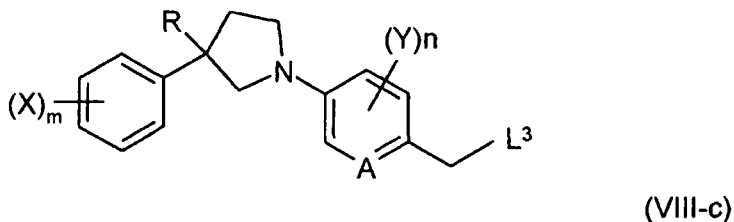
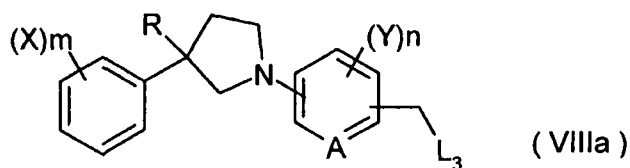
In performing the preparation method (d), for example, 1 mole of the compound of the general formula (If) or formula (Id) may be reacted with 0.5 to 3 moles of Lawesson reagent in a diluent (e.g. toluene) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

The compounds of the formula (VIII) or formula (VIII-b), which are the starting materials in the
30 preparation method (e), are novel compounds and may be synthesized by the method below. The

compound of above formula (XIX) or formula (XIX-a) may be reduced to obtain the compound represented by the formula (XX) or formula (XX-a):



- 5 wherein X, Y, R, A, m and n have the same meanings as defined herein, which may be then subjected to a reaction such as halogenation or alkylsulfonylation in the usual manner to obtain the compound represented by the formula (VIII-a) or (VIII-c):



- 10 wherein X, Y, R, A, m, n and L³ have the same definitions as above.

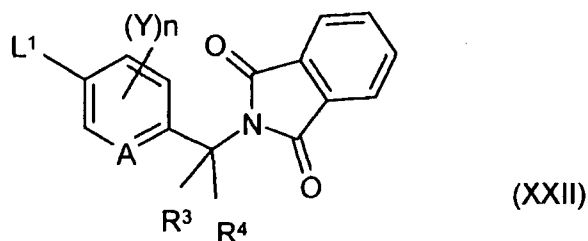
Representative examples of the compounds of the formula (VIII) and formula (VIII-b), respectively, in the preparation method (e) include: 1-[3-chloro-4-(chloromethyl)phenyl]-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine; 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl] benzylmethanesulfonate; 1-[3-bromo-4-(chloromethyl)phenyl]-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine and the like.

The compounds of the formula (IX), which are the starting materials in the preparation method (e), are well known compounds and representative examples include: acetoamide; propionamide; benzamide; 2-chlorobenzamide; 3-chlorobenzamide; 4-chlorobenzamide and the like.

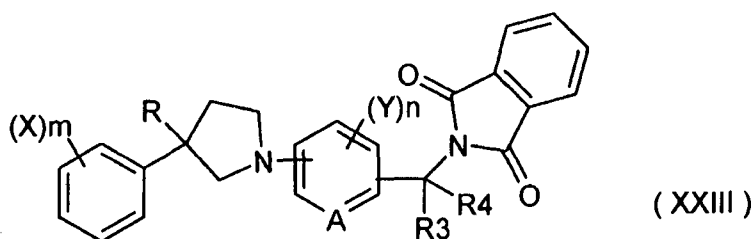
In performing the preparation method (e), for example, 1 mole of the compound of the formula (VIII) or formula (VIII-b) may be reacted with 1 to 3 moles of the formula (IX) in the presence of base in a diluent (e.g. THF) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

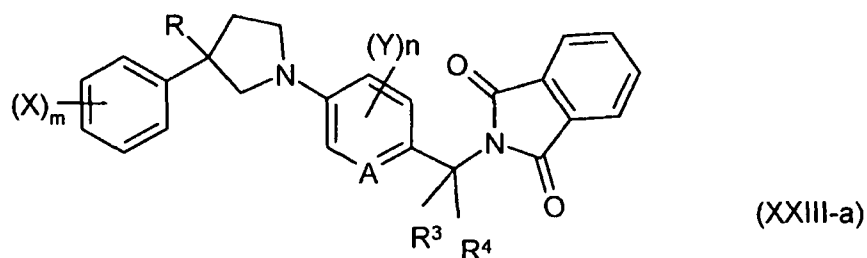
The compounds of the formula (X), or formula (X-a) which are the starting materials in the preparation method (f), are novel compound and may be obtained by reacting a compound of formula (VIII) or formula (VIII-b) with a compound R^5-NH_2 (XXI) wherein R_5 has the same meanings as defined herein.

The compounds of the formula (X) or formula (X-a) wherein l is 1 may be also synthesized by the alternative method comprising reacting a compound of above formula (II) with a compound represented by the formula (XXII):



wherein Y, A, R^3 , R^4 , n and L^1 have the same meanings as defined herein, to obtain the compound represented by the formula (XXIII) or formula (XXIII-a):

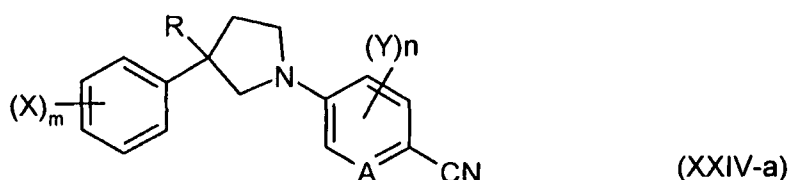
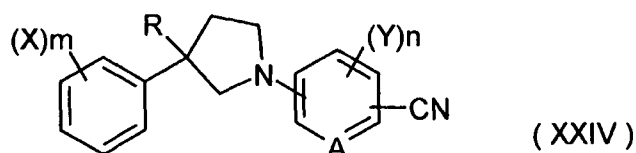




wherein X, Y, R, A, m, n, R³ and R⁴ have the same meanings as defined herein, which is then reacted according to Gabriel synthetic reaction.

The compounds of above formula (XXII) are known compounds and include: 2-(4-bromobenzyl)-1H-isoin-1,3-dione; 2-(4-bromo-2-nitrobenzyl)-1H-isoin-1,3-dione; 2-(4-iodobenzyl)-1H-isoin-1,3-dione; 2-(4-iodo-2-nitrobenzyl)-1H-isoin-1,3-dione; 2-(2-chloro-4-iodobenzyl)-1H-isoin-1,3-dione.

The compounds of the formula (X) or formula (X-a) wherein R³, R⁴ and R⁵ represent hydrogen may be easily synthesized by the alternative method comprising usual reduction reaction of the nitrile compound represented by the formula (XXIV) or formula (XXIV-a):



wherein X, Y, R, m and n have the same meanings as defined herein.

The compounds of above formula (XXIV) or formula (XXIV-a) are novel compounds and may be obtained as shown in the synthetic example 8 described below.

Representative examples of the compounds of the formula (X) and formula (X-a), respectively, in the preparation method (f) include: 1-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine; 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine and the like.

The compounds of the formula (XI), which are the starting materials in the preparation method (f), are well known compounds, and the specific examples include: acetyl chloride; propionyl chloride; benzoyl chloride; 2-chlorobenzoyl chloride; 3-chlorobenzoyl chloride; 4-chlorobenzoyl chloride; nicotinoylchloride hydrochloride and the like.

- 5 In performing the preparation method (f), for example, 1 mole of the compound of the formula (X) formula (X-a) may be reacted with 1 to 3 moles of the formula (XI) in the presence of base in a diluent (e.g. THF) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

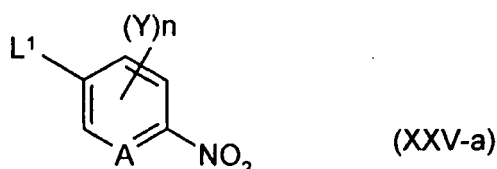
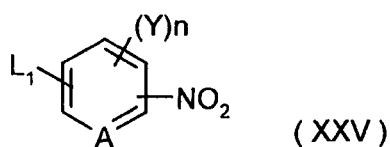
The compounds of the formula (Ic) or formula (Ig), which are the starting materials in the preparation method (g), are encompassed in the formula (I) or formula (Ia) of the present invention
10 obtained by above preparation method (e) or (f).

The compounds of the formula (XII), which are the starting materials are well known and the specific examples include iodomethane, iodoethane, acetyl chloride and the like.

- In performing the preparation method (g), for example, 1 mole of the compound of the formula (Ic) or formula (Ig) may be reacted with 1 to 3 moles of the formula (XII) in the presence of base in a
15 diluent (e.g. THF) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

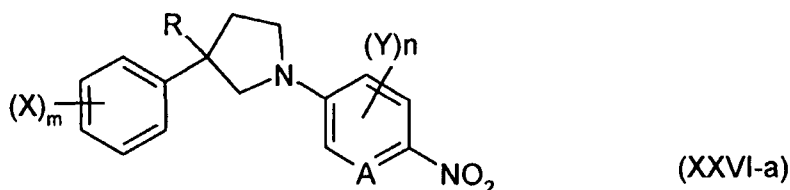
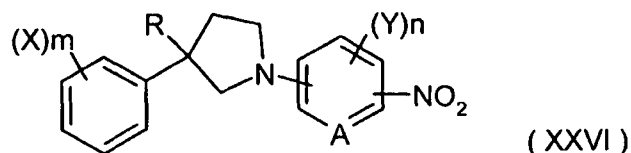
The compounds of the formula (XIII) or formula (XIII-a), which are the starting materials in the preparation method (h), are novel compounds and may be synthesized by the method described below.

- More specifically, the compound of above formula (II) is reacted with a compound represented by
20 the formula (XXV) or formula (XXV-a):



wherein Y, A, n and L¹ have the same meanings as defined herein, to obtain a compound represented by the formula (XXVI) or formula (XXVI-a) :

- 33 -



wherein X, Y, R, A, m and n have the same meanings as defined herein, which is then reduced to obtain the compound of the formula (XIII) or formula (XIII-a).

- 5 The specific examples of compounds of formula (XXV) and formula (XXV-a) include: 2-fluoro-4-nitrobenzene; 2-bromo-4-nitrobenzene; 2-iodo-4-nitrobenzene; 2-bromo-4-fluoronitrobenzene; 4-fluoro-2-methylnitrobenzene and the like.

Representative examples of the compounds of the formula (XIII) and formula (XIII-a), respectively, in the preparation method (h) include: 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]aniline; 2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]aniline and the like.

10

Dialkoxy tetrahydrofurans, which are the starting materials in the preparation method (h), are known compounds and the specific examples include: 2,5-dimethoxytetrahydrofuran; 2,5-diethoxytetrahydrofuran and the like.

- 15 In performing above preparation method (h), for example, 1 mole of the compound of the formula (XIII) or formula (XIII-a) may be reacted with 1 to 5 moles of 2,5-dimethoxytetrahydrofuran in a diluent (e.g. acetic acid) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia) of the present invention.

In the preparation method (h), said reaction, when using 1,2-diformylhydrazine, may be performed in the presence of base and trialkylhalosilane.

20

The examples of the base may include organic bases such as triethylamine, diisopropylethylamine, tributylamine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, 4-tert-butyl-N,N-dimethylaniline, pyridine, picoline, lutidine, diazabicycloundecene, diazabicyclooctane, imidazole etc.

Representative examples of trialkylhalosilanes include: trimethylchlorosilane; triethylchlorosilane; trimethylbromosilane and the like.

In performing the preparation method (h), 1 mole of the compound of the formula (XIII) or formula (XIII-a) may be reacted with 1 to 5 moles of 1,2-diformylhydrazine, 1 to 10 moles of base
5 and 1 to 25 moles of trialkylhalosilane in great excess amount of pyridine to obtain the desired corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia).

In the case of the reaction of sodium azide with trialkyl orthoformate in the preparation method (h), the examples of trialkyl orthoformates may include trimethyl orthoformate and triethyl orthoformate and the like.

10 In performing the preparation method (h), 1 mole of the compound of the formula (XIII) or formula (XIII-a) may be reacted with 1 to 3 moles of sodium azide and 1 to 10 moles of trialkyl orthoformate in a diluent (e.g. acetic acid) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia) of the invention.

The compounds of the formula (XIV) or formula (XIV-a), which are the starting materials in the
15 preparation method (i), are novel compounds and may be synthesized by the method described below. More specifically, the compound of above formula (XIII) or formula (XIII-a) is subjected to Sandmeyer's reaction, which is known in the field of organic chemistry, followed by reduction to obtain the compound of the formula (XIV) or formula (XIV-a).

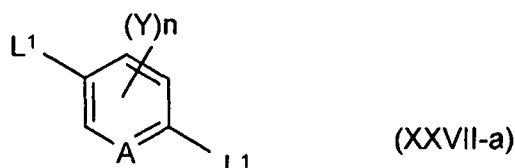
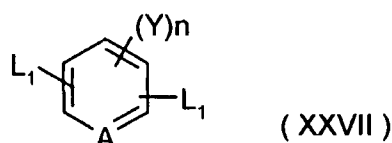
Representative examples of the compounds of the formula (XIV) and formula (XIV-a),
20 respectively may include: 3-(3,5-dichlorophenyl)-1-(4-hydrazinophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine; 3-(3,5-dichlorophenyl)-1-(4-hydrazino-3-methylphenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine and the like.

2,5-Dialkoxy tetrahydrofurans, which are used as starting material in the preparation method (i), are known compounds and representative examples include: 1,1,3,3-tetramethoxypropane; 1,1,3,3-
25 tetraethoxypropane and the like.

In performing above preparation method (i), for example, 1 mole of the compound of the formula (XIV) or formula (XIV-a) may be reacted with 1 to 5 moles of 1,1,3,3-tetraalkoxypropane with, if desired, addition of catalytic amount of acid such as sulfuric acid in a diluent (e.g. ethanol) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia) of the invention.

30 The compounds of the formula (XV) or formula (XV-a), which are the starting material in the preparation method (j), are novel compounds and may be synthesized by the method described

below. More specifically, the compound of above formula (II) is reacted with a compound represented by the formula (XXVII) or formula (XXVII-a)



- 5 wherein Y, A, n and L¹ have the same meanings as defined herein, to obtain the compound of the formula (XV) or formula (XV-a).

The specific examples of compounds of above formula (XXVII) and formula (XXVII-a), respectively, include: 2-fluoro-5-iodobenzonitrile; 5-bromo-2-fluorobenzonitrile; 1-chloro-4-iodo-2-nitrobenzene; 1,4-dibromobenzene; 1,4-diiodo benzene and the like.

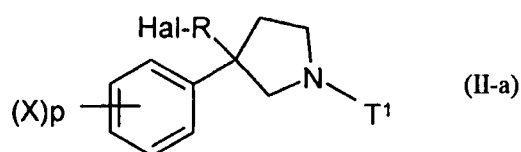
- 10 Representative examples of the compounds of the formula (XV) and formula (XV-a), respectively in the preparation method (j) may include: 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-fluorobenzonitrile; 5-{3-[3,5-bis(trifluoromethyl)phenyl]-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl}-2-fluorobenzonitrile and the like.

- Many of the compounds represented by the formula G2-H, G3-H, G4-H, G5-G, G6-H, G8-H, G9-H, which are the starting materials in the preparation method (j), are known compounds and the specific examples may include: 1H-imidazole; 1H-pyrazole; 4-methyl-1H-pyrazole; 4-fluoro-1H-pyrazole; 4-chloro-1H-pyrazole; 4-bromo-1H-pyrazole; 4-iodo-1H-pyrazole; 4-nitro-1H-pyrazole; 4-methyl-1H-pyrazole; 3-trifluoromethyl-1H-pyrazole; 4-trifluoromethyl-1H-pyrazole; 4-cyano-1H-pyrazole; 1H-1,2,3-triazole; 1H-1,2,4-triazole; 1H-tetrazole; 5-methyl-1H-tetrazole; 5-(methylthio)-1H-tetrazole and the like.
- 15
- 20

In performing the preparation method (j), for example, 1 mole of the compound of the formula (XV) or formula (XV-a) may be reacted with 1 to 3 moles of G6-H in the presence of 1 to 3 moles of base in a diluent (e.g. DMF) to obtain the corresponding compound of the formula (I) or formula (Ia) of the invention.

In preparation methods of the compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the present invention, novel materials among the compounds which are the raw materials (starting materials and intermediates) can be collectively represented by the formula described below.

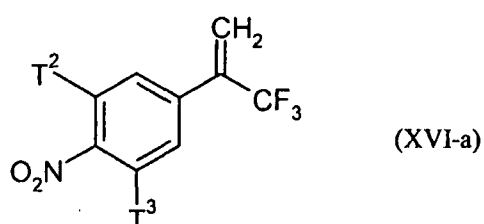
Formula (II-a)



5

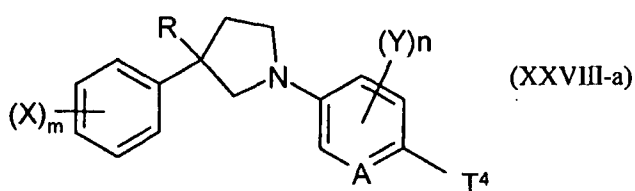
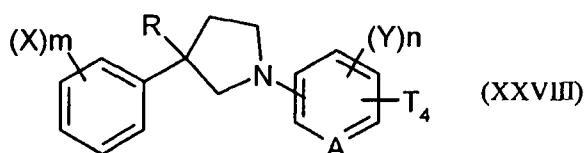
wherein X has the same meanings as defined herein, T^1 represents hydrogen or benzyl, Hal-R represents haloalkyl and p represents 1, 2, 3, 4 or 5.

Formula (XVI-a)



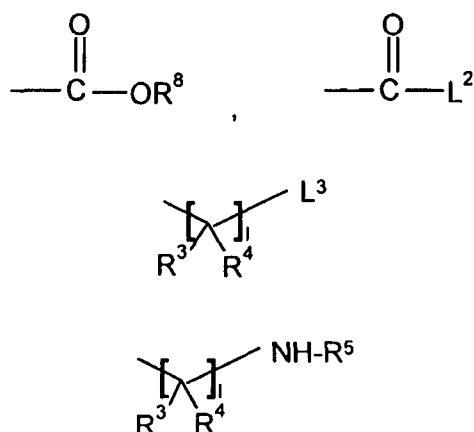
10 wherein T^2 and T^3 each independently represent alkyl.

Compounds of Formula (XXVIII) or compounds of formula (XXVIII-a)



15

wherein X, Y, R, A, m and n has the same definition as above, T⁴ represents:



- 5 cyano, amino or nitro, R⁸, L², L³, R³, R⁴ and R⁵ have the same meanings as defined herein.

The compounds according to the present invention have potent insecticidal and acaricidal activity. Therefore, the compounds represented by formula (I) or formula (Ia) of the present invention can be used as insecticides and/or acaricides. They are particularly useful in the agricultural field. The compounds according to the present invention also exert an appropriate controlling effect against harmful insects without phytotoxicity against cultured plants. In addition, the compounds of the present invention can be used for controlling a wide variety of pests including, for example, harmful sucking insects, biting insects and other plant-parasitic pests, stored grain pests and hygienic pests as well as pests in the veterinary field and can be applied for their control, in particular eradication and extermination. Therefore, the present invention also encompasses a method for combating harmful pests.

Such pest insects include for example

Beetles, such as adzuki bean beetle (*Callosobruchus Chinensis*), maize weevil (*Sitophilus zeamais*), red flour beetle (*Tribolium Castaneum*), large 28-spotted lady beetle (*Epilachna vigintioctomaculata*), barley wireworm (*Agriotes fuscicollis*), soy bean beetle (*Anomala rufocuprea*), colorado potato beetle (*Leptinotarsa decemlineata*), diabrotica (*Diabrotica spp.*), Japanese pine sawyer (*Monochamus alternatus*), rice water weevil (*Lissorhoptrus oryzophilus*), powderpost beetle (*Lyctus brunus*), cucurbit leaf beetle (*Aulacophora femoralis*).

Lepidopteran pests, such as gypsy moth (*Lymantria dispar*), tent caterpillar (*Malacosoma neustria*), small white (*Pieris rapae*), common cutworm (*Spodoptera litura*), cabbage moth (*Mamestra brassicae*), Striped Rice Borer (*Chilo suppressalis*), corn borer (*Pyrausta nubilalis*), dried currant moth (*Ephestia cautella*), summer fruit tortrix moth (*Adoxophyes orana*), codling moth

(*Carpocapsa pomonella*), common cutworm moth (*Agrotis fucosa*), wax moth (*Galleria mellonella*), diamondback moth (*Plutella maculipennis*), *Heliothis* (*Heliothis virescens*), citrus leafminer (*Phyllocnistis citrella*).

5 Hemipterous pests, such as green rice leafhopper (*Nephotettix cincticeps*), brown planthopper (*Nilaparvata lugens*), comstock mealybug (*Pseudococcus comstocki*), arrowhead scale (*Unaspis yanonensis*), Momoaka-aburamusi (*Myzus persicas*), Green apple aphid (*Aphis pomi*), cotton aphid (*Aphis gossypii*), turnip aphid (*Phopalosiphum pseudobrassicae*), Nashi-gunbai (*Stephanitis nashi*), Nazara (*Nazara* spp.), greenhouse whitefly (*Trialeurodes vaporariorum*), Pshylla (*Pshylla* spp.).

10 Thripid pests, such as melon thrips (*Thrips palmi*), western flower thrip (*Frankliniella occidentalis*).

Orthopteran pests, such as german Cockroach (*Blatella germanica*), american cockroach (*Periplaneta americana*), mole cricket (*Gryllotalpa africana*), migratory locust (*Locusta migratoria migratoria*).

15 Isoptera pests, such as Japanese subterranean termite (*Reticulitermes speratus*), termite (*Coptotermes formosanus*);

Dipterous pests, such as house fly (*Musca domestica*), yellow fever mosquito (*Aedes aegypti*), bean seed fly (*Hylemia platura*), Aka-ie-ka (*Culex pipiens*), Sina-hamadara-ka (*Anopheles sinensis*), kodaka-aka-ie-ka (*Culex tritaeniorhynchus*), american serpentine leafminer (*Liriomyza trifolii*).

20 Mites, such as Nise-nami-hadani (*Tetranychus cinnabarinus*), Nami-ha-dani (*Tetranychus urticae*), citrus red mite (*Panonychus citri*), pink citrus rust mite (*Aculops pelekassi*), Tarsonemus (*Tarsonemus* spp.).

Nematode pests, such as sweet potato root-knot nematode (*Meloidogyne incognita*), pine wood nematode (*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara), rice nematode (*Aphelenchoides besseyi*), soybean cyst nematode (*Heterodera glycines*), meadow nematode (*Pratylenchus* spp.).

25 Additionally, the 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, 30 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, in the hygiene and animal health 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 pests which can be combated by using the compounds and compositions according to the invention further include inter alia:

- 5 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*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp.,
10 *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 lycopersici*.

- 15 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*
20 *obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*,
25 *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp.,
30 *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.; as well as *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium Castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lyctus bruneus*, and *Aulacophora femoralis*.

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*,
 5 *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 hyoscyami*, *Phorbia*
 spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.; as well as
 10 *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus* and *Liriomyza trifolii*.

From the class of the Gastropoda, for example, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp.,
Deroceras spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

- From the class of the helminths, for example, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*,
 15 *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*
granulosus, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp.,
Heterakis spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp.,
 20 *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus*
 spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp.,
Taenia saginata, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*,
Trichinella nelsoni, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*,
Wuchereria bancrofti.

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

- 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.,
Heliopeltis spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp.,
 30 *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*,
Piezodorus spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*,
Scotinophora spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

- From the order of the Homoptera, for example, *Acyrtosipon* 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* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp.,
- 5 *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* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp.,
- 10 *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*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp.,
- 15 *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., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis*
- 20 *graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala 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.

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

From the order of the Isoptera, for example, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.; as well as *Reticulitermes speratus* and *Coptotermes formosanus*.

- From the order of the Lepidoptera, for example, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp.,
- 30 *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*, *Ephesia 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., Plutella xylostella, Prodenia spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, 5 Spodoptera spp., Thermesia gemmatilis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp.; as well as Lymantria dispar, Malacosoma neustria, Pieris rapae, Spodoptera litura, Mamestra brassicae, Chilo suppressalis, Pyrausta nubilalis, Ephestia cautella, Adoxophyes orana, Carpocapsa pomonella, Agrotis fucosa, Galleria mellonella, Plutella maculipennis, Heliothis virescens and Phyllocnistis citrella.
- 10 From the order of the Orthoptera, for example, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Schistocerca gregaria; as well as Blattella germanica, Periplaneta americana, Gryllotalpa africana and Locusta migratoria migratoriaodes.
- From the order of the Siphonaptera, for example, Ceratophyllus spp., Xenopsylla cheopis.
- 15 From the order of the Symphyla, for example, Scutigera immaculata.
- From the order of the Thysanoptera, for example, Baliothrips biformis, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamoni, Thrips spp.; as well as Thrips palmi and Frankliniella occidentalis.
- 20 From the order of Hemiptera, for example, Nephotettix cincticeps, Nilaparvata lugens, Pseudococcus comstocki, Unaspis yanonensis, Myzus persicas, Aphis pomi, Aphis gossypii, Rhopalosiphum pseudobrassicae, Stephanitis nashi, Nazara spp., Trialeurodes vaporariorum and Psylla spp.;
- From the order of the Thysanura, for example, Lepisma saccharinum.
- 25 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., Radopholus similis, Rotylenchus spp., Trichodorus spp., Tylenchorhynchus spp., Tylenchulus spp., Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp.; as well as Meloidogyne incognita, Bursaphelenchus lignicolus Mamiya et
- 30 Kiyohara, Aphelenchoides besseyi, and Heterodera glycines and Pratylenchus spp.

Mites include, for example, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi* and *Tarsonemus* spp. or Mites, such as *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp., *Boophilus* spp. and the like.

In the present invention, substances having insecticidal effects against vermins encompassing all of
5 such pests are referred to as insecticides.

If appropriate, the 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
10 RLO (rickettsia-like organisms). If appropriate, they can also be employed as intermediates or precursors for the synthesis of other active compounds.

In the veterinary field, the novel compounds of the invention can be effectively used to various harmful animal parasites (endoparasites and ectoparasites), including insects and worms.

Examples of such animal parasites may include the following vermins: insects, such as bot fly
15 (*Gastrophilus* spp.), stable fly (*Stomoxys* spp.), biting louse (*Trichodectes* spp.), *Rhodnius* (*Rhodnius* spp.), *inu-nomi* (*Ctenocephalides canis*), bedbug (*Cimex lecturarius*), *neko-nomi* (*Ctenocephalides felis*), sheep blowfly (*Lucilia cuprina*) and the like.

As already mentioned before, in the veterinary fields, i.e. in the field of veterinary medicine, the active compounds according to the present invention are active against animal parasites, in
20 particular ectoparasites or endoparasites. The term endoparasites includes in particular helminths, such as cestodes, nematodes or trematodes, and protozoae, such as coccidia. Ectoparasites are typically and preferably arthropods, in particular insects such as flies (stinging and licking), parasitic fly larvae, lice, hair lice, bird lice, fleas and the like; or acarids, such as ticks, for examples hard ticks or soft ticks, or mites, such as scab mites, harvest mites, bird mites and the
25 like.

These parasites include:

From the order of the Anoplurida, for example *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; particular examples are: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*,
30 *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurytetrus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*.

From the order of the Mallophagida and the suborders Amblycerina and Ischnocerina, for example Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp.; particular examples are: Bovicola bovis, Bovicola ovis, Bovicola limbata, Damalina bovis, Trichodectes canis, Felicola subrostratus,
 5 Bovicola caprae, Lepikentron ovis, Werneckiella equi.

From the order of the Diptera and the suborders Nematocerina and Brachycerina, for example Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhelmia spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp.,
 10 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., Melophagus spp., Rhinosternus spp., Tipula spp.; particular examples are: Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles gambiae, Anopheles maculipennis, Calliphora erythrocephala,
 15 Chrysosoma pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Fannia canicularis, Sarcophaga carnaria, Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Simulium reptans, Phlebotomus papatasi, Phlebotomus longipalpis, Odagmia ornata, Wilhelmia equina, Boophilum microplus, Tabanus bromius, Tabanus spodopterus, Tabanus atratus, Tabanus sudeticus, Hybomitra ciurea, Chrysops caecutiens, Chrysops relictus, Haematopota
 20 pluvialis, Haematopota italica, Musca autumnalis, Musca domestica, Haematobia irritans irritans, Haematobia irritans exigua, Haematobia stimulans, Hydrotaea irritans, Hydrotaea albipuncta, Chrysomya chloropyga, Chrysomya bezziana, Oestrus ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma lineatum, Przewalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena capreoli, Lipoptena cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, Gasterophilus intestinalis,
 25 Gasterophilus haemorrhoidalis, Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricornis, Gasterophilus pecorum, Braula coeca.

From the order of the Siphonaptera, for example Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.; particular examples are: Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.
 30 From the order of the Heteroptera, for example Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.

From the order of the Blattellidae, for example Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp. (e.g. Supella longipalpa).

- 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., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp, *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (the original genus of multi host ticks) *Ornithonyssus* spp.,
- 5 *Pneumonyssus* spp., *Railletia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; particular examples are: *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus*
- 10 *evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*, *Haemaphysalis cinnabarina*, *Haemaphysalis otophila*, *Haemaphysalis leachi*, *Haemaphysalis longicorni*, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor albipictus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma mauritanicum*,
- 15 *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma cajennense*, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Varroa jacobsoni*.
- 20 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.; particular examples are:
- 25 *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*, *Demodex caprae*, *Demodex equi*, *Demodex caballi*, *Demodex suis*, *Neotrombicula autumnalis*, *Neotrombicula desaleri*, *Neoschöngastia xerothermobia*, *Trombicula akamushi*, *Otodectes cynotis*, *Notoedres cati*, *Sarcoptes canis*, *Sarcoptes bovis*, *Sarcoptes ovis*, *Sarcoptes rupicaprae* (=S. caprae), *Sarcoptes equi*, *Sarcoptes suis*, *Psoroptes ovis*, *Psoroptes cuniculi*, *Psoroptes equi*,
- 30 *Chorioptes bovis*, *Psoergates ovis*, *Pneumonyssoides Mange*, *Pneumonyssoides caninum*, *Acarapis woodi*.

The active compounds according to the invention are also suitable for controlling arthropods, helminths and protozoae, which attack animals. The control of arthropods is preferred. The control of insects is particularly preferred. Equally, the control of acarids is particularly preferred.

5 Animals which may be treated to control the parasites include birds, insects and in particular mammals. Animals include agricultural livestock such as, for example, cattle, sheep, goats, horses, pigs, donkeys, camels, buffaloes, rabbits, chickens, fur-bearing animals, turkeys, ducks, geese, cultured fish, honeybees. Moreover, animals include domestic animals - also referred to as
5 companion animals - such as, for example, dogs, cats, ferrets, cage birds, aquarium fish, reptiles and what are known as experimental animals such as, for example, hamsters, guinea pigs, rats and mice.

By controlling these arthropods, helminths and/or protozoae, it is intended to reduce deaths and improve performance (in the case of meat, milk, wool, hides, eggs, honey and the like) and health
10 of the host animal, so that more economical and simpler animal keeping is made possible by the use of the active compounds according to the invention.

For example, it is desirable to prevent or interrupt the uptake of blood by the parasites from the hosts (when applicable). Also, controlling the parasites may help to prevent the transmittance of infectious agents.

15 The term "controlling" as used herein with regard to the veterinary field, means that the active compounds are effective in reducing the incidence of the respective parasite in an animal infected with such parasites to innocuous levels. More specifically, "controlling", as used herein, means that the active compound is effective in killing the respective parasite, inhibiting its growth, or inhibiting its proliferation.

20 The active compounds of the present invention, when used as insecticides, may be formed into conventional formulation forms. Such formulation forms include, for example, solutions, emulsions, wettable powders, water dispersible granules, suspensions, powders, foams, pastes, tablets, granules, aerosols, active compound-impregnated natural and synthetic substances, microcapsules, seed coating agents, formulations used with burning device (burning devices
25 include, for example, fumigation and smoking cartridges, cans and coils) and UVL [cold mist, warm mist].

The active compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the invention may be present in the commercially useful formulations and usage forms prepared from their formulations, as a mixed formulation form with other active compounds such as insecticides, toxic baits, bactericides,
30 acaricides, nematocides, fungicides, growth regulating agents, herbicides and the like. Above mentioned insecticides may include, for example, organophosphorus agents, carbamate agents, carboxylate chemical agents, chlorohydrocarbon type chemical agents, insecticidal substances produced by microorganisms and the like.

These formulations may be prepared by the method known per se. For example, they can be prepared by mixing the active compounds together with spreading agents, i.e. liquid diluents or carriers; Liquefied gas diluents or carriers; solid diluents or carriers, and, optionally, surfactants i.e. emulsifiers and/or dispersants and/or foam forming agents.

- 5 When water is used as a spreading agent, for example organic solvents may be used as an auxiliary solvent.

Liquid diluents or carriers may include, for example, aromatic hydrocarbons (e.g. xylene, toluene, alkylnaphthalene etc.), chlorinated aromatic or chlorinated aliphatic hydrocarbons (e.g. chlorobenzens, ethylene chlorides, methylene chlorides etc.), aliphatic hydrocarbons (e.g. cyclohexanes or paraffins (e.g. mineral oil fractions)), alcohols (e.g. butanol, glycol and ethers or esters thereof etc.), ketones (e.g. acetone, methylethylketone, methylisobutylketone, cyclohexanone etc.), strong polar solvents (e.g. dimethylformamide, dimethylsulfoxide etc.), water and the like.

- 15 Liquefied gas diluents or carriers may include substances which exist as gas at ambient temperature and normal pressure, for example aerosol propellants such as furan, propane, nitrogen gas, carbon dioxide, halogenated hydrocarbons.

Solid diluents may include, for example, crushed natural minerals (e.g. kaolin, clay, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite or diatom earth etc.), crushed synthetic minerals (e.g. highly-dispersive silic acid, alumina, silicate etc.) and the like.

- 20 Solid carriers for granules may include, for example, crushed and fractionated rocks (e.g. calcite, marble, pumice stone, sepiolite, dolomite etc.), synthetic granules of inorganic or organic powders, fine particles of organic materials (e.g. sawdust, coconut shells, corncob, stalk of Indian weed etc.).

- 25 Emulsifiers and/or foams may include, for example, nonionic or anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty alcohol ethers (e.g. alkylaryl polyglycol ether), alkyl sulfonates, alkyl sulfates, aryl sulfonates etc.), albumin hydrolyzed products and the like.

Examples of dispersants include, for example, lignin sulfite waste liquor, methylcellulose and the like.

Adhesive agents may also be used for the formulations (powders, granules, emulsions), such as carboxymethylcellulose, natural or synthetic polymers (e.g. acacia, polyvinyl alcohols, polyvinyl acetates etc.) and the like.

Colorants may be used, such as inorganic pigments (e.g. ferric oxide, titanic oxide, Prussian blue etc.), organic pigments (e.g. alizarin dyes, azo dyes or metallophthalocyanine dyes etc.) as well as trace elements (e.g. salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum or zinc etc.).

Generally such formulations may contain the active compounds described above in a range from 0.1 to 95 % by weight, preferably 0.5 to 90% by weight.

The compounds according to the present invention may be used in ordinary manners suitable for their application forms. It is understood that the compounds according to the invention can also be present in compositions containing further ingredients, such as auxiliaries or active ingredients. The skilled person will choose a suitable ingredient among those named herein and known in the art and which are supposed to enhance a property which is considered being favorable in view of the intended application and use.

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 undesired 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.

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 their surroundings, habitat or storage space by the customary treatment methods, for example by immersion, spraying, evaporation, fogging, scattering, painting on, injecting and, in the case of propagation material, in particular in the case of seed, also by applying one or more coats.

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 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 or in use are treated according to the invention. Plant cultivars are 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.

- 10 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 activity spectrum and/or an increase in the activity of the substances and compositions which can be used according to the invention, better plant growth, increased
- 15 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 are possible, which exceed the effects which were actually to be expected.
- 20 The preferred transgenic plants or plant cultivars (obtained by genetic engineering) which are to be treated according to the invention include all plants which, by virtue of the genetic modification, received genetic material which imparts 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,
- 25 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
- 30 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 in particular are

- the 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), Nucotn® (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 beans), 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.
- 25 The plants listed can be treated according to the invention in a particularly advantageous manner with the compounds or compositions according to the invention. The preferred ranges stated above for the active compounds or compositions also apply to the treatment of these plants. Particular emphasis is given to the treatment of plants with the compounds or compositions specifically mentioned in the present text.
- 30 It has furthermore been found that the 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 aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

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

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

Bristletails, such as *Lepisma saccharina*.

- 10 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.

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

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

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

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

- 25 In domestic, hygiene and stored-product protection, the active compounds are also suitable for 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 ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodorus 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*
 5 *cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

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

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., *Lepisma saccharina*,
 10 *Lepismodes inquilinus*.

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*.

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

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

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*,
 20 *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

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*
 25 *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*.

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

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

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

- 10 In the field of domestic insecticides, a combination with other suitable active compounds, such as phosphoric esters, carbamates, pyrethroids, neonicotinoids, growth regulators or active compounds from other known classes of insecticides can be used and is especially preferable.

- 15 The compounds or compositions according to the invention, preferable in their suitable application form, can be 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 scattering or in bait stations.

- 20 The compounds or compositions according to the invention are particularly suitable for treating seed. 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 compositions is therefore of particularly great interest.

- 25 The control of pests by treating the seed of plants has been known for a long time and is subject-matter 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
30 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 also the germinating plant with a minimum of crop protection agents being employed.

5 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 a composition according to the invention. The invention likewise relates to the use of the compositions according to the invention for the treatment of seed for protecting the seed and the resulting plant from pests. Furthermore, the invention relates to seed which has been treated with a composition according to the invention so as to afford protection from pests.

10 One of the advantages of the present invention is that the particular systemic properties of the compositions according to the invention mean that treatment of the seed with these compositions 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.

15 Furthermore, it must be considered as advantageous that the compounds or compositions 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 compositions 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 compositions
20 according to the invention against damage.

The compounds or compositions 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
25 millet, wheat, barley, oats, rye, sunflower, tobacco, potatoes or vegetables (for example tomatoes, cabbage plants). The compositions 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 a composition according to the
30 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 composition 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 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 composition 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 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.

The active compounds of the present invention, when used against hygienic pests and stored grain pests, have a good stability to alkali on calcareous substances and also show an excellent residual activity in wood and soil.

In addition, the active compounds of the formula (I) or formula (Ia) of the invention may be present as a mixed formulation with synergists and such formulations and usage forms may include commercially useful formulations and forms. Such synergists, which are not necessarily active per se, are compounds enhancing the action of the active compounds.

Generally, when used for the treatment of animals the active compounds according to the invention can be applied directly. Preferably they are applied as pharmaceutical compositions which may contain pharmaceutically acceptable excipients and/or auxiliaries which are known in the art.

In the veterinary field and in animal keeping, the active compounds are applied (= administered) in the known manner by enteral administration in the form of, for example, tablets, capsules, drinks, drenches, granules, pastes, boluses, the feed-through method, suppositories; by parenteral administration, such as, for example, by injections (intramuscular, subcutaneous, intravenous, intraperitoneal and the like), implants, by nasal application, by dermal application in the form of, for example, bathing or dipping, spraying, pouring-on and spotting-on, washing, dusting, and with the aid of active-compound-comprising shaped articles such as collars, ear tags, tail tags, limb

bands, halters, marking devices and the like. The active compounds may be formulated as shampoo or as suitable formulations usable in aerosols, unpressurized sprays, for example pump sprays and atomizer sprays.

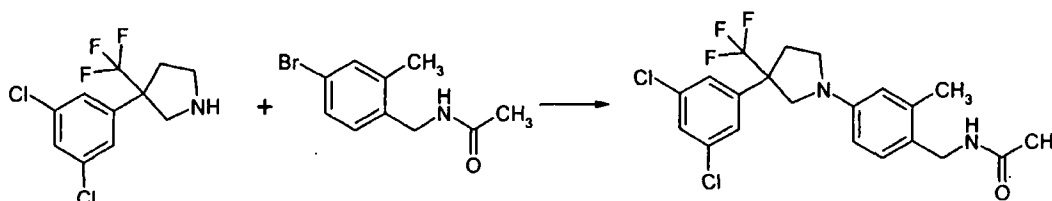
When used for livestock, poultry, domestic animals and the like, the active compounds according to the present invention can be applied as formulations (for example powders, wettable powders [“WP”], emulsions, emulsifiable concentrates [“EC”], flowables, homogeneous solutions and suspension concentrates [“SC”]) which comprise the active compounds in an amount of from 1 to 80% by weight, either directly or after dilution (e.g. 100- to 10 000-fold dilution), or else as a chemical bath.

When used in the veterinary field the active compounds according to the invention may be used in combination with suitable synergists or other active compounds, such as for example, acaricides, insecticides, anthelmintics, anti-protozoal drugs.

The present invention is more specifically illustrated by means of the following examples. However the present invention should not be limited only to these examples.

15 Synthetic example 1

Synthesis of N-{4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-methylbenzyl}acetamide (No. 3-11)



Sodium tert-butoxide (0.3g), Tris (dibenzylidene acetone)dipalladium(0) (chloroform adduct)(0.04g) and xantphos (0.07g) was added to the solution of 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (0.59g) and N-(4-bromo-2-methylbenzyl)acetamide (0.5g) in toluene under argon atmosphere, and the mixture was heated with stirring at 80°C for 5 hours. The reaction solution was diluted with t-butylmethylether and then washed with water and brine. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate. The solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield N-{4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-methylbenzyl}acetamide (0.6g).

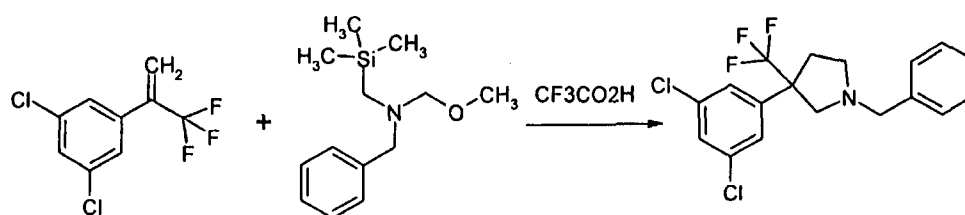
¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.13-2.18 (6H, m), 2.51-2.53 (1H, m), 2.81-2.83 (1H, m), 3.45-3.56 (2H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.01-4.04 (1H, m), 4.25 (1H, s), 4.57 (1H, s), 6.40-6.44 (2H, m), 6.93-6.96 (1H, m), 7.30-7.38 (3H, m)

Synthetic example 2

- 5 Synthesis of 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]-2-nitro-N-(pyridin-2-ylmethyl)benzamide (No.1-16)

Synthetic example 2-1

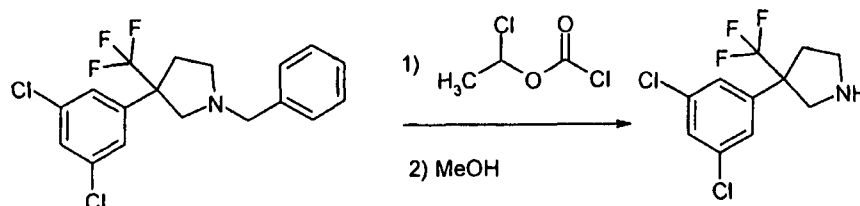
Synthesis of 1-benzyl-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine (No.5-11)



- 10 To the solution of 1,3-dichloro-5-[1-trifluoromethyl] vinyl]benzene (6.1g) and N-benzyl-1-methoxy-N-[(trimethylsilyl) methyl]methanamine (5.0g) in dichloromethane was added dropwise the solution of trifluoroacetic acid (0.24g) in dichloromethane while cooling with ice. On completion of the dropwise addition, the mixture was warmed to room temperature and stirred for 3 hours. The solution was concentrated under the reduced pressure, and the residue was then
- 15 diluted with t-butylmethylether. The solution was washed with saturated sodium bicarbonate water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 1-benzyl-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine (5.7g).
- ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.27-2.36 (1H, m), 2.53-2.62 (1H, m), 2.69-2.83 (2H, m), 3.08 (2H, dd), 3.67
- 20 (2H, s), 7.25-7.36 (8H, m)

Synthetic example 2-2

Synthesis of 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (No.5-12)

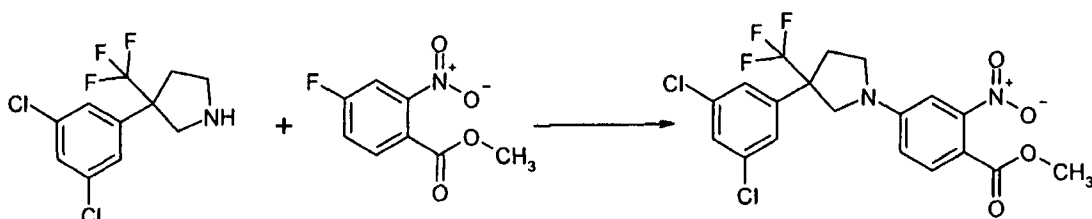


64

The solution of 1-benzyl-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (5.7g) and 1-chloroethyl chloroformate (4.4g) in dichloroethane was heated to reflux for 3 hours. The mixture was cooled to room temperature and then concentrated under the reduced pressure. Methanol was added to the resultant residue, which was then heated with stirring at 60°C for two hours. The mixture was cooled to room temperature, to which was then added water. The solution was washed twice with the mixed solvent of hexane and ethyl acetate (9:1). The solution was alkalized with sodium hydrogen carbonate and then extracted with ethyl acetate three times. The organic layer was combined, which was then washed with brine and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure to yield 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (4.2g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.24-2.33 (1H, m), 2.51-2.56 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.19-3.26 (2H, m), 3.74 (1H, d), 7.25 (2H, d), 7.35 (1H, t)

Synthetic example 2-3

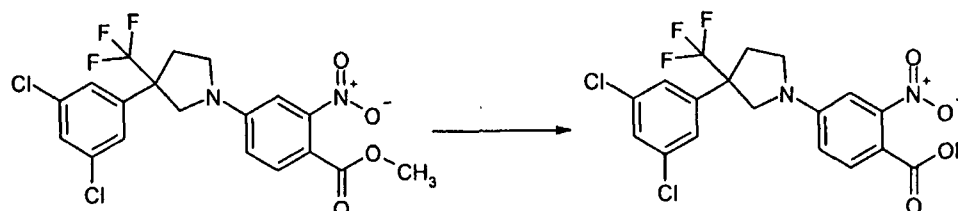
Synthesis of methyl 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoate (No.4-6)



To the solution of methyl 4-fluoro-2-nitrobenzoate (1.1g) and 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (1.5g) in 1-methyl-2-pyrrolidinone was added potassium carbonate (1.5g) and the mixture was heated with stirring at 100°C for two hours. The mixture was cooled to room temperature and then poured into water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield methyl 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoate (1.24g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.53-2.67 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.26 (2H, d), 7.42 (1H, t), 7.81 (1H, d)

Synthetic example 2-4

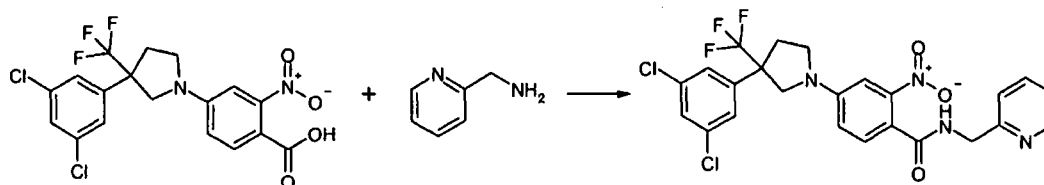
Synthesis of 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoic acid (No. 4-7)



- 5 To the solution of methyl 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoate (1.24g) in 1,4-dioxane was added 2N aqueous sodium hydroxide (5.4mL), and the mixture was heated with stirring at 80°C. The mixture was cooled to room temperature and then acidified with 2N hydrochloric acid before the mixture was extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous
- 10 magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure to yield 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoic acid (0.85g). ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ: 2.58-2.72 (1H, m), 2.91-3.04 (1H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.65 (2H, d), 7.71 (1H, t), 7.78 (1H, d)

15 Synthetic example 2-5

Synthesis of 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitro-N-(pyridin-2-ylmethyl)benzamide (No.1-16)

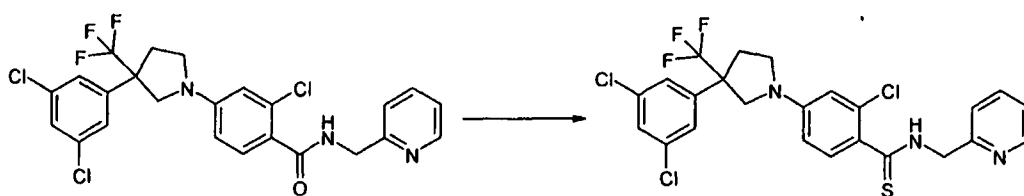


- To the solution of 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-nitrobenzoic acid(0.3g) and 2-picolylamine (0.07g) in DMF was added 1-ethyl-3-(3'-dimethylaminopropyl)carbodiimide hydrochloride (0.13g) and 1-hydroxybenzotriazole monohydrate (0.01g), and the mixture was stirred for 6 hour at room temperature. The reaction solution was poured into water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium
- 25 sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced

pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl] -2-nitro-N-(pyridine-2-ylmethyl)benzamide (0.19g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.54-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.15-7.23 (2H, m), 7.28 (2H, br s), 7.37
5 (1H, d), 7.41 (1H, t), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d).

Synthetic example 3

2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]-N-(pyridin-2-ylmethyl) benzenecarbothioamide (No.1-81)



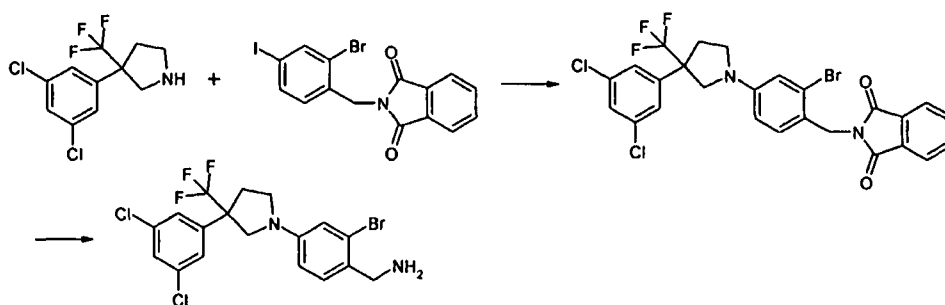
10 To the solution of 2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-N-(pyridin-2-ylmethyl)benzamide (0.35g) in toluene was added Lawesson reagent (0.28g) and the mixture was heated to reflux for 3 hours. After the mixture was cooled to room temperature, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was purified by silica gel chromatography to yield 2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-N-(pyridin-2-ylmethyl) benzenecarbothioamide (0.10g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.51-2.61 (1H, m),
15 2.84-2.92 (1H, m), 3.45-3.61 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.08 (1H, d), 5.08 (2H, d), 6.49-6.54 (2H, m), 7.22-7.28 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.40 (1H, t), 7.72 (1H, td), 7.79 (1H, d), 8.54 (1H, d), 9.27 (1H, br s).

Synthetic example 4

20 Synthesis of N-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl) -3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]benzyl}acetamide (No.3-3)

Synthetic example 4-1

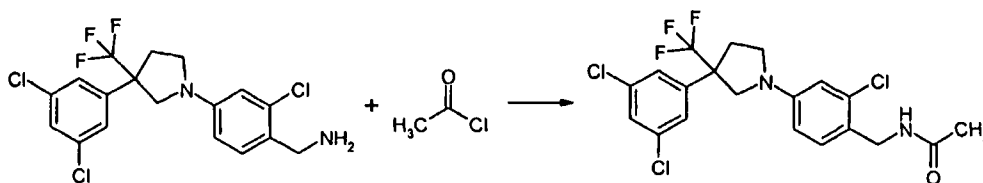
Synthesis of 1-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl) -3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine (No.4-49)



Sodium tert-butoxide (0.2g), Tris (dibenzylidene acetone) dipalladium(0) (chloroform adduct)(0.03g) and xantphos (0.05g) was added to the solution of 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (0.4g) and 2-(2-chloro-4-iodobenzyl)-1H-isindole-1,3-(2H)-dione (0.69g) in toluene under argon atmosphere, and the mixture was heated with stirring at 80°C for 3 hours. The reaction solution was diluted with t-butylmethylether and then washed with water and brine. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate. The solvent was distilled away under the reduced pressure to yield the crude product. The product was dissolved in methanol, to which was then added aqueous hydrazine (0.03g), followed by the mixture heated to reflux for 12 hours. The reaction solution was diluted with t-butylmethylether and then washed with saturated saline. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate. The solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 1-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl) -3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine (0.12g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.47-2.54 (1H, m), 2.78-2.85 (1H, m), 3.46-3.49 (2H, m), 3.69-4.01 (4H, m), 6.47-6.50 (1H, m), 6.73-6.76 (1H, m), 7.25-7.35 (4H, m).

Synthetic example 4-2

Synthesis of N-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl) -3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]benzyl}acetamide (No.3-3)



To the solution of 1-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl) -3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]phenyl}methanamine (0.12g) and triethylamine (0.04g) in tetrahydrofuran was added dropwise acetyl chloride (0.02g), and the mixture was stirred for one hour at room temperature. The reaction solution was diluted with t-butylmethylether and then washed with water and brine. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate. The solvent was distilled away under the

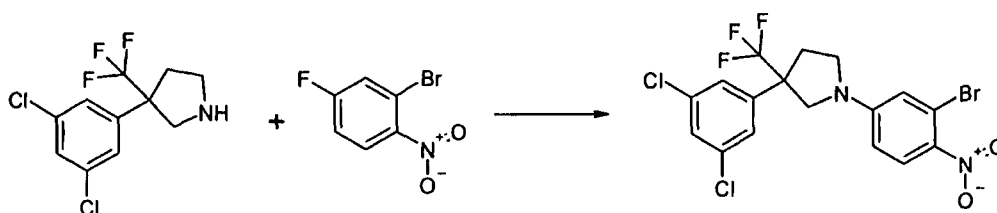
reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield N-{2-chloro-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]benzyl}acetamide (0.1g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 1.98-2.01 (3H, m), 2.50-2.58 (1H, m), 2.82-2.87 (1H, m), 3.45-3.51 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H, d), 4.41 (2H), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58-6.59 (1H, m), 7.26-7.38 (4H, m)

5 Synthetic example 5

Synthesis of 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]phenyl}-1H-tetrazole (No.2-23)

Synthetic example 5-1

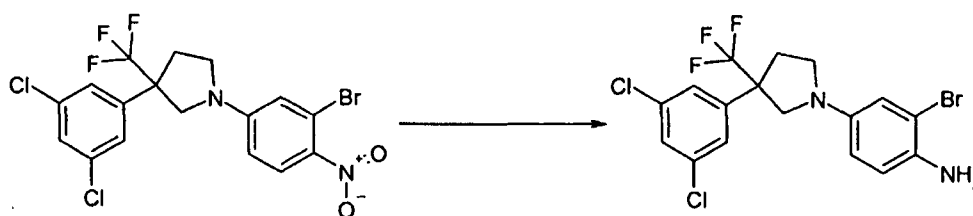
10 Synthesis of 1-(bromo-4-nitrophenyl)-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (No.4-20)



To the solution of 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (1.3g) and 2-bromo-4-fluoro-1-nitrobenzene (1.0g) in 1-methyl-2-pyrrolidinone was added potassium carbonate (1.3g), and the mixture was heated with stirring at 100°C for 3 hours. The mixture was cooled to room temperature and then poured into water, which was extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 1-(3-bromo-4-nitrophenyl)-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (1.56g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.53-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.16 (1H, d), 6.53 (1H, dd), 6.84 (1H, d), 7.27 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.07 (1H, d).

Synthetic example 5-2

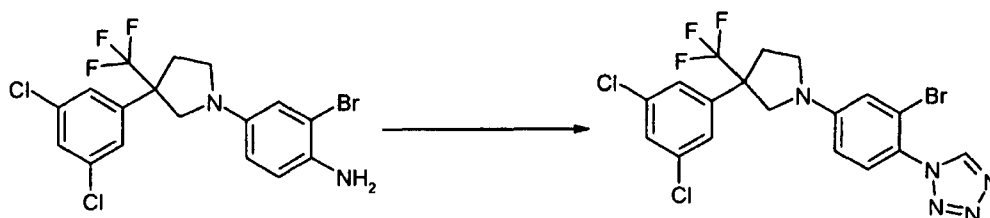
Synthesis of 2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]aniline (No.4-21)



To the solution of 1-(3-bromo-4-nitrophenyl)-3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (1.10g) in the mixed solvent of 1,4-dioxane and ethanol was added stannous chloride dihydrate (2.05g) and a small amount of concentrated hydrochloric acid, and the mixture was then stirred 4 hours at 90°C. The mixture was cooled to room temperature and then poured into the mixed solution of ethyl acetate and water, which was then neutralized with sodium hydrogen carbonate with vigorous stirring. After filtration of precipitate through Celite, the organic layer was separated and the aqueous layer was extracted with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with brine and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]aniline (0.73g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.44-2.54 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 3.32-3.50 (2H, m), 3.56-3.76 (3H, m), 3.92 (1H, d), 6.46 (1H, dd), 6.70-6.78 (2H, m), 7.29 (2H, br s), 7.37 (1H, t).

15 Synthetic example 5-3

Synthesis of 1-(2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]phenyl)-1H-tetrazole (No.2-23)



To the mixture of 2-bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]aniline (0.60g), triethyl orthoformate (0.98g) and sodium azide (0.38g) was added acetic acid (1.1g), and the mixture was then heated with stirring at 100°C for 4 hours. The mixture was cooled to room temperature and then poured into water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 1-(2-

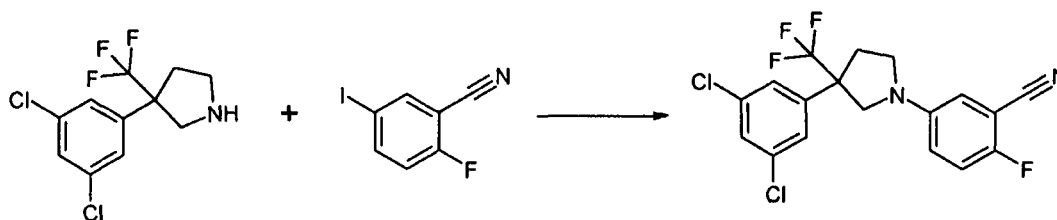
bromo-4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)-pyrrolidin-1-yl]phenyl}-1H-tetrazole
(0.52g). m.p.193-194°C.

Synthetic example 6

Synthesis of 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)benzonitrile (No.2-39)

Synthetic example 6-1

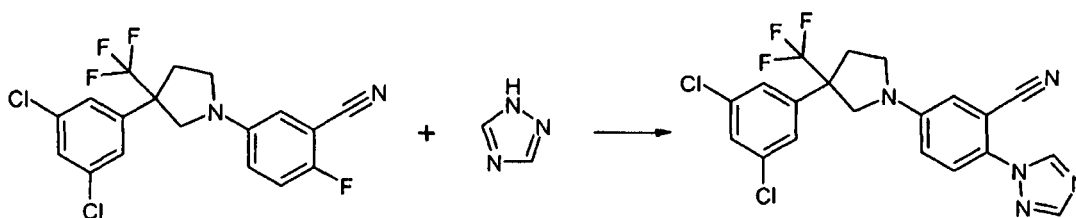
Synthesis of 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]-2-fluorobenzonitrile (No.4-17)



10 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidine (0.6g) and 2-fluoro-5-iodobenzonitrile (0.57g) was dissolved in toluene, which was then degassed 3 times. To the solution in toluene was added sodium tert-butoxide (0.20g), Tris (dibenzylidene acetone)dipalladium chloroform complex (0.04g) and Xantphos (0.07g) under argon atmosphere, and the mixture was stirred at 80°C for two hours. The mixture was cooled to room temperature and then diluted with ethyl acetate, which was
15 then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl)pyrrolidin-1-yl]-2-fluorobenzonitrile (0.54g). m.p.184-186°C.

Synthetic example 6-2

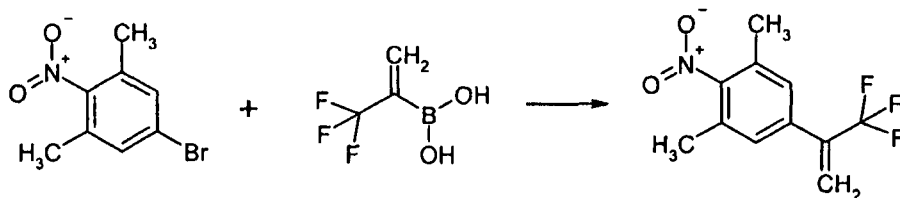
20 Synthesis of 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)benzonitrile (No.2-39)



To the solution of 1H-1,2,4-triazole (0.06g) in DMF was added sodium hydride (0.04g) while cooling with ice, and the mixture was warmed to room temperature and then stirred for 0.5 hr. To this solution was added the solution of 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl] 2-fluorobenzonitrile (0.30g) in DMF, and the mixture was heated to reflux for 6 hours. The mixture was cooled to room temperature and then poured into water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 5-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl] -2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)benzonitrile (0.18g). ¹H-NMR (DMSO-d₆) δ: 2.62-2.73 (1H, m), 2.95-3.03 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.31 (1H, d), 7.09 (1H, dd), 7.29 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.68 (2H, d), 7.71 (1H, t), 8.26 (1H, s), 8.98 (1H, s)

Synthetic example 7

Synthesis of 1,3-dimethyl-2-nitro-5-[1-(trifluoromethyl) vinyl] benzene (No.6-1)



15

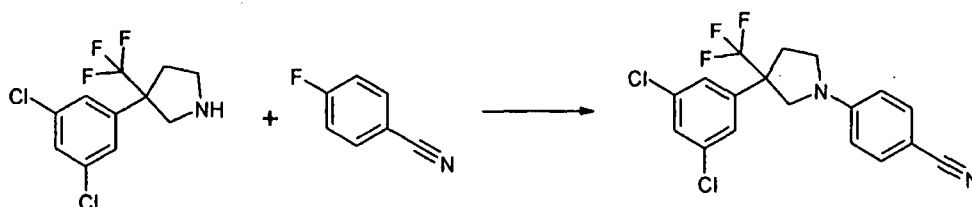
5-bromo-1,3-dimethyl-2-nitrobenzene (10.0g), [1-(trifluoromethyl) vinyl] boronic acid (purity:60%, 13.4g) and potassium carbonate (14.4g) was dissolved in the mixed solvent of THF and water, which was then degassed three times. To the solution was added dichloro bis(triphenylphosphine) palladium (II) (1.5g), and the mixture was heated to reflux for 3 hours under argon atmosphere. The mixture was cooled to room temperature and then poured into water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 1,3-dimethyl-2-nitro-5-[1-(trifluoromethyl) vinyl] benzene (11.2g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.34 (6H, s), 5.78-5.80 (1H, m), 6.03-6.04 (1H, m), 7.20 (2H, s).

20

25

Synthetic example 8

Synthesis of 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl]benzonitrile (No.4-2)



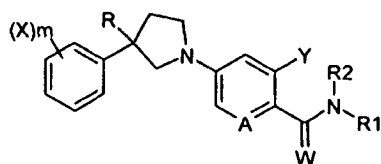
To the solution of 3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidine (0.30g) and 4-fluorobenzonitrile (0.12g) in DMSO (dimethylsulfoxide) was added potassium carbonate (0.27g), and the mixture was heated with stirring at 120°C for 6 hours. The mixture was cooled to room temperature and then poured onto water, which was then extracted twice with ethyl acetate. The organic layer was combined, which was then washed with water and dried over anhydrous magnesium sulfate. After the drying agent was filtered off, the solvent was distilled away under the reduced pressure, and the residue was then purified by silica gel chromatography to yield 4-[3-(3,5-dichlorophenyl)-3-(trifluoromethyl) pyrrolidin-1-yl] benzonitrile (0.05g). ¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.51-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.56-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.59 (2H, d), 7.26 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 7.52 (2H, d).

The compounds and intermediates of the formula (I) or formula (Ia) of the invention obtained by the same methods as those of the above synthetic examples and according to the methods described above in detail, as well as their physical values are showed in tables 1-13. Each compound obtained in the above synthetic examples is also showed in each correspondent table.

In these tables, the following abbreviations are used.

Me: methyl, Et:ethyl, Pr:propyl, Bu:butyl, Ph:phenyl, Pen:pentyl.

Table 1



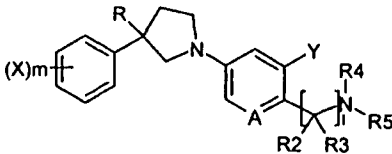
	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	m.p. (°C)
1-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	CH	O	
1-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	CH	O	
1-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	CH	O	
1-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	CH	O	
1-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-11	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	CH	O	
1-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	CH	O	
1-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	CH	O	
1-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-19	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	169-170
1-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	176-179
1-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-42	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-43	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-44	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-45	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-46	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-49	3-CF3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-50	3-CF3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-51	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-52	3-OH	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-53	3-SH	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-54	3,4-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	m.p. (°C)
1-55	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	77-80
1-56	3,4,5-triCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-57	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-58	3,5-diBr	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-59	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-62	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	S	
1-63	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	CH	O	
1-64	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	CH	O	
1-65	3,5-diCl	CF3	NO2	iso-Pr	H	CH	O	
1-66	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	CH	O	
1-67	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	CH	O	
1-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	CH	O	
1-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(cyclo)Pr	H	CH	O	
1-70	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2Me	H	CH	O	
1-71	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2CF3	H	CH	O	
1-72	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	CH	O	
1-73	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	CH	O	
1-74	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	CH	O	
1-75	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	CH	O	
1-76	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	CH	O	
1-77	3,5-diCl	CH3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-78	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	N	O	
1-79	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	CH3	CH	O	
1-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	CH	S	
1-82	2-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-PyridylCH2	H	CH	O	
1-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-PyridylCH2	H	CH	O	
1-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridinylCH2	H	CH	O	
1-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH2	H	CH	O	
1-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		CH	O	
1-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	CH	O	
1-94	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-95	4-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	CH	O	
1-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	CH	O	
1-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-101	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	N	O	
1-102	3,4,5-triCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	m.p. °C)
2-44	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-45	3,5-diCl	CF3	CH3	G6	H	CH	
2-46	3,5-diCl	CF3	MeS	G6	H	CH	
2-47	3,5-diCl	CF3	MeSO	G6	H	CH	
2-48	3,5-diCl	CF3	MeSO2	G6	H	CH	
2-49	3,5-diCl	CF3	CF3S	G6	H	CH	
2-50	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	G6	H	CH	
2-51	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	G6	H	CH	
2-52	3,5-diCl	CF3	OCH3	G6	H	CH	
2-53	3,5-diCl	CF3	OCF3	G6	H	CH	
2-54	3,5-diCl	CF3	OH	G6	H	CH	
2-55	3,5-diCl	CF3	SH	G6	H	CH	
2-56	3,5-diCl	CF3	NH2	G6	H	CH	
2-57	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	G6	H	CH	
2-58	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	G6	H	CH	
2-59	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	G6	H	CH	
2-60	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-NO2	CH	
2-61	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-CN	CH	
2-62	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-NO2	CH	
2-63	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-CN	CH	
2-64	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Cl	CH	
2-65	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Br	CH	
2-66	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CH3	CH	
2-67	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CF3	CH	
2-68	3-Cl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-69	3-Cl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-70	3-CF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-71	3-CF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-72	3,5-diCF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-73	3,5-diCF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-74	3-NO2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-75	3-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-76	3,4-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-77	3,4-diCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-78	3,5-diBr	CF3	CN	G6	H	CH	
2-79	3,5-diBr	CF3	CN	G8	H	CH	
2-80	3,5-diBr	CF3	Br	G6	H	CH	
2-81	3,5-diBr	CF3	Br	G8	H	CH	
2-82	3,4,5-triCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-83	3,4,5-triCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-84	3,4,5-triCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-85	3,4,5-triCl	CF3	Br	G8	H	CH	
2-86	3,5-diMe-4-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-87	3-CH3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-88	3-CH3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-89	3-CN	CF3	CN	G6	H	CH	
2-90	3-CF3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-91	3-CF3O	CF3	CN	G8	H	CH	
2-92	3-CH3S	CF3	CN	G6	H	CH	
2-93	3-CH3S	CF3	CN	G8	H	CH	
2-94	3-CH3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-95	3-CH3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-96	3-CF3S	CF3	CN	G6	H	CH	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	m.p. °C)
2-97	3-CF3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-98	3-CF3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-99	3-OH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-100	3-SH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-101	3,5-diCl	CH3	Br	G6	H	CH	
2-102	3,5-diCl	CH3	Br	G8	H	CH	
2-103	3,5-diCl	CF3	Br	G6	H	N	
2-104	3,5-diCl	CF3	Br	G8	H	N	
2-105	3,5-diCl	CF3	CN	G6	H	N	
2-106	3,5-diCl	CF3	CN	G8	H	N	
2-107	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G6	H	CH	
2-108	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G8	H	CH	
2-109	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G6	H	CH	
2-110	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G8	H	CH	
2-111	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G6	H	CH	
2-112	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G8	H	CH	

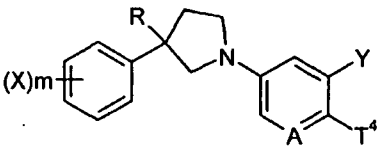
Table 3



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	I	m.p. (°C)
3-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	CH	1	
3-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	CH	1	
3-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-18	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	CH	1	
3-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	CH	1	
3-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	CH	1	
3-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	CH	1	
3-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	CH	1	
3-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	CH	1	
3-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	CH	1	
3-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	CH	1	
3-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	CH	1	
3-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	CH	1	
3-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	CH	1	
3-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	CH	1	
3-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	CH	1	
3-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	CH	1	
3-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-52	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	N	1	
3-53	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-54	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-55	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-56	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-57	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-58	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-59	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-60	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-61	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-62	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	l	m.p. (°C)
3-63	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-64	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-65	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	CH	1	
3-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-67	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	CH	1	
3-68	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	CH	1	
3-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	CH	1	
3-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-73	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	CH	1	
3-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	CH	1	
3-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	CH	1	
3-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	CH	1	
3-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	CH	1	
3-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	CH	1	
3-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	CH	1	
3-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	CH	1	
3-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	CH	1	
3-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	CH	1	
3-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	CH	1	
3-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	CH	1	
3-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	CH	1	
3-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	CH	1	
3-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	CH	1	
3-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	CH	1	
3-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	CH	1	
3-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	CH	1	
3-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	CH	1	
3-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargyl	CH	1	
3-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	CH	1	
3-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	CH	1	
3-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	CH	1	
3-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	CH	1	
3-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	CH	1	
3-100	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	CH	1	
3-101	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-102	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-103	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-104	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-106	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-108	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-110	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-111	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-112	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	2	
3-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-115	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	CH	1	
3-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-118	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	CH	1	
3-119	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	

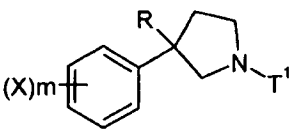
Table 4



	(X)m	R	Y	T ⁴	A	m.p. (°C)
4-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	CH	
4-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	CH	
4-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	CH	
4-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Et	CH	161-163
4-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	CH	
4-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	CH	
4-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	CH	
4-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	CH	
4-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	CH	
4-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	CH	
4-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	CH	
4-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	CH	
4-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	CH	
4-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	CH	
4-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	CH	184-186
4-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	CH	
4-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	CH	
4-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	CH	
4-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	CH	
4-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	146-148
4-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	142-144
4-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-31	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-32	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-33	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-34	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-35	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-36	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-37	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-38	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-39	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-40	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-41	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-42	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-43	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-44	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-45	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-46	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	N	
4-47	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-48	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-49	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	

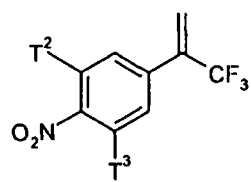
	(X)m	R	Y	T ⁴	A	m.p. (°C)
4-50	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-52	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-54	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	CH	
4-55	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-56	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-57	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	CH	
4-58	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	CH	
4-59	3,5-diCl	CF3	H	CO2Bu-t	N	
4-60	3,5-diCl	CF3	H	CO2H	N	
4-61	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-62	3,5-diCl	CF3	CF3	F	CH	
4-63	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	CH	
4-64	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	CH	
4-65	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	CH	
4-66	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-67	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	CH	

Table 5



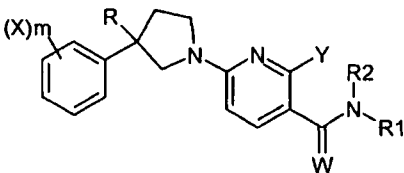
	(X)m	R	T ¹	m.p. °C)
5-1	2-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-2	2-Cl	CF ₃	H	
5-3	3-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-4	3-Cl	CF ₃	H	
5-5	4-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-6	4-Cl	CF ₃	H	
5-7	2,3-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-8	2,3-diCl	CF ₃	H	
5-9	3,4-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-10	3,4-diCl	CF ₃	H	
5-11	3,5-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-12	3,5-diCl	CF ₃	H	
5-13	3,5-diCl	CF ₃	H, HCl salt	
5-14	3,4,5-triCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-15	3,4,5-triCl	CF ₃	H	
5-16	3-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-17	3-CF ₃	CF ₃	H	
5-18	3,5-diCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	H	
5-20	3-Br	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-21	3-Br	CF ₃	H	
5-22	3,5-diBr	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-23	3,5-diBr	CF ₃	H	
5-24	3-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-25	3-NO ₂	CF ₃	H	
5-26	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	
5-28	3-CN	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-29	3-CN	CF ₃	H	
5-30	3-OCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-31	3-OCF ₃	CF ₃	H	
5-32	3-SCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-33	3-SCF ₃	CF ₃	H	
5-34	3-S(O)CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-35	3-S(O)CF ₃	CF ₃	H	
5-36	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-37	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	H	
5-38	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-39	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	H	

Table 6



	T ²	T ³	m.p. (°C)
6-1	CH ₃	CH ₃	
6-2	CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-4	n-Pr	n-Pr	
6-5	iso-Pr	iso-Pr	
6-6	cyclo-Pr	cyclo-Pr	
6-7	n-Bu	n-Bu	
6-8	tert-Bu	tert-Bu	
6-9	n-Pen	n-Pen	

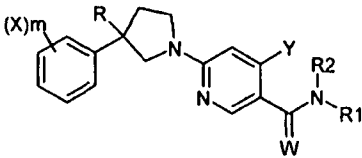
Table 7



	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. °C)
7-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
7-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
7-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	O	
7-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
7-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	O	
7-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
7-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	O	
7-11	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	O	
7-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
7-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
7-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	O	
7-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-19	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	O	
7-26	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
7-27	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	O	
7-28	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	O	
7-29	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	O	
7-30	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	O	
7-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
7-32	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
7-33	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	O	
7-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
7-35	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
7-36	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	O	
7-37	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	O	
7-38	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	O	
7-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-40	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	O	
7-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-42	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-PyridylCH2	H	O	
7-43	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-44	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-45	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-46	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-47	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-48	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-49	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. °C
7-50	3-CF ₃ S	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-51	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-52	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-53	3-OH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-54	3-SH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-55	3,4-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-56	3,4-diCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-57	3,4,5-triCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-58	3,4,5-triCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-59	3,5-diBr	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-60	3,5-diBr	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-61	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-62	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-63	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	S	
7-64	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	H	H	O	
7-65	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me	H	O	
7-66	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	iso-Pr	H	O	
7-67	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	PhCH ₂	H	O	
7-68	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	O	
7-69	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CONMe	H	O	
7-70	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ (cyclo)Pr	H	O	
7-71	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ Me	H	O	
7-72	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ CF ₃	H	O	
7-73	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ =CHCH ₂	H	O	
7-74	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	HCCCH ₂	H	O	
7-75	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CN	H	O	
7-76	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	C(Me) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	O	
7-77	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-F-Ph	H	O	
7-78	3,5-diCl	CH ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-79	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	CH ₃	O	
7-80	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-81	3,5-diCl	CF ₃	Cl	2-PyridylCH ₂	H	S	
7-82	2-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-83	2,3-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-84	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-PyridylCH ₂	H	O	
7-85	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	4-PyridylCH ₂	H	O	
7-86	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-87	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-88	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridinylCH ₂	H	O	
7-89	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH ₂	H	O	
7-90	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-91	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-92	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me ₂ NCH=		O	
7-93	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	EtON=CH	H	O	
7-94	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-95	4-Cl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-96	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-97	3,5-diCl	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-98	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	H	H	O	
7-99	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-100	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	

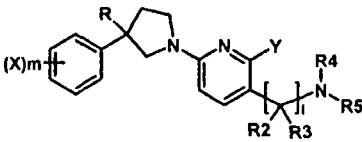
Table 8



	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. (°C)
8-1	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
8-2	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-3	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
8-4	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	O	
8-5	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
8-6	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	O	
8-7	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
8-8	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	O	
8-9	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	O	
8-10	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
8-11	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
8-12	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	O	
8-13	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-14	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-15	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-16	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-17	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-18	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-19	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-20	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-21	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-22	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-23	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	O	
8-24	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
8-25	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
8-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	O	
8-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	O	
8-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	O	
8-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	O	
8-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
8-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
8-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	O	
8-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
8-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
8-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	O	
8-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	O	
8-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	O	
8-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	O	
8-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-PyridylCH2	H	O	
8-42	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-43	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-44	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-45	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-46	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-49	3-CF3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. °C)
8-50	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-51	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-52	3-OH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-53	3-SH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-54	3,4-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-55	3,4-diCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-56	3,4,5-triCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-57	3,4,5-triCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-58	3,5-diBr	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-59	3,5-diBr	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-60	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-61	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-62	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	S	
8-63	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	H	H	O	
8-64	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me	H	O	
8-65	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	iso-Pr	H	O	
8-66	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	PhCH ₂	H	O	
8-67	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	O	
8-68	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CONMe	H	O	
8-69	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ (cyclo)Pr	H	O	
8-70	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ Me	H	O	
8-71	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ CF ₃	H	O	
8-72	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ =CHCH ₂	H	O	
8-73	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	HCCCH ₂	H	O	
8-74	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CN	H	O	
8-75	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	C(Me) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	O	
8-76	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-F-Ph	H	O	
8-77	3,5-diCl	CH ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-78	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	CH ₃	O	
8-79	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-80	3,5-diCl	CF ₃	Cl	2-PyridylCH ₂	H	S	
8-81	2-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-82	2,3-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-83	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-PyridylCH ₂	H	O	
8-84	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	4-PyridylCH ₂	H	O	
8-85	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-86	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-87	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridinylCH ₂	H	O	
8-88	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH ₂	H	O	
8-89	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-90	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-91	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me ₂ NCH=		O	
8-92	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	EtON=CH	H	O	
8-93	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-94	4-Cl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-95	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-96	3,5-diCl	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-97	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	H	H	O	
8-98	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-99	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	

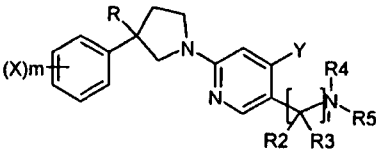
Table 9



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	m.p. (°C)
9-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	1	
9-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	1	
9-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
9-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
9-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
9-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
9-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
9-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
9-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
9-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
9-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
9-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
9-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
9-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
9-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
9-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
9-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	1	
9-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
9-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	1	
9-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	1	
9-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
9-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
9-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
9-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	1	
9-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
9-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
9-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
9-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
9-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
9-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
9-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
9-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
9-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	1	
9-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p. (°C)
9-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-52	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-53	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-54	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-55	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-56	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-57	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-58	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-59	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-60	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-61	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-62	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-63	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-64	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
9-65	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
9-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
9-67	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	1	
9-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
9-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
9-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
9-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
9-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
9-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
9-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
9-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
9-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	1	
9-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
9-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
9-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	1	
9-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	1	
9-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	1	
9-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
9-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
9-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
9-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
9-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
9-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
9-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
9-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
9-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	1	
9-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargyl	1	
9-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
9-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
9-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
9-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
9-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
9-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
9-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
9-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
9-100	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-101	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-102	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
9-103	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-104	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-106	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-108	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-110	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-111	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
9-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
9-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
9-118	3,4,-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

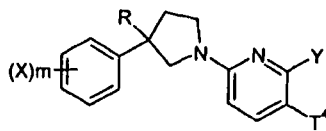
Table 10



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p. (°C)
10-1	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-2	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-3	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
10-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
10-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
10-6	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
10-7	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
10-8	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
10-9	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-10	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
10-11	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
10-12	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
10-13	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
10-14	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
10-15	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
10-16	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-17	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-18	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
10-19	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
10-20	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-21	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-22	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-23	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	H	H	H	COCH3	1	
10-24	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	1	
10-25	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
10-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	1	
10-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	1	
10-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
10-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
10-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
10-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	1	
10-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
10-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
10-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
10-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
10-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
10-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
10-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
10-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
10-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	1	
10-43	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-44	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-45	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-46	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-47	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-48	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-49	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

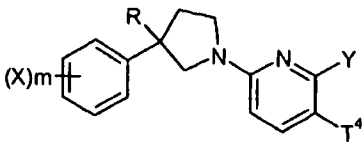
	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p. (°C)
10-50	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-51	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-52	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-53	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-54	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-55	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-56	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-57	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-58	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-59	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-60	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-61	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-62	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
10-63	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
10-64	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
10-65	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	1	
10-66	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
10-67	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
10-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
10-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
10-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
10-71	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
10-72	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
10-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
10-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	1	
10-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
10-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
10-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	1	
10-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	1	
10-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	1	
10-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
10-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
10-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
10-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
10-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
10-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
10-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
10-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
10-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	1	
10-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargyl	1	
10-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
10-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
10-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
10-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
10-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
10-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
10-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
10-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
10-98	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-99	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-100	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
10-101	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-102	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-103	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-104	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-105	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-106	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-107	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-108	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-109	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
10-110	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-111	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
10-113	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-114	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
10-116	3,4, -diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

Table 11



	(X)m	R	Y	T	m.p. °C)
11-1	3,5-diCl	CF3	NO2	CO2Me	
11-2	3,5-diCl	CF3	NO2	CO2H	
11-3	3,5-diCl	CF3	NH2	CO2Me	
11-4	3,5-diCl	CF3	F	CO2Me	
11-5	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	
11-6	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Bu-t	
11-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2H	
11-8	3,5-diCl	CF3	Br	CO2Me	
11-9	3,5-diCl	CF3	I	CO2Me	
11-10	3,5-diCl	CF3	CH3	CO2Me	
11-11	3,5-diCl	CF3	Cl	CH3	
11-12	3,5-diCl	CF3	CN	F	
11-13	3,5-diCl	CF3	CH3	NO2	
11-14	3,5-diCl	CF3	CH3	NH2	
11-15	3,5-diCl	CF3	Br	NO2	
11-16	3,5-diCl	CF3	Br	NH2	
11-17	3-CF3	CF3	NO2	CO2Me	
11-18	3-CF3	CF3	NO2	CO2H	
11-19	3,5-diCF3	CF3	NO2	CO2Me	
11-20	3,5-diCF3	CF3	NO2	CO2H	
11-21	3,4-diCl	CF3	NO2	CO2Me	
11-22	3,4-diCl	CF3	NO2	CO2H	
11-23	3-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
11-24	3-Cl	CF3	NO2	CO2H	
11-25	3,5-diBr	CF3	NO2	CO2Me	
11-26	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
11-27	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
11-28	3-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
11-29	3-CH3	CF3	NO2	CO2Me	
11-30	3-CH3O	CF3	NO2	CO2Me	
11-31	3-CN	CF3	NO2	CO2Me	
11-32	3-CF3O	CF3	NO2	CO2Me	
11-33	3-CH3S	CF3	NO2	CO2Me	
11-34	3-CH3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
11-35	3-CH3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
11-36	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	
11-37	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
11-38	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
11-39	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	
11-40	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	
11-41	3-NO2	CF3	NO2	CO2H	
11-42	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	
11-43	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
11-44	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	
11-45	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
11-46	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	
11-47	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	
11-48	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	
11-49	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	
11-50	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
11-51	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	
11-52	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	
11-53	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	
11-54	3,5-diCl	CF3	CF3	F	
11-55	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	
11-56	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	
11-57	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	
11-58	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	
11-59	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	

Table 12



	(X)m	R	Y	T ⁴	m.p. (°C)
12-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	
12-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	
12-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	
12-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	
12-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	
12-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
12-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
12-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
12-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
12-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
12-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
12-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
12-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
12-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
12-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
12-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
12-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
12-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
12-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
12-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-31	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-32	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-33	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-34	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-35	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-36	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-37	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-38	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-39	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-40	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	

	(X)m	R	Y	T ⁴	m.p. °C)
12-41	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	
12-42	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
12-43	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
12-44	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	
12-45	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	
12-46	3-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-47	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	
12-48	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-49	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-50	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-52	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	
12-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	
12-54	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-55	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-56	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	
12-57	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	
12-58	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	
12-59	3,5-diCl	CF3	CF3	F	
12-60	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	
12-61	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	
12-62	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	
12-63	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	
12-64	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	

Table 13

	1H-NMR
1-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.50-2.60 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.49-3.65 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.61 (2H, d), 7.21 (1H, dd), 7.29 (2H, d), 7.33-7.40 (3H, m), 7.68 (1H, td),
1-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.56 (4H, m), 2.83-2.87 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.00-4.15 (3H, m), 6.03 (1H, br s), 6.38-6.41 (2H, m), 7.26-7.39 (4H, m).
1-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.49-2.55 (4H, m), 2.80-2.88 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.08 (1H, d), 4.71 (2H, d), 6.39-6.41 (2H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.32-7.43 (4H, m), 7.65-7.68 (1H, m),
1-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.50-2.63 (1H, m), 2.86-2.90 (1H, m), 3.53-3.58 (2H, m), 3.78-3.81 (1H, m), 4.10-4.14 (1H, m), 4.78 (2H, d), 6.23-6.28 (1H, m), 6.43-6.46 (1H, m), 7.17-7.40 (5H, m), 7.67-
1-7	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.57 (1H, m), 2.87-2.88 (1H, m), 3.51-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.08-4.19 (3H, m), 6.53-6.56 (2H, m), 6.87-6.91 (1H, m), 7.26-7.27 (1H, m), 7.39-7.42 (1H, m), 7.85-
1-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.60 (1H, m), 2.86-2.90 (1H, m), 3.53-3.56 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.09 (1H, d), 4.80 (2H, d), 6.52-6.56 (2H, m), 7.20-7.27 (2H, m), 7.38-7.39 (2H, m), 7.70-7.73 (2H, m),
1-9	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.56-2.58 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.51-3.58 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.10-4.14 (3H, m), 6.56-6.61 (2H, m), 6.75-6.76 (1H, m), 7.26-7.29 (1H, m), 7.40-7.40 (1H, m), 7.69
1-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.60 (1H, m), 2.85-2.90 (1H, m), 3.46-3.59 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.08 (1H, d), 4.77 (2H, d), 6.55-6.56 (1H, m), 6.75-6.78 (1H, m), 7.18-7.44 (5H, m), 7.65-7.70 (2H, m),
1-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 0.62-0.65 (2H, m), 0.83-0.89 (2H, m), 2.54-2.61 (1H, m), 2.86-2.90 (2H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.76 (1H, d), 4.06 (1H, d), 6.34 (1H, br s), 6.52-6.55 (1H, m), 6.71 (1H, d),
1-12	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.60 (1H, m), 2.74 (2H, t, J = 6.3 Hz), 2.86-2.90 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, m), 3.67-3.79 (3H, m), 4.08 (1H, d), 6.53-6.56 (1H, m), 6.74-6.81 (2H, m), 7.27-7.27 (1H, m),
1-15	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.56-2.66 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.52-3.68 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.04-4.16 (3H, m), 6.09 (1H, t), 6.75 (1H, dd), 7.10 (1H, d), 7.28 (2H, d), 7.40-7.43 (2H, m),
1-16	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.15-7.23 (2H, m), 7.28 (2H, br s), 7.37 (1H, d),
1-17	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.57-2.67 (1H, m), 2.88-2.98 (1H, m), 3.49-3.67 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.74 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.14 (1H, t), 7.21 (1H, dd), 7.26-7.38 (5H, m),
1-18	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.58-2.68 (1H, m), 2.91-3.00 (1H, m), 3.50-3.68 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.04-4.17 (3H, m), 6.06 (1H, t), 6.75 (1H, d), 7.10 (1H, s), 7.26-7.42 (5H, m).
1-21	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.61-2.72 (1H, m), 2.98-3.06 (1H, m), 3.53-3.70 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.09 (2H, dt), 4.22 (1H, d), 6.08 (1H, t), 6.76 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 7.42 (1H, d), 7.57-7.69 (4H, m).
1-22	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.62-2.73 (1H, m), 3.03-3.11 (1H, m), 3.57-3.73 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.27 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.79 (1H, dd), 7.12 (1H, d), 7.16-7.24 (2H, m), 7.37 (1H, d), 7.51 (1H, d), 7.70 (1H, td), 7.84 (2H, br s), 7.95 (1H, br s), 8.52 (1H, d).
1-23	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.63-2.73 (1H, m), 3.04-3.13 (1H, m), 3.58-3.74 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.10 (2H, td), 4.28 (1H, d), 6.07 (1H, t), 6.80 (1H, dd), 7.15 (1H, d), 7.43 (1H, d), 7.83 (2H, br s), 7.95
1-25	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.61 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.52-3.64 (2H, m), 3.81 (1H, d), 4.11 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.69-6.72 (1H, m), 6.82-6.83 (1H, m), 7.15-7.40 (5H, m), 7.50-7.53 (1H, m),
1-27	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.63 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.55-3.62 (2H, m), 3.81-3.87 (1H, m), 4.11-4.14 (1H, m), 4.78 (2H, d), 6.76-6.79 (1H, m), 6.87-6.88 (1H, m), 7.26-7.35 (5H, m), 7.57-7.60 (1H, m), 7.68-7.70 (1H, m), 7.79-7.82 (1H, m), 8.55-8.57 (1H,
1-31	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.45 (3H, s), 3.56-3.68 (2H, m), 3.82-3.86 (1H, m), 4.14-4.17 (1H, m), 4.74 (2H, d, J = 5.1 Hz), 6.72-6.75 (1H, m), 7.18-7.21 (1H, m), 7.28-7.29 (4H, m), 7.36-7.41 (2H, m), 7.53-7.55 (1H, m), 7.67-7.
1-38	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.46-2.56 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.77 (1H, d), 4.06 (1H, d), 4.70 (2H, d), 5.79 (2H, d), 5.97-6.00 (1H, m), 7.18-7.41 (7H, m), 7.65-7.68 (1H, m), 8.56
1-39	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.61 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.55-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.36-6.39 (1H, m), 7.25-7.36 (4H, m), 7.64-7.70 (2H, m), 7.92-7.95 (2H, m),
1-54	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.64 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.49-3.66 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.74 (1H, dd), 7.07 (1H, d), 7.16-7.27 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.47-7.52 (3H,
1-56	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.62 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.52-3.67 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.21 (2H, t), 7.36 (1H, d), 7.42 (2H, s), 7.49 (1H,
1-57	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.03-4.15 (3H, m), 6.08 (1H, br s), 6.75 (1H, dd), 7.10 (1H, s), 7.40-7.42 (3H, m).
1-60	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.36 (6H, s), 2.56-2.66 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.74 (2H, d, J = 4.9 Hz), 6.75 (1H, dd), 7.09 (1H, d), 7.15-7.23 (4H, m), 7.37
1-61	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.37 (6H, s), 2.57-2.68 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.52-3.68 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.03-4.18 (3H, m), 6.09 (1H, t), 6.75 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 7.15 (2H, s), 7.41 (1H, d).
1-63	1H-NMR (acetone-d ₆) δ: 2.72-2.85 (1H, m), 3.03-3.07 (1H, m), 3.63-3.71 (2H, m), 4.04 (1H), 4.38 (1H, d), 6.58 (1H, br s), 6.85-6.88 (1H, m), 7.02 (1H, d), 7.23 (1H, br s), 7.53-7.59 (4H, m).

	1H-NMR
1-73	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.09 (1H, s), 2.58-2.62 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.57-3.61 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H), 4.22 (2H, q), 6.04 (1H, br s), 6.73-6.75 (1H, m), 7.07 (1H, d), 7.27-7.28 (2H, m).
1-74	1H-NMR (acetone-d ₆) δ: 2.77-2.85 (1H, m), 3.08-3.10 (1H, m), 3.66-3.68 (2H, m), 4.09 (1H, d), 4.33-4.46 (3H, m), 6.94-6.97 (1H, m), 7.14 (1H, d), 7.55-7.63 (3H, m), 8.20-8.23 (1H, m).
1-75	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.50 (6H, s), 2.17 (3H, s), 2.57-2.62 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.02 (2H, s), 3.56-3.59 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.11 (1H, d), 5.82 (1H, br s), 6.71-6.73 (1H, m), 7.05 (1H, d).
1-78	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.64 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.79 (2H, d), 6.95 (1H, dd), 7.17-7.21 (1H, m), 7.28 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.41 (1H, t), 7.65 (1H, td), 7.96 (1H, d), 8.10 (1H, d), 8.66-8.58 (2H, m).
1-80	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.64-2.75 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.54-3.73 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.04-4.15 (2H, m), 4.25 (1H, d), 6.04 (1H, t), 6.78 (1H, dd), 7.13 (1H, d), 7.43 (1H, d), 7.65 (1H, t), 7.76 (1H, d).
1-81	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.61 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.45-3.61 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.08 (1H, d), 5.08 (2H, d), 6.49-6.54 (2H, m), 7.22-7.28 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.40 (1H, t), 7.72 (1H, d).
1-82	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.65-2.77 (1H, m), 3.18-3.26 (1H, m), 3.59 (2H, d), 3.99 (1H, d), 4.48 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.76 (1H, dd), 7.08-7.51 (9H, m), 7.70 (1H, td), 8.53 (1H, d).
1-83	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.65-2.76 (1H, m), 3.18-3.25 (1H, m), 3.59 (2H, d), 3.99 (1H, d), 4.49 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.76 (1H, dd), 7.07-7.38 (6H, m), 7.53 (2H, dt), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d).
1-84	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.61-2.64 (1H, m), 2.89-2.93 (1H, m), 3.57-3.60 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.62 (2H, d), 6.42 (1H, br s), 6.71-6.74 (1H, m), 7.06 (1H, d), 7.27-7.42 (5H, m), 7.79 (1H, d).
1-85	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.57-2.63 (1H, m), 2.88-2.94 (1H, m), 3.54-3.63 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.59 (2H, d), 6.64-6.74 (2H, m), 7.05 (1H, d), 7.28 (4H, d), 7.41-7.43 (2H, m), 8.51-8.53 (1H, d).
1-86	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.56-3.68 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.74-6.79 (2H, m), 7.09-7.10 (1H, m), 7.25-7.50 (5H, m), 7.68 (1H, t).
1-87	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.57-2.65 (1H, m), 2.90-2.95 (1H, m), 3.50-3.62 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.53 (2H, d), 6.66-6.70 (2H, m), 7.02 (1H, d), 7.25-7.41 (5H, m), 7.72-7.74 (1H, m), 8.26 (1H, d).
1-88	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.58-2.63 (1H, m), 2.91-2.95 (1H, m), 3.53-3.68 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.88 (2H, d), 6.75-6.78 (1H, m), 7.08 (1H, d), 7.20-7.29 (4H, m), 7.41-7.41 (1H, m), 7.55 (1H, d).
1-90	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.56-2.61 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.65 (2H, m), 3.81 (1H, d), 3.99-4.13 (3H, m), 6.20-6.22 (1H, m), 6.68-6.71 (1H, m), 6.81 (1H, d), 7.27-7.28 (2H, m), 8.47-8.50 (1H, d).
1-91	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.60 (1H, m), 2.88-2.92 (1H, m), 3.52-3.65 (2H, m), 3.81 (1H, d), 4.11 (1H, d), 4.67 (2H, d), 6.74-6.82 (3H, m), 7.23-7.28 (4H, m), 7.38-7.39 (1H, m), 7.50 (1H, d), 7.64 (1H, d).
1-92	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.12 (6H, d), 3.53-3.63 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.62-6.67 (2H, m), 7.25-7.28 (1H, m), 7.40 (1H, d), 8.04 (1H, d), 8.54 (1H, d).
1-93	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.28 (3H, t), 2.59-2.64 (1H, m), 2.93-2.97 (1H, m), 3.58-3.67 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.10-4.18 (3H, m), 6.75-6.78 (1H, m), 7.09-7.50 (4H, m), 7.70-7.72 (1H, m), 8.47-8.50 (1H, d).
1-95	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.65 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.47-3.65 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.73 (2H, d), 6.73 (1H, dd), 7.06 (1H, d), 7.23-7.15 (2H, m), 7.31-7.41 (5H, m), 7.48 (1H, d).
1-96	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.56-2.67 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.48-3.67 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.03-4.16 (3H, m), 6.06 (1H, br s), 6.73 (1H, dd), 7.09 (1H, d), 7.33 (2H, d), 7.38-7.42 (3H, m).
1-97	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.58-2.63 (1H, m), 2.91-2.96 (1H, m), 3.55-3.67 (2H, m), 3.81-3.84 (1H, m), 4.07-4.18 (3H, m), 6.70-6.80 (3H, m), 7.27-7.42 (3H, m), 7.75-7.78 (1H, m).
1-98	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.63 (1H, m), 2.89-2.92 (1H, m), 3.21-3.35 (1H, m), 3.59-3.78 (3H, m), 4.10-4.13 (1H, m), 5.94-5.97 (2H, m), 6.73-6.85 (2H, m), 7.23-7.56 (4H, m).
1-99	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.63-2.68 (1H, m), 3.02-3.07 (1H, m), 3.55-3.71 (2H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 4.23-4.26 (1H, m), 4.74 (2H, d), 6.74-6.77 (1H, m), 6.86-6.86 (1H, m), 7.07-7.10 (1H, m), 7.20-7.22 (1H, m), 7.31-7.34 (1H, m), 7.53-7.56 (1H, m), 7.68-7.70 (1H, m).
1-100	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.65-2.67 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.59-3.66 (2H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 4.11-4.20 (3H, m), 5.99-6.02 (1H, m), 6.76-6.85 (2H, m), 7.50-7.53 (1H, m), 7.84-7.95 (3H, m).
1-101	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.64 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.54-3.70 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.04-4.18 (3H, m), 6.94 (1H, dd), 7.29 (2H, s), 7.41 (1H, t), 7.92 (1H, d), 8.14-8.06 (2H, m).
1-102	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.46-2.61 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.50-3.60 (2H, m), 3.77-3.81 (1H, m), 4.07-4.10 (1H, m), 4.70 (2H, d, J = 4.9 Hz), 6.67-6.70 (1H, m), 6.80-6.81 (1H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.30-7.32 (1H, m), 7.40-7.43 (2H, m), 7.48-7.51 (1H, m), 7.
2-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.65 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.50-3.68 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.71 (2H, d), 7.30 (2H, d), 7.41 (1H, t), 7.54 (2H, d), 8.85 (1H, s).
2-29	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.14 (3H, s), 2.54-2.64 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.49-3.65 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.51-6.54 (2H, m), 7.17 (1H, d), 7.30 (2H, d), 7.41 (1H, t), 8.68 (1H, s).
2-31	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.59-2.69 (1H, m), 2.92-3.01 (1H, m), 3.57-3.73 (2H, m), 3.88 (1H, d), 4.18 (1H, d), 6.83 (1H, dd), 6.94 (1H, d), 7.44-7.30 (4H, m), 8.73 (1H, s).
2-40	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.62-2.73 (1H, m), 2.95-3.03 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.31 (1H, d), 7.09 (1H, dd), 7.29 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.68 (2H, d), 7.71 (1H, t), 8.26 (1H, s), 8.98 (1H, d).

	1H-NMR
3-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.99 (3H, s), 2.50-2.58 (1H, m), 2.82-2.87 (1H, m), 3.45-3.51 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H, d), 4.41 (2H, d), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58 (1H, d), 7.26-7.38 (4H, m).
3-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.98-2.02 (3H, m), 2.53-2.61 (1H, m), 2.81-2.89 (1H, m), 3.46-3.52 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H), 4.42-4.44 (2H, m), 5.78-5.81 (1H, m), 6.49-6.51 (1H, m), 6.77 (1H, d).
3-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.13-2.18 (3H, m), 2.51-2.53 (1H, m), 2.81-2.83 (1H, m), 3.45-3.56 (2H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.01-4.04 (1H, m), 4.25 (1H, s), 4.57 (1H, s), 6.40-6.44 (2H, m), 6.93-6.96 (1H, m).
3-102	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.03 (3H, s), 2.53-2.60 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.51-3.59 (2H, m), 3.78-3.82 (1H, m), 4.07-4.13 (1H, m), 4.50-4.55 (2H, m), 5.72-5.76 (1H, m), 6.70-6.78 (2H, m), 7.27-
3-113	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.99 (3H, s), 2.58-2.68 (1H, m), 2.99-3.03 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83-3.86 (1H, m), 4.18-4.21 (1H, m), 4.50 (2H, d), 5.73-5.76 (1H, m), 6.74-6.81 (2H, m), 7.47-7.50
4-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.56-2.64 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.63-3.67 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.19 (1H, d), 6.57 (2H, d), 7.27 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.18 (2H, d).
4-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.56-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.59 (2H, d), 7.26 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 7.52 (2H, d).
4-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.45-2.54 (1H, m), 2.74-2.82 (1H, m), 3.34-3.47 (4H, m), 3.73 (1H, d), 3.93 (1H, d), 6.49-6.51 (2H, m), 6.67-6.71 (2H, m), 7.30 (2H, br s), 7.36 (1H, t).
4-5	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.58-2.72 (1H, m), 2.88-3.01 (1H, m), 3.41-3.53 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.26 (1H, d), 6.71 (2H, d), 7.65-7.72 (3H, m), 7.78 (2H, d), 12.25 (1H, br s).
4-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.67 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.26 (3H, s), 7.42 (1H, t), 7.81 (1H, d).
4-7	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.58-2.72 (1H, m), 2.91-3.04 (1H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.65 (2H, d), 7.71 (1H, t), 7.78 (1H, d).
4-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.46-2.56 (1H, m), 2.79-2.85 (1H, m), 3.52-3.57 (2H, m), 3.76-3.86 (4H, m), 4.01-4.12 (1H, m), 5.68-5.76 (2H, m), 5.87-5.99 (1H, m), 6.26-6.32 (2H, m), 7.38-7.41 (1H, m).
4-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.58 (1H, m), 2.86-2.92 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.80 (1H, d), 3.87 (3H, s), 4.11 (1H, d), 6.45-6.48 (1H, m), 6.61 (1H, d), 7.26-7.27 (2H, m), 7.40-7.41 (1H, m), 7.88
4-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.59 (9H, s), 2.54-2.56 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.53-3.56 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.09 (1H, d), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58 (1H, d), 7.24-7.26 (2H, m), 7.40-7.40 (1H, m), 7.80
4-12	1H-NMR (acetone-d ₆) δ: 2.74-2.84 (1H, m), 3.05-3.10 (1H, m), 3.64-3.69 (2H, m), 4.04 (1H, d), 4.40 (1H, d), 6.70-6.77 (2H, m), 7.55-7.65 (3H, m), 7.91 (1H, d).
4-13	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.60 (1H, m), 2.84-2.93 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.80-3.87 (4H, m), 4.11 (1H, d), 6.49-6.52 (1H, m), 6.84 (1H, d), 7.26-7.27 (2H, m), 7.40-7.41 (1H, m), 7.87 (1H, d).
4-14	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.56 (1H, m), 2.85-2.86 (1H, m), 3.51-3.57 (2H, m), 3.74-3.87 (4H, m), 4.09 (1H, d), 6.54-6.56 (1H, m), 7.17-7.18 (1H, m), 7.27-7.31 (2H, m), 7.38-7.39 (1H, m), 7.85
4-15	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.60 (4H, m), 2.84-2.85 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.79-3.84 (4H, m), 4.11 (1H, d), 6.39-6.44 (2H, m), 7.26-7.29 (2H, m), 7.39-7.39 (1H, m), 7.91-7.94 (1H, m).
4-16	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.27 (3H, s), 2.49-2.54 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.38-3.54 (2H, m), 3.74 (1H, d, J = 10.4 Hz), 3.99 (1H, d, J = 10.4 Hz), 6.40-6.43 (1H, m), 6.60-6.62 (1H, m), 7.05-7.08
4-18	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.64 (1H, m), 2.67 (3H, s), 2.87-2.95 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.17 (1H, d), 6.37 (1H, d), 6.45 (1H, dd), 7.28 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 8.14 (1H, d).
4-19	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.19 (3H, s), 2.41-2.58 (1H, m), 2.73-2.81 (1H, m), 3.15-3.51 (4H, m), 3.73 (1H, d), 3.92 (1H, d), 6.34-6.44 (2H, m), 6.66 (1H, d), 7.31-7.41 (3H, m).
4-20	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.16 (1H, d), 6.53 (1H, dd), 6.84 (1H, d), 7.27 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.07 (1H, d).
4-21	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.44-2.54 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 3.32-3.50 (2H, m), 3.56-3.76 (3H, m), 3.92 (1H, d), 6.46 (1H, dd), 6.70-6.78 (2H, m), 7.29 (2H, br s), 7.37 (1H, t).
4-23	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.63-2.75 (1H, m), 2.96-3.12 (1H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 3.91 (1H, d), 4.41 (1H, d), 6.88 (1H, dd), 7.06 (1H, d), 7.67-7.90 (5H, m), 13.00 (1H, br s).
4-24	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.61-2.73 (1H, m), 3.03-3.13 (1H, m), 3.58-3.75 (2H, m), 3.85 (3H, s), 3.89 (1H, d), 4.29 (1H, d), 6.73 (1H, dd), 6.79 (1H, d), 7.80-7.85 (3H, m), 7.95 (1H, br s).
4-25	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.66-2.80 (1H, m), 3.11-3.22 (1H, m), 3.51-3.61 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.51 (1H, d), 6.90 (1H, d), 7.06 (1H, br s), 7.81 (1H, t), 8.22 (3H, br s), 13.03 (1H, br s).
4-26	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.54-2.64 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.69 (2H, m), 3.84 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.68 (1H, dd), 6.74 (1H, d), 7.22 (1H, dd), 7.47-7.52 (2H, m), 7.81 (1H, m).
4-27	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.59-2.74 (1H, m), 2.90-3.00 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.30 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.03 (1H, d), 7.55 (1H, d), 7.73-7.86 (3H, m), 12.98 (1H, br s).
4-29	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.59-2.71 (1H, m), 2.90-3.01 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.31 (1H, d), 6.87 (1H, dd), 7.05 (1H, d), 7.50 (3H, br s), 7.64 (1H, br s), 7.78 (1H, d), 13.00 (1H, m).

	1H-NMR
4-32	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.36 (6H, s), 2.56-2.66 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.52-3.69 (2H, m), 3.93-3.84 (4H, m), 4.17 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.14 (2H, s), 7.81 (1H, d).
4-33	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.63-2.73 (1H, m), 3.01-3.09 (1H, m), 3.55-3.73 (2H, m), 3.85 (3H, s), 3.92 (1H, d), 4.26 (1H, d), 6.71 (1H, dd), 6.77 (1H, d), 7.62-7.83 (3H, m), 8.27-8.31 (2H, m).
4-47	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.66-2.77 (1H, m), 3.01-3.10 (1H, m), 3.50-3.62 (2H, m), 3.95 (1H, d), 4.43 (1H, d), 6.89 (1H, d), 7.08 (1H, s), 7.75-7.81 (2H, m), 8.03 (1H, d), 8.28-8.35 (2H, m), 13.02
4-48	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.60-2.72 (1H, m), 2.94-3.05 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.87 (1H, d), 7.03 (1H, s), 7.79 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.88 (2H, s), 13.03 (1H, s).
4-49	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.64-2.75 (1H, m), 3.18-3.25 (1H, m), 3.55-3.63 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.98 (1H, d), 4.50 (1H, d), 6.67-6.74 (2H, m), 7.32-7.48 (4H, m), 7.82 (1H, d).
4-50	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.67-2.78 (1H, m), 3.23-3.37 (1H, m), 3.46-3.64 (2H, m), 3.91 (1H, d), 4.57 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.43-7.56 (3H, m), 7.64-7.68 (1H, m), 7.80 (1H, d), 13.01
4-51	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.55-2.65 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.49-3.67 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.86 (1H, d), 4.14 (1H, t), 6.66 (1H, dd), 6.73 (1H, d), 7.32 (2H, d), 7.40 (2H, d), 7.80 (1H, d).
4-52	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.58-2.68 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.45-3.60 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.28 (1H, d), 6.85 (1H, dd), 7.03 (1H, d), 7.52 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.78 (1H, d), 13.02 (1H, br s).
4-53	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.37 (3H, t), 2.56-2.61 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.58-3.66 (2H, m), 3.82-3.85 (1H, m), 4.12-4.16 (1H, m), 4.35 (2H, q), 6.67-6.70 (1H, m), 6.88-6.89 (1H, m), 7.25-7.28
4-56	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.82 (2H, d), 3.85 (3H, s), 4.14 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.41 (2H, s), 7.81 (1H, d).
4-57	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ: 2.64-2.67 (1H, m), 2.93-3.00 (1H, m), 3.49-3.52 (2H, m), 3.88-3.90 (1H, m), 4.31-4.35 (1H, m), 6.92-6.95 (1H, m), 7.18-7.21 (1H, m), 7.67-7.69 (3H, m), 7.89-7.92 (1H, m)
4-58	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.57-2.63 (1H, m), 2.91-2.96 (1H, m), 3.52-3.69 (2H, m), 3.82-3.86 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.11-4.18 (1H, m), 6.73-6.76 (1H, m), 6.89-6.90 (1H, m), 7.27-7.42 (3H, m), 8.01-
4-59	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.63 (9H, s), 2.53-2.63 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.28 (2H, d), 7.41 (1H, t), 7.95 (1H, d), 8.10 (1H, d).
4-60	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.58-2.69 (1H, m), 2.93-3.02 (1H, m), 3.63-3.73 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.27 (1H, d), 7.18 (1H, d), 7.26 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.41 (1H, s), 8.13 (1H, d), 8.20 (1H, s), 9.92 (1H,
4-61	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.37 (3H, t), 2.60-2.71 (1H, m), 3.01-3.09 (1H, m), 3.60-3.71 (2H, m), 3.88-3.90 (1H, m), 4.28-4.36 (3H, m), 6.71-6.74 (1H, m), 6.91-6.91 (1H, m), 7.84-7.97 (4H, m)
4-62	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.51-2.61 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.43-3.58 (2H, m), 3.77 (1H, d), 4.03 (1H, d), 6.71-6.66 (2H, m), 7.10 (1H, t), 7.29 (2H, s), 7.39 (1H, s).
4-63	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.57-2.68 (1H, m), 2.93-3.01 (1H, m), 3.75-3.59 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.20 (1H, d), 6.70 (1H, dd), 6.88 (1H, d), 7.28 (2H, d), 7.43 (1H, t), 8.08 (1H, d).
4-65	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.37 (3H, t), 2.53-2.58 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.53-3.62 (2H, m), 3.78-3.81 (1H, m), 4.08-4.16 (1H, m), 4.34 (2H, q), 6.25-6.36 (2H, m), 7.28-7.33 (3H, m), 7.84-7.87
4-66	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 1.36 (3H, t), 2.55-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.57-3.63 (2H, m), 3.80-3.84 (1H, m), 4.12-4.15 (1H, m), 4.33 (2H, q), 6.67-6.70 (1H, m), 6.87-6.88 (1H, m), 7.41-7.45
5-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.50-2.68 (2H, m), 2.74-2.82 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.16-3.20 (1H, m), 3.61-3.75 (3H, m), 7.20-7.41 (9H, m).
5-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.45-2.55 (1H, m), 2.76-2.85 (1H, m), 3.00-3.09 (1H, m), 3.22-3.35 (2H, m), 4.10 (1H, d), 7.23-7.44 (4H, m).
5-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.33-2.42 (1H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.74-2.78 (2H, m), 3.09 (1H, d), 3.18 (1H, d), 3.67 (2H, s), 7.26-7.38 (9H, m).
5-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.28-2.38 (1H, m), 2.49-2.59 (1H, m), 2.97-3.06 (1H, m), 3.19-3.30 (2H, m), 3.75 (1H, d), 7.28-7.33 (4H, m).
5-5	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.31-2.41 (1H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.70-2.81 (2H, m), 3.08 (1H, d), 3.18 (1H, d), 3.66 (2H, s), 7.24-7.33 (9H, m).
5-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.27-2.36 (1H, m), 2.49-2.59 (1H, m), 2.96-3.05 (1H, m), 3.20-3.29 (2H, m), 3.76 (1H, d), 7.28-7.36 (4H, m).
5-7	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.50-2.66 (2H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.16 (1H, dd), 3.61-3.75 (3H, m), 7.17 (1H, t), 7.25-7.35 (6H, m), 7.46 (1H, dd).
5-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.41-2.53 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.00-3.09 (1H, m), 3.23-3.32 (2H, m), 4.11 (1H, d), 7.18-7.30 (2H, m), 7.48 (1H, dd).
5-9	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.28-2.37 (1H, m), 2.54-2.62 (1H, m), 2.70-2.82 (2H, m), 3.06 (1H, d), 3.13 (1H, d), 3.66 (2H, s), 7.21-7.33 (6H, m), 7.41 (1H, d), 7.49 (1H, d).
5-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 2.25-2.34 (1H, m), 2.50-2.59 (1H, m), 2.97-3.08 (1H, m), 3.20-3.28 (2H, m), 3.75 (1H, d), 7.20 (1H, d), 7.44 (2H, d).

	1H-NMR
5-11	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.27-2.36 (1H, m), 2.53-2.62 (1H, m), 2.69-2.83 (2H, m), 3.08 (2H, dd), 3.67
5-12	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.24-2.33 (1H, m), 2.51-2.56 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.19-3.26 (2H, m), 3.74 (1H, d), 7.25 (2H, d), 7.35 (1H, t).
5-14	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.24-2.34 (1H, m), 2.53-2.61 (1H, m), 2.67-2.87 (2H, m), 3.06 (2H, dd), 3.67 (2H, dd), 7.24-7.43 (7H, m).
5-15	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.22-2.32 (1H, m), 2.49-2.58 (1H, m), 2.98-3.08 (1H, m), 3.20-3.29 (2H, m),
5-16	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.35-2.44 (1H, m), 2.60-2.68 (1H, m), 2.72-2.85 (2H, m), 3.16 (2H, dd), 3.68 (2H, dd), 7.28-7.34 (5H, m), 7.46 (1H, t), 7.55-7.60 (2H, m), 7.66 (1H, s).
5-17	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.32-2.41 (1H, m), 2.55-2.65 (1H, m), 2.98-3.07 (1H, m), 3.21-3.33 (2H, m), 3.82 (1H, d), 7.47-7.62 (4H, m).
5-18	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.29-2.40 (1H, m), 2.63-2.77 (2H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.09 (1H, d), 3.16 (1H, d), 3.62 (1H, d), 3.76 (1H, d, J = 13.0 Hz), 7.28-7.34 (5H, m), 7.83 (1H, s), 7.89 (2H, s).
5-19	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.30-2.39 (1H, m), 2.61-2.70 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.24-3.33 (2H, m), 3.86 (1H, d), 7.81 (2H, s), 7.87 (1H, s).
5-24	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.35-2.44 (1H, m), 2.63-2.90 (3H, m), 3.17 (2H, s), 3.69 (2H, dd), 7.26-7.34 (5H, m), 7.53 (1H, t), 7.74 (1H, d), 8.18 (1H, dq), 8.34 (1H, s).
5-25	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.34-2.43 (1H, m), 2.59-2.69 (1H, m), 3.01-3.10 (1H, m), 3.24-3.35 (2H, m), 3.85 (1H, d), 7.57 (1H, t), 7.72 (1H, d), 8.20-8.27 (2H, m).
5-26	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.31-2.42 (7H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.75-2.80 (2H, m), 3.11 (2H, dd), 3.67
5-27	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.29-2.38 (7H, m), 2.51-2.60 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.21-3.31 (2H, m),
6-1	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.34 (6H, s), 5.78-5.80 (1H, m), 6.03-6.04 (1H, m), 7.20 (2H, s).
7-1	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.52-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.60-3.77 (2H, m), 4.00 (1H, d), 4.18-4.07 (2H, m), 4.48 (1H, d), 6.16 (1H, t), 6.43 (1H, d), 7.30 (2H, d), 7.39 (1H, t), 7.95 (1H, dd), 8.62
7-2	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.52-2.62 (1H, m), 2.87-2.96 (1H, m), 3.59-3.75 (2H, m), 4.01 (1H, d), 4.48 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.43 (1H, d), 7.25-7.20 (1H, m), 7.31 (2H, d), 7.39 (1H, t), 7.47 (1H, s), 7.69
7-3	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.49-2.57 (1H, m), 2.60 (3H, s), 2.84-2.92 (1H, m), 3.59-3.70 (2H, m), 3.95-4.15 (3H, m), 4.45 (1H, d), 5.94 (1H, br s), 6.23 (1H, d), 7.26-7.39 (4H, m), 7.58 (1H, d)
7-7	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.54-2.61 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.65-3.68 (2H, m), 3.94-3.98 (1H, m), 4.10-4.16 (2H, m), 4.45-4.48 (1H, m), 6.37-6.40 (1H, m), 7.23-7.38 (4H, m), 8.12-8.15 (1H, m)
7-25	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.54-2.61 (1H, m), 2.88-2.92 (1H, m), 3.64-3.70 (2H, m), 3.98 (1H, d), 4.44 (1H, d), 4.73 (2H, d), 6.54 (1H, d), 7.14-7.40 (6H, m), 7.69-7.74 (2H, m), 8.52 (1H, d)
7-26	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.68-3.71 (2H, m), 4.05-4.16 (3H, m), 4.45 (1H, d), 6.03 (1H, br s), 6.55 (1H, d), 7.24-7.37 (4H, m), 7.72 (1H, d)
8-23	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.55-2.65 (1H, m), 2.92-2.97 (1H, m), 3.69-3.77 (2H, m), 3.97-4.01 (1H, m), 4.47-4.51 (1H, m), 4.75 (2H, d), 6.62 (1H, s), 7.24-7.36 (6H, m), 7.68-7.70 (1H, m), 8.51-8.52 (2H,
8-24	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.58-2.63 (1H, m), 2.93-2.97 (1H, m), 3.71-3.74 (2H, m), 3.96-4.09 (3H, m), 4.47-4.51 (1H, m), 6.42-6.44 (1H, m), 6.61 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.40 (1H, s), 8.41 (1H, s)
8-25	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.55-2.65 (1H, m), 2.91-2.97 (1H, m), 3.68-3.73 (2H, m), 3.97-4.01 (1H, m), 4.48-4.52 (1H, m), 5.74-5.77 (2H, m), 6.62 (1H, s), 7.20-7.37 (3H, m), 8.52 (1H, s)
11-47	1H-NMR (CDCl3) δ: 1.37 (3H, t, J = 7.1 Hz), 2.55-2.66 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.73-3.75 (2H, m), 4.00-4.04 (1H, m), 4.36 (2H, q, J = 7.1 Hz), 4.49-4.54 (1H, m), 6.65 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.40
12-4	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.52-2.62 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.61-3.75 (2H, m), 3.88 (3H, s), 4.01 (1H, d), 4.50 (1H, d), 6.39 (1H, d), 7.31 (2H, s), 7.39 (1H, s), 8.06 (1H, dd), 8.84 (1H, d).
12-5	1H-NMR (DMSO-d6) δ: 2.61-2.72 (1H, m), 2.90-3.01 (1H, m), 3.57-3.66 (2H, m), 3.96 (1H, d), 4.49 (1H, d), 6.67 (1H, d), 7.65 (2H, s), 7.70 (1H, t), 7.97 (1H, dd), 8.66 (1H, d), 12.46 (1H, br s).
12-10	1H-NMR (CDCl3) δ: 2.54-2.59 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.66-3.68 (2H, m), 3.88-3.97 (4H, m), 4.45-4.48 (1H, m), 6.30 (1H, d), 7.28-7.30 (2H, m), 7.39 (1H, s), 8.05-8.08 (1H, m)

Biological Test Example 1: Test for larvae of *Spodoptera litura*

Solvent: 3 parts by weight of dimethylformamide, Emulsifier: 1 part by weight of polyoxyethylene alkyl phenyl ether

5 To prepare a suitable active compound, 1 part by weight of the active compound is mixed with the above amount of the solvent containing the above amount of the emulsifier, and the mixture is diluted with water to the prescribed concentration.

10 Leaves of batata are immersed in the sample solution diluted with water to a prescribed concentration and, after the solution depositing on leaves is air-dried, the resultant leaves are put in a laboratory dish of 9 cm in diameter, into which 10 of third stage larvae of *Spodoptera litura* are then released, and the dish is then put in a temperature controlled room at 25°C, followed by addition of leaves of batata to the dish on the second day and fourth day and investigation of the number of dead insects after 7 days to calculate the insecticidal ratio.

The results are the averages of two laboratory dishes per group in this test.

15 Compounds Nos.1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-63, 1-73, 1-75, 1-81, 1-83, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91, 1-93, 2-8, 2-23, 2-29, 2-40, 2-41, 3-3 and 3-4 showed 100% of death rate at a concentration of 100ppm of the active compound.

Biological Test Example 2: Test for Tetranychus urticae (spraying test)

To prepare an appropriate formulation of an active compound, 1 part by weight of the active compound is mixed with the aforementioned amount of the solvent containing the aforementioned amount of the emulsifier, and the mixture is diluted to a prescribed concentration with water.

- 5 50 to 100 adult mites of *Tetranychus urticae* are inoculated to leaves of kidney bean at two-leaf stage planted in a pot of 6 cm in diameter. One day after, an ample amount of the diluted aqueous solution of the prescribed concentration of an active compound is sprayed with a spray gun. After the spraying, the pot is kept in a greenhouse for 7 days, and the acaricidal rate is calculated using the following evaluation criteria:

Acaricidal rate	
100	all mites inoculated are dead
98	1 to 4 mites survived / propagated
90	5 to 20 mites survived /propagated
60	Many mites survived /propagated, but less than the untreated control, some dead bodies are observed
0	No difference from the untreated control was observed

10

Compounds Nos.1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-20, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-75, 1-81, 1-84, 1-86, 1-87, 1-90, 2-29, 3-3 and 3-4 showed an acaricidal rate of more than 98% at a concentration of 500 ppm of active compound.

Biological Test Example 3: Test for *Aulacophora femoralis* (spraying test)

Solvent: Dimethylformamide 3 parts by weight

Emulsifier: Polyoxyethylene alkyl phenyl ether 1 part by weight

To prepare an appropriate formulation of an active compound, 1 part by weight of the active
5 compound is mixed with the aforementioned amount of the solvent containing the aforementioned
amount of the emulsifier, and the mixture is diluted to a prescribed concentration with water.

Leaves of cucumbers are soaked in a diluted aqueous solution of the prescribed concentration of an
active compound prepared in the same manner as in the aforementioned tests, air-dried, and placed
a plastic cup containing sterilized black soil. Into this cup, 5 larvae of *Aulacophora femoralis* at
10 second instar are then released. After 7 days, the number of dead larvae is counted to calculate the
death rate.

Compounds Nos. 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21,
1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-60, 1-61, 1-80, 1-81, 1-85, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91,
2-29, 3-3 and 3-4 showed 100% of death rate at a concentration of 100ppm of the active
15 compound.

Biological Test Example 4: Test against organic phosphorus agent- and carbamate agent-resistant *Myzus persicas*

Solvent: Dimethylformamide 3 parts by weight

Emulsifier: Polyoxyethylene alkyl phenyl ether 1 part by weight

- 5 To prepare an appropriate formulation of an active compound, 1 part by weight of the active compound is mixed with the aforementioned amount of the solvent containing the aforementioned amount of the emulsifier, and the mixture is diluted to a prescribed concentration with water.

- 10 About 30 to 50 adults of organic phosphorus agent- and carbamate agent-resistant *Myzus persicae* per seedling are inoculated to leaves of eggplants at two leaf stage cultured in a pot of 6 cm in diameter. One day after the inoculation, an ample amount of the diluted aqueous solution of the prescribed concentration of an active compound prepared in the same manner as in the aforementioned tests is sprayed with a spray gun. After the spraying, the pot is kept in a greenhouse at 28°C for 7 days, the death rate is calculated. The test is duplicated.

- 15 Compounds Nos.1-7, 1-10, 1-14 and 1-16 showed 98% of death rate at a concentration of 500ppm of the active compound.

Biological Test Example 5: Test for Ctenocephalides felis.

Solvent: Dimethylformamide

5 In order to prepare an appropriate formulation of an active compound, 10mg of the active compound is dissolved in 0.5mL of the aforementioned solvent, and the mixture is diluted to a prescribed concentration with blood from domestic animals.

10 About 10 to 15 adults of Ctenocephalides felis were kept in a flea-specific container. Another container containing the blood solution containing the compound prepared as described above is covered with a laboratory film [PARAFILM (Trademark)]. The blood containing container is turned upside down and placed on the flea-specific container. This system enables Ctenocephalides felis to suck the blood in the container. The blood solution is kept at 37 °C and the flea-specific container is kept at room temperature. After a certain period of time, the death rate of Ctenocephalides felis is calculated. For this test, the death rate of 100% means death of all Ctenocephalides felis, while the death rate of 0% means that all the fleas survived.

15 In this biological test, the compound 1-16 showed more than 80% of death rate at a concentration of 100ppm of the active ingredient.

Biological Test Example 6: Test for Boophilus microplus

Solvent: Dimethylformamide

In order to prepare an appropriate formulation of an active compound, 10mg of the active compound is dissolved in 0.5mL of the aforementioned solvent, and the mixture is diluted to a
5 prescribed concentration with water.

A solution of a compound formulated as above is injected into 5 fully fed adult female Boophilus microplus in their abdomen. These Boophilus microplus are transferred to a replica dish and kept in an incubating cabinet for a certain period of time.

After a certain period of time, the death rate of Boophilus microplus is calculated. In this test, the
10 death rate of 100% means death of all Boophilus microplus, while the death rate of 0% means that all the mites survive.

In the above biological test, the compound 1-16 showed more than 80% of death rate at a dose of 20µg/animal of the active ingredient.

Biological Test Example 7: Test for *Lucillia cuprina*.

Solvent: Dimethylformamide

5 In order to prepare an appropriate formulation of an active compound, 10mg of the active compound is dissolved in 0.5mL of the aforementioned solvent, and the mixture is diluted to a prescribed concentration with water.

About 20 to 30 larvae of *Lucillia cuprina* are placed into a test tube containing 1cm³ of minced horsemeat and 0.5mL of an aqueous solution of a compound prepared as above.

10 After a certain period of time, the death rate of *Lucillia cuprina* is calculated. For this test, the death rate of 100% means death of all *Lucillia cuprina*, while the death rate of 0% means that all the flies survived.

In this biological test, the compound 1-16 showed more than 80% of death rate at a concentration of 100ppm of the active ingredient.

Formulation Example 1 (granules)

To a mixture containing 10 parts of a compound according to the invention, namely compound No.1-3, 30 parts of bentonite (montmorillonite), 58 parts of talc and 2 parts of ligninsulfonic acid salt is added 25 parts of water, and the mixture is well kneaded and granulated with 10 to 40
5 meshes by an extruding granulator and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 2 (granules)

95 parts of clay mineral granules having particle diameter distribution within the range of 0.2 to 2 mm, which is put into a rotary mixer, are wetted evenly by spraying of 5 parts of the compound according to the invention, namely compound No.1-3 together with a liquid diluent under rotating
10 condition and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 3 (emulsions)

30 parts of the compound according to the invention, namely compound No.1-3, 55 parts of xylene, 8 parts of polyoxyethylene alkylphenyl ether and 7 parts of calcium alkylbenzenesulfonate are mixed together to obtain the emulsion.

15 Formulation Example 4 (wetable agent)

15 parts of the compound according to the invention, namely compound No. 1-3, 80 parts of a mixture of white carbon (hydrated amorphous silicon oxide fine powder) and powdered clay (1 : 5), 2 parts of sodium alkylbenzenesulfonate and 3 parts of sodium alkylphthalenesulfonate-formalin condensate are mixed together and the mixture is crushed to obtain water dispersible
20 powder.

Formulation Example 5 (wetable granules)

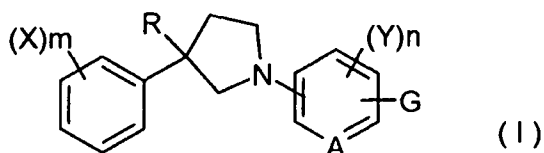
20 parts of the active compound according to the invention, namely compound No.1-3, 30 parts of sodium ligninsulfonate, 15 parts of bentonite and 35 parts of calcined diatomaceous earth powder are well mixed, and after addition of water, which is then extruded with a screen of 0.3 mm and
25 dried to obtain water-dispersible granules.

Industrial availability

Novel aryl pyrrolidines of the invention have an excellent insecticidal action as insecticides as shown in above examples.

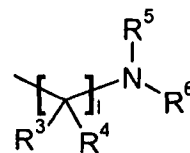
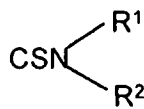
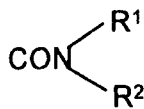
Claims:

1. Aryl pyrrolidines represented by the formula (I)



wherein

- 5 X which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, haloalkylthio, haloalkylsulfinyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, alkylcarbonylamino, haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, alkoxy carbonylamino, haloalkoxy carbonylamino, alkylsulfonylamino or
- 10 haloalkylsulfonylamino;
- Y which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, haloalkylthio, haloalkylsulfinyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, alkylcarbonylamino, haloalkylcarbonylamino, benzoylamino,
- 15 alkoxy carbonylamino, haloalkoxy carbonylamino, alkylsulfonylamino or haloalkylsulfonylamino;
- R represents alkyl or haloalkyl;
- m represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
- n represents 1, 2, 3 or 4;
- 20 G is selected from the group consisting of



wherein

R^1 and R^2 each independently represents hydrogen; optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl or alkylsulfonyl; haloalkylsulfonyl or CH_2-R^7 ; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;

5 R^3 and R^4 each independently represents hydrogen; cyano; optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;

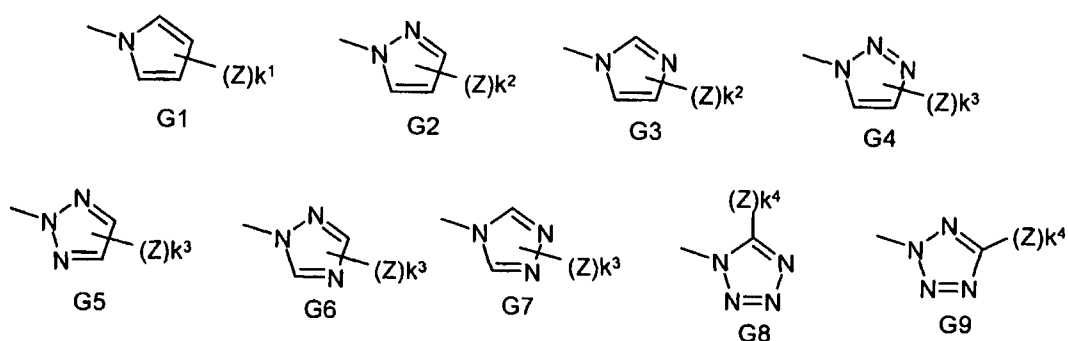
1 represents 1, 2 or 3;

R^5 represents hydrogen; alkyl; optionally substituted cycloalkyl; haloalkyl; cyano; alkenyl; alkynyl; alkylcarbonyl or CH_2-R^7 ;

10 R^6 represents formyl, cyano, alkylcarbonyl, alkylthiocarbonyl, haloalkylcarbonyl, haloalkylthiocarbonyl, alkylaminocarbonyl, alkylaminothiocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, dialkylaminothiocarbonyl, alkoxyaminocarbonyl, alkoxyaminothiocarbonyl, alkoxy carbonyl, alkoxythiocarbonyl, thioalkoxycarbonyl, thioalkoxythiocarbonyl, $CO-R^7$, $CS-R^7$, alkylsulfonyl or haloalkylsulfonyl; or alternatively

15 R^5 and R^6 when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;

or is selected from the the group consisting of the heterocycles G1 to G9:



wherein

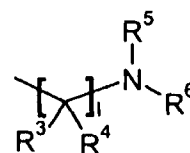
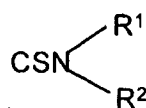
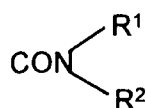
Z which may be same or different, represents halogen, haloalkyl, nitro, alkyl, alkoxy, cyano, haloalkoxy, alkylsulfonyl, haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;

- k^1 represents 0, 1, 2, 3 or 4;
 k^2 represents 0, 1, 2 or 3;
 k^3 represents 0, 1 or 2;
 k^4 represents 0 or 1;
5 R^7 represents phenyl or heterocyclic ring, which are optionally substituted; and
A represents C or N.

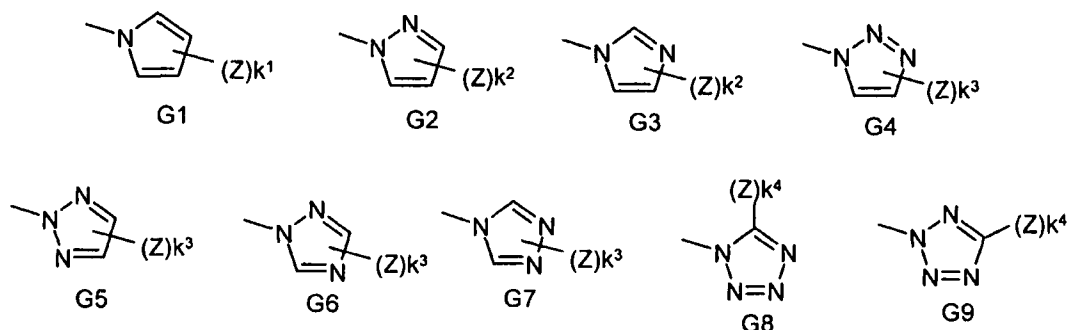
2. The compounds according to claim 1

wherein

- 10 X which may be same or different, represents halogen, C_{1-6} haloalkyl, nitro, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy, cyano, C_{1-6} haloalkoxy, C_{1-6} alkylthio, C_{1-6} alkylsulfinyl, C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylthio, C_{1-6} haloalkylsulfinyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C_{1-6} alkylcarbonylamino, C_{1-6} haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C_{1-6} alkoxy-carbonylamino, C_{1-6} haloalkoxy-carbonylamino, C_{1-6} alkylsulfonylamino or C_{1-6} haloalkylsulfonylamino;
15
Y which may be same or different, represents halogen, C_{1-6} haloalkyl, nitro, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy, cyano, C_{1-6} haloalkoxy, C_{1-6} alkylthio, C_{1-6} alkylsulfinyl, C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylthio, C_{1-6} haloalkylsulfinyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl, hydroxyl, mercapto, amino, C_{1-6} alkylcarbonylamino, C_{1-6} haloalkylcarbonylamino, benzoylamino, C_{1-6} alkoxy-carbonylamino, C_{1-6} haloalkoxy-carbonylamino, C_{1-6} alkylsulfonylamino or C_{1-6} haloalkylsulfonylamino;
20
R represents C_{1-6} alkyl or C_{1-6} haloalkyl;
m represents 0, 1, 2, 3, 4 or 5;
n represents 0, 1, 2, or 4;
25 G is selected from the group consisting of



or the group consisting of the heterocycles G1 to G9:



wherein

5 R^1 and R^2 each independently represents hydrogen; optionally substituted C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl; C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl or $\text{CH}_2\text{-R}^7$; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;

10 R^3 and R^4 each independently represents hydrogen, cyano; optionally substituted C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{3-7} cycloalkyl; or C_{1-6} alkoxy carbonyl; or when taken together represent C_{2-6} alkylene;

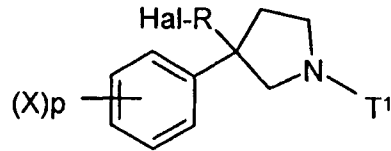
1 l represents 1 or 2 or 3;

R^5 represents hydrogen; C_{1-6} alkyl; optionally substituted C_{3-7} cycloalkyl; C_{1-6} haloalkyl; cyano; C_{2-6} alkenyl; C_{2-6} alkynyl; C_{1-6} alkylcarbonyl; or $\text{CH}_2\text{-R}^7$;

15 R^6 represents formyl, cyano, C_{1-6} alkylcarbonyl, C_{1-6} alkylthiocarbonyl, C_{1-6} haloalkylcarbonyl, C_{1-6} haloalkylthiocarbonyl, C_{1-6} alkylaminocarbonyl, C_{1-6} alkylaminothiocarbonyl, dialkylamino-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, dialkylaminothio-carbonyl having from 2 to 8 carbon atoms, C_{1-6} alkoxyaminocarbonyl, C_{1-6} alkoxyaminothiocarbonyl, C_{1-6} alkoxy carbonyl, C_{1-6} alkoxythiocarbonyl, C_{1-6} thioalkoxy carbonyl, C_{1-6} thioalkoxythiocarbonyl, CO-R^7 ,
 20 CS-R^7 , C_{1-6} alkylsulfonyl or C_{1-6} haloalkylsulfonyl; or

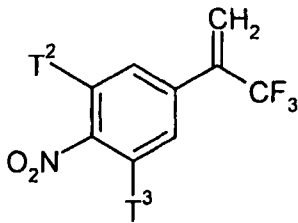
- R^5 and R^6 when taken together with the nitrogen to which they are attached to form a 3-6 membered ring which contains at least one N atom and, optionally at least another heteroatom selected from S and O, wherein the ring is optionally substituted with keto or thioketo;
- 5 Z which may be same or different, represents halogen, C_{1-6} haloalkyl, nitro, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoxy, cyano, C_{1-6} haloalkoxy, C_{1-6} alkylsulfonyl, C_{1-6} haloalkylsulfonyl, hydroxyl or mercapto;
- k^1 represents 0, 1, 2, 3 or 4;
- k^2 represents 0, 1, 2 or 3;
- 10 k^3 represents 0 or 1;
- k^4 represents 0 or 1;
- R^7 represents phenyl or a heterocyclic ring, which are optionally substituted with at least one substituent selected from fluorine, chlorine, bromine, iodine and C_{1-6} alkyl; and
- 15 A represents C or N.
3. Insecticidal composition comprising at least one compound according to claim 1 or 2.
4. Method for controlling insects and/or acari, comprising the step of treating unwanted insects and/or acari and/or their habitat with the composition according to claim 3.
- 20 5. Use of the compounds according to claim 1 or 2 for controlling unwanted insects and/or acari.
- 25 6. Use of the compounds according to claim 1 or 2 for treating seed.

7. Use of the compounds according to claim 1 or 2 for treating transgenic plants.
8. Compounds represented by the formula (IIa)



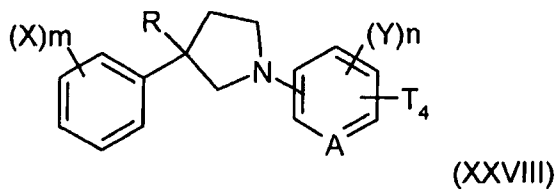
5 wherein X is defined as in claim 1 or 2 , and T¹ represents hydrogen or benzyl, Hal-R represents haloalkyl and p represents 1, 2, 3, 4 or 5.

9. Compounds represented by the formula (XVI-a)

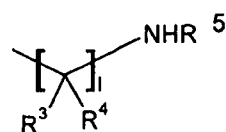
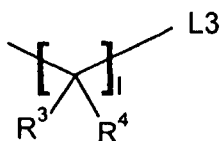
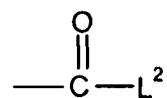
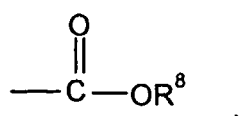


10 wherein T² and T³ independently represents alkyl.

10. Compounds represented by the formula (XXVIII)



15 wherein X, Y, R, A, m and n are defined as in claim 1 or 2 and T⁴ stands for cyano, amino or nitro or a group



wherein

I , R^3 , R^4 , R^5 and R^6 are defined as in claim 1 or 2;

R^8 represents hydrogen or C_{1-4} alkyl;

5 L^2 represents chlorine, bromine, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, C_{1-4} alkoxy carbonyloxy or azolyl; and

L^3 represents chlorine, bromine, iodide, C_{1-4} alkylsulfonyloxy, C_{1-4} haloalkylsulfonyloxy, arylsulfonyloxy or azolyl.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2008/003105

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07C205/06 C07D207/04 C07D401/04 C07D401/12 C07D403/10
 C07D401/14 A01N43/36 A01N43/40

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)

C07C C07D A01N

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

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

EPO-Internal, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 1 731 512 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD [JP]) 13 December 2006 (2006-12-13) cited in the application examples	1-10
A	WO 2006/101828 A (FMC CORP [US]; CRAWFORD SCOTT D [US]; ROWLEY ELIZABETH G [US]; ELDRIDG) 28 September 2006 (2006-09-28) examples	1-10
A	WO 03/067986 A (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; KRAATZ UDO [DE]; FUESSLEIN MARTIN [DE]; JAN) 21 August 2003 (2003-08-21) claims; examples	1-10
	----- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

5 August 2008

Date of mailing of the international search report

12/08/2008

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

Fazzi, Raffaella

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

116

International application No

PCT/EP2008/003105

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	CAMPS P ET AL: "(R)- and (S)-3-Hydroxy-4,4-dimethyl-1-phenyl-2-pyrrolidinone as chiral auxiliaries in the enantioselective preparation of alpha-aryloxypropanoic acid herbicides and alpha-chlorocarboxylic acids" TETRAHEDRON ASYMMETRY, PERGAMON, OXFORD; GB, vol. 9, no. 12, 19 June 1998 (1998-06-19), pages 2065-2079, XP004127745 ISSN: 0957-4166 the whole document	1-10
A	BIAO JIANG ET AL: "TRIFLUOROISOPROPENYLZINC REAGENT AS A USEFUL A-(TRIFLUOROMETHYL)ETHENYL CARBANION SYNTHETIC EQUIVALENT. PREPARATION AND PALLADIUM-CATALYZED COUPLING WITH ARYL HALIDES" JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, EASTON, vol. 56, no. 26, 20 December 1991 (1991-12-20), pages 7336-7340, XP000237178 ISSN: 0022-3263 the whole document	9

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2008/003105

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 1731512	A	13-12-2006	AU 2005219788 A1 15-09-2005
			BR PI0508140 A 24-07-2007
			CA 2558848 A1 15-09-2005
			WO 2005085216 A1 15-09-2005
			KR 20070010145 A 22-01-2007
			US 2007066617 A1 22-03-2007
WO 2006101828	A	28-09-2006	NONE
WO 03067986	A	21-08-2003	AU 2003206816 A1 04-09-2003
			DE 10205862 A1 21-08-2003

Aril pirrolidinas insecticidas

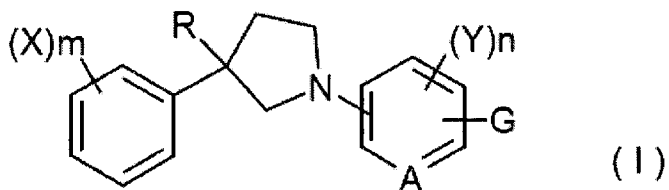
La presente invención se refiere a aril pirrolidinas novedosas y su uso como insecticidas.

El documento WO2005/085216 describe que los compuestos de benzamida sustituidos con isoxazolina son útiles como agentes de control de plagas.

Los inventores se dedicaron a estudiar el desarrollo de compuestos novedosos que muestran mayores efectos y un amplio espectro contra las plagas animales, tales como insectos y ácaros. Como resultado, los inventores encontraron aril pirrolidinas novedosas que muestran una excelente, es decir, alta actividad, que tienen un amplio espectro y son inocuos para los insectos beneficiosos, tales como abejas, así como eficaces contra plagas de insectos. Particularmente a los insectos que son resistentes a insecticidas, tales como agentes organofosforados o carbamatos.

15

Los compuestos de acuerdo con la invención se representan por la fórmula (I)



20

-2-

en la que

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcoxi-carbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcoxi-carbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

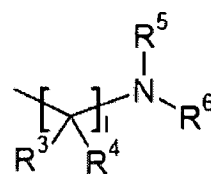
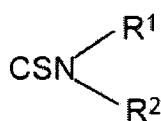
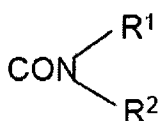
R representa alquilo o haloalquilo;

m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n representa 1, 2, 3 ó 4;

G se selecciona entre el grupo constituido por

20



en la que

-3-

R^1 y R^2 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo o alquilsulfonilo opcionalmente sustituidos; haloalquilsulfonilo o CH_2-R^7 ; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

5

R^3 y R^4 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; ciano; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

10 I representa 1, 2 ó 3;

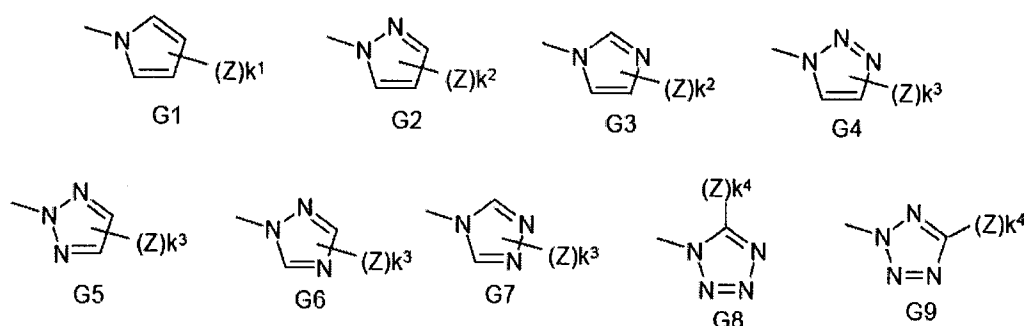
R^5 representa hidrógeno; alquilo; cicloalquilo opcionalmente sustituido; haloalquilo; ciano; alquenilo; alquinilo; alquilcarbonilo o CH_2-R^7 ;

R^6 representa formilo, ciano, alquilcarbonilo, alquiltiocarbonilo,
 15 haloalquilcarbonilo, haloalquiltiocarbonilo, alquilaminocarbonilo,
 alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo,
 alc oxiaminocarbonilo, alc oxiaminotiocarbonilo, alc oxicarbonilo,
 alc oxitiocarbonilo, tioalc oxicarbonilo, tioalc oxitiocarbonilo, $CO-R^7$, $CS-R^7$,
 alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo; o como alternativa

20

R^5 y R^6 cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

25 o el grupo constituido por los heterociclos G1 a G9:



Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo o

5 mercapto;

k¹ representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k² representa 0, 1, 2 ó 3;

k³ representa 0, 1 ó 2;

k⁴ representa 0 ó 1;

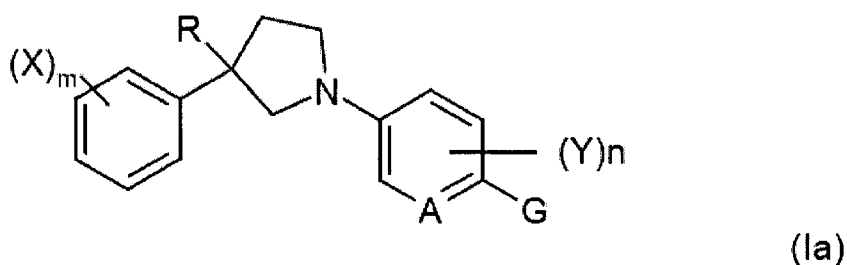
10

R⁷ representa fenilo o anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre halógeno y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

15 Entre los compuestos de fórmula (I) de la invención, los compuestos preferidos son los compuestos de fórmula (Ia)

-5-



en la que X, Y, R, A, G, Y, n y m son como se han definido anteriormente.

Entre los compuestos de fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención, los
5 compuestos preferidos adicionales son aquellos en los que

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆,
nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfinilo
C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfinilo C₁₋₆,
10 haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₆ carbonilamino,
haloalquil C₁₋₆ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₆ carbonilamino,
haloalcoxi C₁₋₆ - carbonilamino, alquil C₁₋₆ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₆
sulfonilamino;

15 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆,
nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfinilo
C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfinilo C₁₋₆,
haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₆ carbonilamino,
haloalquil C₁₋₆ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₆ - carbonilamino,
20 haloalcoxi C₁₋₆ - carbonilamino, alquil C₁₋₆ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₆

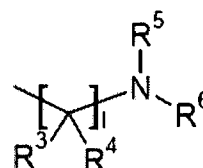
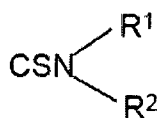
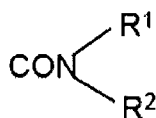
sulfonilamino;

R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

5 m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

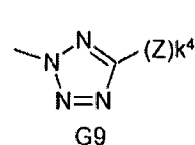
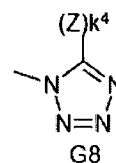
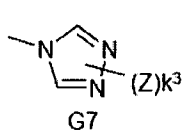
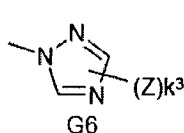
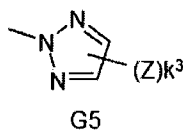
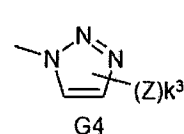
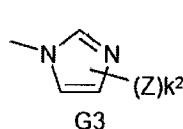
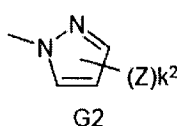
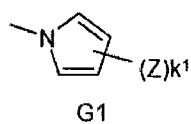
n representa 0, 1, 2, ó 4;

G se selecciona entre el grupo constituido por



10

o grupo constituído por G1 a G9:



en los que

R¹ y R² cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; alquilo

15 C₁₋₆, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente sustituidos; alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆ o CH₂-R⁷; o cuando se toman

-7-

conjuntamente representan alquileo C₂₋₆;

R³ y R⁴ cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, ciano; alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente
 5 sustituidos; o alcoxi C₁₋₆ carbonilo; o cuando se toman conjuntamente representan alquileo C₂₋₆;

I representa 1 ó 2 ó 3;

10 R⁵ representa hidrógeno; alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente sustituido; haloalquilo C₁₋₆; ciano; alqueno C₂₋₆; alquino C₂₋₆; alquil C₁₋₆ carbonilo ; o CH₂-R⁷;

R⁶ representa formilo, ciano, alquil C₁₋₆ carbonilo, alquil C₁₋₆ tiocarbonilo,
 15 haloalquil C₁₋₆ - carbonilo, haloalquil C₁₋₆ tiocarbonilo, alquil C₁₋₆ aminocarbonilo, alquil C₁₋₆ aminotiocarbonilo, dialquilamino-carbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, dialquilaminotio-carbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, alcoxi C₁₋₆ aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₆ aminotiocarbonilo, alcoxi C₁₋₆ carbonilo, alcoxi C₁₋₆ tiocarbonilo, tioalcoxi C₁₋₆ carbonilo, tioalcoxi C₁₋₆
 20 tiocarbonilo, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₆ o haloalquilsulfonilo C₁₋₆; o

R⁵ y R⁶ cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N, opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que
 25 el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo o mercapto;

5

k¹ representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k² representa 0, 1, 2 ó 3;

10

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

15

R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, yodo y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

20

Compuestos más preferidos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención son tales compuestos

En los que

25

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfinilo C₁₋₆,

alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₆ carbonilamino, haloalquil C₁₋₆ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₆ carbonilamino, haloalcoxi C₁₋₆ carbonilamino, alquil C₁₋₆ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₆sulfonilamino;

5

Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₆ carbonilamino, haloalquil C₁₋₆ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₆ carbonilamino, haloalcoxi C₁₋₆ carbonilamino, alquil C₁₋₆ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₆ sulfonilamino;

10

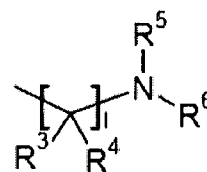
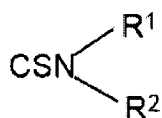
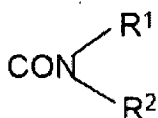
R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

15

m representa 0, 1, 2 ó 3;

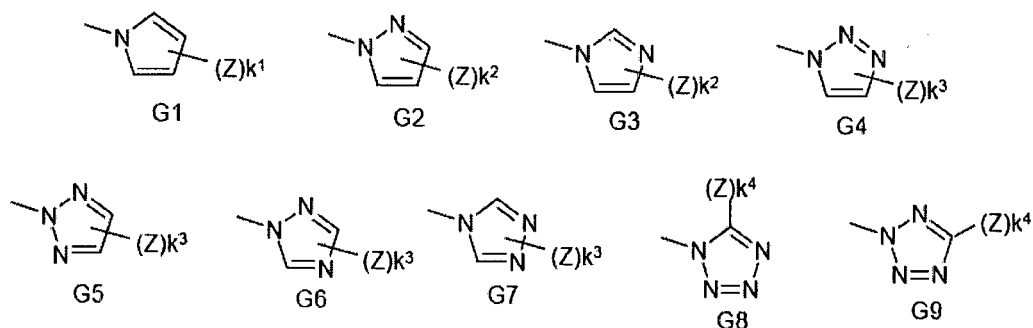
n representa 0, 1, 2 ó 3;

20 G se selecciona entre el grupo constituido por



o el grupo constituido por los heterociclos G1 a G9:

-10-



R¹ y R² cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆ que puede estar sustituido, alquenilo C₂₋₆ que puede estar sustituido, alquinilo C₂₋₆ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆ o CH₂-R⁷; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C₃₋₅;

R³ y R⁴ cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, ciano, alquilo C₁₋₆ que puede estar sustituido, alquenilo C₂₋₆ que puede estar sustituido, alquinilo C₂₋₆ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido o alcoxi C₁₋₆ - carbonilo; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C₃₋₅;

l representa 1 ó 2;

R⁵ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido, haloalquilo C₁₋₆, ciano, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, alquil C₁₋₆ - carbonilo o CH₂-R⁷;

R⁶ representa formilo, ciano, alquil C₁₋₆ - carbonilo, alquiltio C₁₋₆ - carbonilo, haloalquil C₁₋₆ carbonilo, haloalquiltio C₁₋₆ - carbonilo, alquilamino C₁₋₆ - carbonilo,

-11-

alquil C₁₋₆ aminotiocarbonilo, dialquilamino-carbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, dialquilaminotiocarbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, alcoxi-amino C₁₋₆ - carbonilo, alcoxi C₁₋₆ aminotiocarbonilo, alcoxi C₁₋₆ - carbonilo, alcoxitio C₁₋₆ - carbonilo, tioalcoxi C₁₋₆ - carbonilo, tioalcoxitio C₁₋₆ carbonilo, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₆ o haloalquilsulfonilo C₁₋₆; o como alternativa

R⁵ y R⁶ cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo o

mercapto;

k¹ representa 0, 1, 2 ó 3;

k² representa 0, 1 ó 2;

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

-12-

R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, y alquilo C₁₋₆; y

5

A representa C o N.

Entre los compuestos de fórmula (I) o fórmula (Ia), particularmente se prefieren los compuestos en los que

10

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₄, nitro, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfinilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₄ - carbonilamino, haloalquil C₁₋₄ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₄ carbonilamino, haloalcoxi C₁₋₄ - carbonilamino, alquil C₁₋₄ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₄ sulfonilamino;

15

Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₄, nitro, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfinilo C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfinilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₄ - carbonilamino, haloalquil C₁₋₄ carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C₁₋₄ carbonilamino, haloalcoxi C₁₋₄ - carbonilamino, alquil C₁₋₄ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₄ sulfonilamino;

20

25 R representa alquilo C₁₋₄ o haloalquilo C₁₋₄;

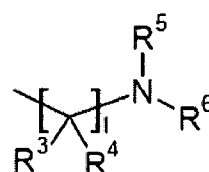
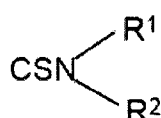
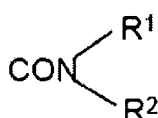
-13-

m representa 0, 1, 2 ó 3;

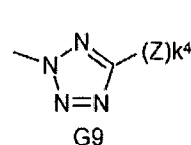
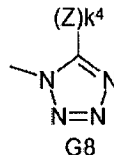
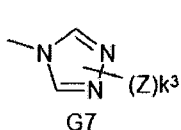
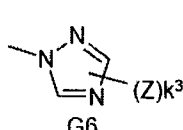
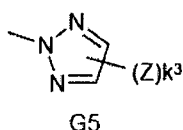
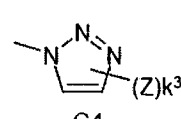
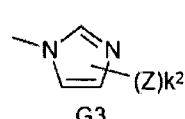
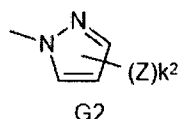
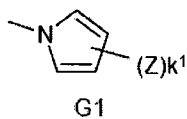
n representa 0, 1, 2 ó 3;

5

G se selecciona entre el grupo constituido por



o el grupo constituido por los heterociclos G1 a G9:



10

R^1 y R^2 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alquenilo C_{2-4} que puede estar sustituido, alquinilo C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido, alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o $\text{CH}_2\text{-R}^7$; o cuando se

15 toman conjuntamente representan alquilenos C_{3-5} ;

R^3 y R^4 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, ciano,

-14-

alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alquenilo C_{2-4} que puede estar sustituido, alquinilo C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido o alcoxi C_{1-4} - carbonilo; o cuando se toman conjuntamente representan alquileno C_{3-5} ;

5

I representa 1 ó 2;

R^5 representa hidrógeno, alquilo C_{1-4} , cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido, haloalquilo C_{1-4} , ciano, alquenilo C_{2-4} , alquinilo C_{2-4} , alquil C_{1-4} - carbonilo o CH_2-R^7 ;

10

R^6 representa formilo, ciano, alquil C_{1-4} - carbonilo, alquiltio C_{1-4} - carbonilo, haloalquil C_{1-4} carbonilo, haloalquil C_{1-4} tiocarbonilo, alquil amino C_{1-4} -carbonilo, alquil C_{1-4} aminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, dialquilaminotiocarbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, alcoxi-amino C_{1-4} -carbonilo, alcoxi C_{1-4} aminotio-carbonilo, alcoxi C_{1-4} - carbonilo, alcoxitio C_{1-4} - carbonilo, tioalcoxi C_{1-4} - carbonilo, tioalcoxi C_{1-4} tiocarbonilo, $CO-R^7$, $CS-R^7$, alquilsulfonilo C_{1-4} o haloalquilsulfonilo C_{1-4} ; o como alternativa

15

R^5 y R^6 cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

20

25

-15-

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₄, nitro, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, haloalcoxi C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, hidroxilo o mercapto;

5 k¹ representa 0, 1, 2 ó 3;

k² representa 0, 1 ó 2;

k³ representa 0 ó 1;

10

k⁴ representa 0 ó 1;

R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, y alquilo C₁₋₄; y

15

En una realización de la invención los compuestos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) son compuestos en los que

20 X que puede ser igual o diferente, representa cloro, flúor, bromo, trifluorometilo, difluormetilo, fluormetilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo, metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, t-butoxi, 2-metil-propoxi, ciano, trifluormetoxi, difluormetioxi, fluormetioxi, tiometilo, tioetilo, tiopropilo, tio-
ipropilo, tiobutilo, tio-t-butilo, 2-metil-tiopropilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo,
25 propilsulfinilo, i-propilsulfinilo, butilsulfinilo, t-butilsulfinilo, 2-metil-propilsulfinilo,

- metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, i-propilsulfonilo, butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, 2-metil-propilsulfonilo, trifluormetiltio, trifluormetilsulfinilo, trifluormetilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, metilcarbonilamino, etilcarbonilamino, propilcarbonilamino, i-propilcarbonilamino, butilcarbonilamino,
- 5 tbutilcarbonilamino, 2-metil-propilcarbonilamino, benzoilamino, metoxicarbonilamino, etoxi-carbonilamino, propoxi-carbonilamino, i-propoxi-carbonilamino, butiloxi- carbonilamino, t-butiloxi-carbonilamino, 2-metil-propoxi-carbonilamino, trifluormetoxicarbonilamino, alquil C₁₋₄ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₄ sulfonilamino;
- 10 Y que puede ser igual o diferente, representa cloro, flúor, bromo, yodo, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, tbutilo, 2-metil-propilo, metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, t-butoxi, 2-metil-propoxi, ciano, trifluormetoxi, difluormetioxi, fluorometioxi, tiometilo,
- 15 tioetilo, tiopropilo, tio-i-propilo, tiobutilo, tio-t-butilo, 2-metil-tiopropilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, i-propilsulfinilo, butilsulfinilo, t-butilsulfinilo, 2-metilpropilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, i-propilsulfonilo, butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, 2-metil-propilsulfonilo, trifluormetiltio, trifluormetilsulfinilo, trifluormetilsulfonilo, hidroxilo, mercapto,
- 20 amino, trifluormetilcarbonilamino, metilcarbonilamino, etilcarbonilamino, propilcarbonilamino, i-propilcarbonilamino, butilcarbonilamino, t-butilcarbonilamino, 2-metil-propilcarbonilamino, 2,2,2-tricloretilcarbonilamino, benzoilamino, metoxi-carbonilamino, etoxi-carbonilamino, propoxi-carbonilamino, i-propoxi-carbonilamino, butiloxi-carbonilamino, t-
- 25 butiloxicarbonilamino, 2-metil-propoxi-carbonilamino,

trifluormetoxycarbonilamino, alquil C₁₋₄ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₄ sulfonilamino;

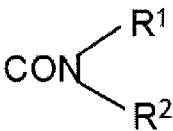
R representa metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo o
5 trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo;

m representa 0, 1, 2 ó 3;

n representa 0, 1, 2 ó 3;

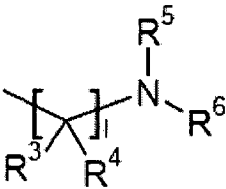
10

G representa:



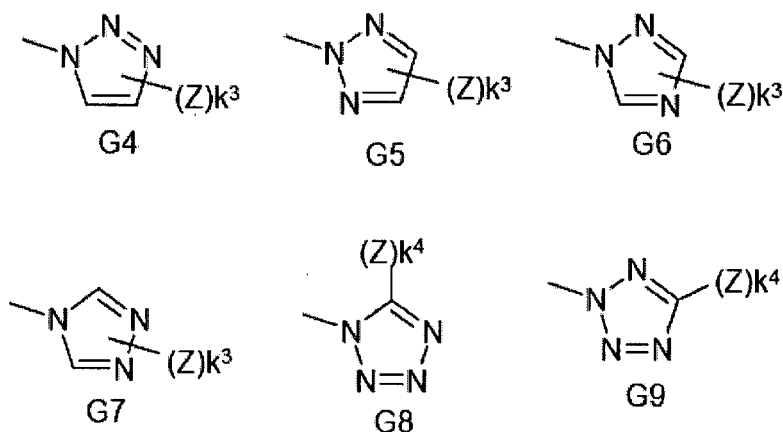
15

o



o como alternativa representa los siguientes heterociclos de G1-G9:

-18-



R^1 y R^2 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alquenilo C_{2-4} que puede estar sustituido, alquinilo C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar
 5 sustituido, alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o CH_2-R^7 ; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{3-5} ;

R^3 y R^4 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, ciano, alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alquenilo C_{2-4} que puede estar
 10 sustituido, alquinilo C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido o alcoxi C_{1-4} - carbonilo; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{3-5} ;

l representa 1 ó 2;

15

R^5 representa hidrógeno, alquilo C_{1-4} , cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido, haloalquilo C_{1-4} , ciano, alquenilo C_{2-4} , alquinilo C_{2-4} , alquil C_{1-4} carbonilo o CH_2-R^7 ;

R⁶ representa formilo, ciano, alquil C₁₋₄ - carbonilo, alquiltio C₁₋₄ - carbonilo, haloalquil C₁₋₄ - carbonilo, haloalquiltio C₁₋₄ - carbonilo, alquilamino C₁₋₄ - carbonilo, alquilaminotio C₁₋₄ - carbonilo, dialquilamino-carbonilo que tiene entre
 5 2 y 6 átomos de carbono, dialquilaminotio-carbonilo que tiene entre 2 y 6 átomos de carbono, alcoxi-amino C₁₋₄ -carbonilo, alcoxi C₁₋₄ aminotiocarbonilo, alcoxi C₁₋₄ - carbonilo, alcoxitio C₁₋₄ - carbonilo, tioalcoxi C₁₋₄ - carbonilo, tioalcoxi C₁₋₄ tiocarbonilo, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₄ o haloalquilsulfonilo C₁₋₄; o como alternativa

10

Z que puede ser igual o diferente, representa cloro, bromo o yodo, trifluorometilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo, ciano;

15 k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

R⁷ representa fenilo que puede estar sustituido o un anillo heterocíclico
 20 seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirolidinilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo, pirimidinilo, y triazinilo que puede estar sustituido, en el que el sustituyente es al menos uno seleccionado entre cloro, bromo, yodo y metilo, etilo, i-propilo, n-propilo, 2-metil propilo, n-butilo y t-butilo;
 y

25

A representa C.

Los compuestos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención tienen carbonos asimétricos, y de este modo abarcan isómeros ópticos.

5

Como se usa en el presente documento, "alquilo" se refiere a un alquilo C₁₋₁₂ lineal o ramificado tal como 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, preferiblemente se refiere a alquilo C₁₋₆.

10

Como se usa en el presente documento, "haloalquilo" se refiere a grupos alquilo que tienen 1 a 12 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 6 ó 1 a 4 átomos de carbono en los que al menos un átomo de hidrógeno se cambia por un halógeno. Los haloalquilos adecuados son por ejemplo CH₂F, CHF₂, CF₃,
 15 CF₂Cl, CFCI₂, CF₂Br, CF₂CF₃, CFHCF₃, CH₂CF₃, CFCICF₃, CCI₂CF₃,
 CF₂CH₃, CF₂CH₂F, CF₂CHF₂, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂Br, CFHCH₃, CFHCH₂F,
 CFHCHF₂, CHF₂CF₃, CHF₂CF₂Cl, CHF₂CF₂Br, CH₂CF₃, CFCICF₃, CCI₂CF₃,
 CF₂CF₂CF₃, CH₂CF₂CF₃, CF₂CH₂CF₃, CF₂CF₂CH₃, CHF₂CF₂CF₃,
 CF₂CHF₂CF₃, CF₂CF₂CHF₂, CF₂CF₂CH₂F, CF₂CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₂Br.

20 El resto haloalquilo puede estar sustituido con al menos un sustituyente adecuado.

Como se usa en el presente documento, "alcoxi" se refiere a grupos alcoxi que tienen 1 a 12 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 6 ó 1 a 4 átomos de
 25 carbono. Los grupos alcoxi adecuados son por ejemplo metoxi, etoxi, n-propoxi,

-21-

i-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, pentiloxi, o hexiloxi. El resto alcoxi puede estar sustituido con al menos un sustituyente adecuado.

5 Cada resto alquilo en cada grupo que tiene alquilo como parte de su configuración se puede ilustrar de manera adicional por los mismos como se ha descrito "alquilo" anteriormente.

"Acilamino" representa, por ejemplo, alquilcarbonilamino, ciclopropilcarbonilamino y benzoilamino, en los que el resto alquilo se puede
10 ilustrar por los mismos como se ha descrito "alquilo" anteriormente.

"Halógeno" y cada resto halógeno en cada grupo sustituido con halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo y yodo, preferiblemente se refiere a flúor, cloro o bromo.

15

"Cicloalquilo" se refiere a cicloalquilo C_{3-8} tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, preferiblemente se refiere a cicloalquilo C_{3-7} .

20 "Alquenilo" se refiere a alquenilo C_{2-5} tales como vinilo, alilo, 1-propenilo, 1- (o 2- o 3-) butenilo, 1-pentenilo, preferiblemente se refiere a alquenilo C_{2-4} .

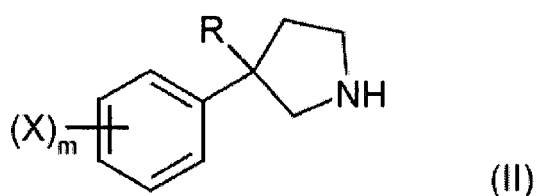
"Alquinilo" se refiere a alquinilo C_{2-5} tales como etinilo, propargilo, 1-propinilo, butano-3-inilo, pentano-4-inilo y similares, preferiblemente se refiere a alquinilo
25 C_{2-4} .

Un "grupo heterocíclico" se refiere a un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado entre N, O o S, en el que dicho anillo se refiere también a un grupo heterocíclico condensado que puede estar benzocondensado.

Los grupos heterocíclicos son por ejemplo furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, pirazolilo, oxazolilo, oxatiazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, tetrazolilo, piridilo, piperidinilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, indolilo, benzoxazolilo, quinolilo y similares.

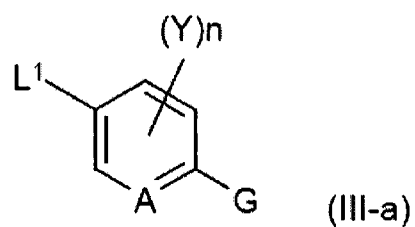
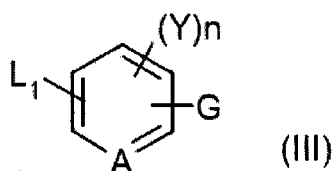
Los compuestos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención se pueden obtener, por ejemplo, mediante los procedimientos de preparación (a) a (j) descritos a continuación.

El procedimiento de preparación (a) comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II)



en la que X, R y m tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con un compuesto de fórmula (III) o fórmula (III-a)

-23-



en la que

Y, A, G y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente
5 documento ,

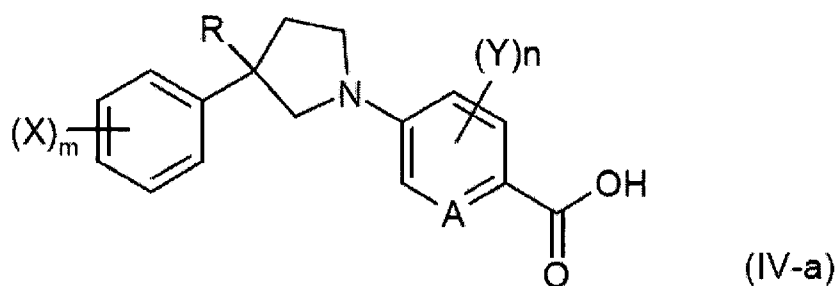
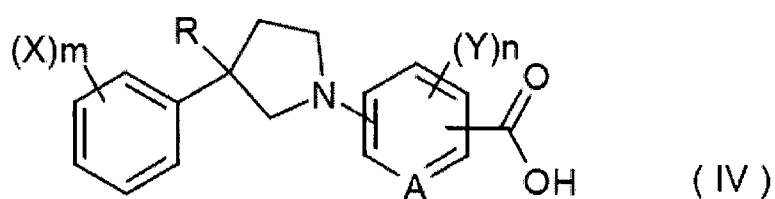
L¹ representa halógeno o un grupo haloalquil C₁-C₄ sulfoniloxi.

En una realización del procedimiento de preparación (a), los compuestos de la
10 fórmula (II) y fórmula (III) o fórmula (III-a) se hacen reaccionar en presencia de
una base o en presencia de al menos un catalizador metálico.

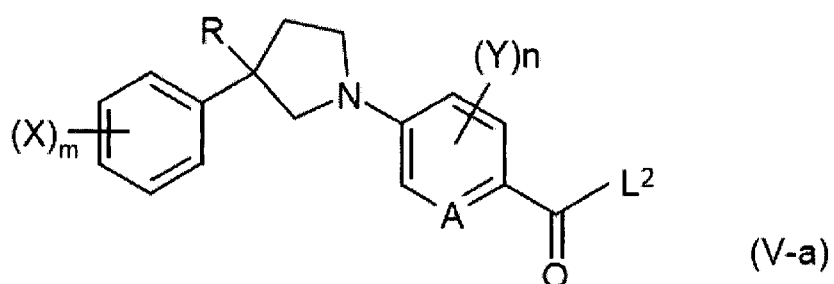
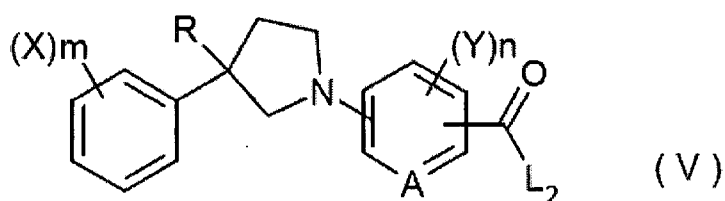
Los procedimientos de preparación (b) y (c) para la preparación de los
compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere
15 a un grupo -CONR¹R² :

El procedimiento (b) comprende hacer reaccionar un compuesto de la formula
(IV) o fórmula (IV-a)

-24-



en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , o un compuesto representado por la fórmula (V) o fórmula (V-a)



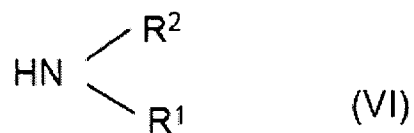
5

en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido

-25-

en el presente documento y L2 representa cloro, bromo, alquil C₁₋₄ carboniloxi, alcoxi C₁₋₄ carboniloxi o azolilo,

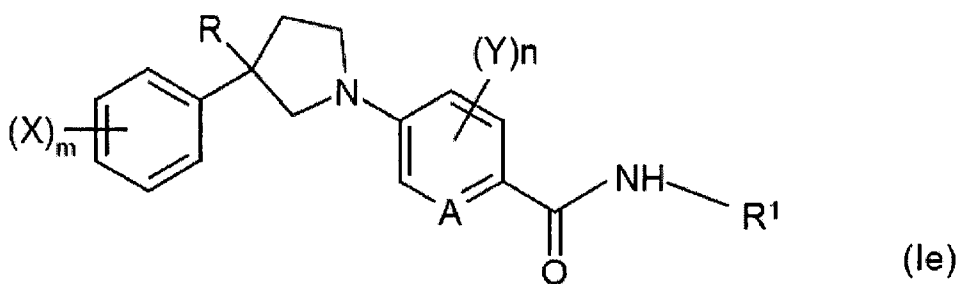
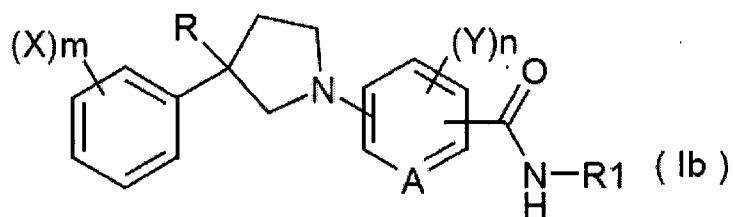
con un compuesto representado por la fórmula (VI):



5

en la que R¹ y R² tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, usando agentes de condensación, si se desea, en presencia de una base.

El procedimiento (c) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (Ib) o fórmula (Ie):



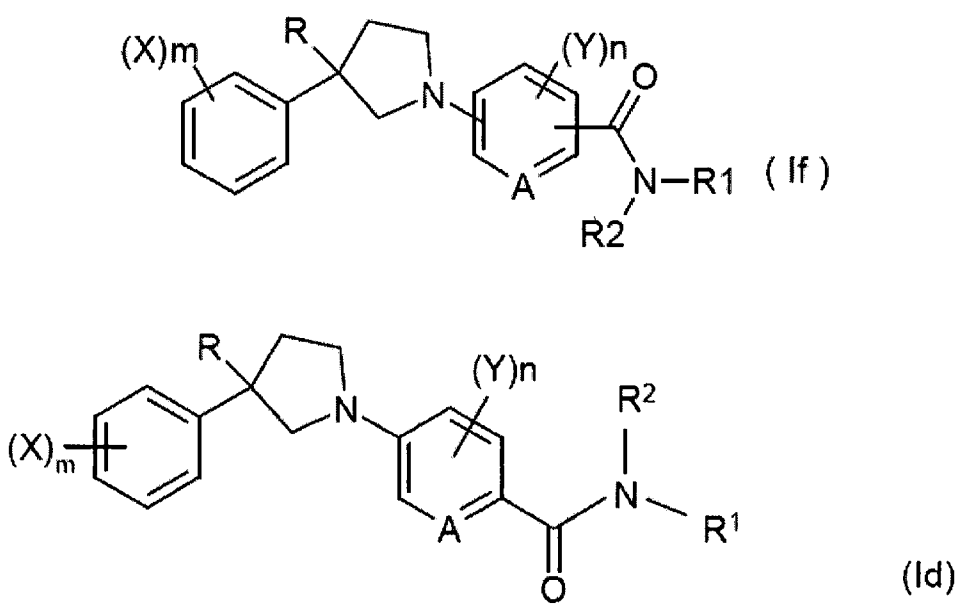
en las que X, Y, R, R¹, A, m y n tienen los mismos significados que se han

definido en el presente documento, con un compuesto representado por la fórmula:

5 R^2-L^3 (VII), en la que R^2 tiene el mismo significado como se ha definido en el presente documento y L^3 representa cloro, bromo, yodo, alquil C_{1-4} sulfonyloxi, haloalquil C_{1-4} sulfonyloxi, arilsulfonyloxi o azolilo, si se desea, en presencia de una base.

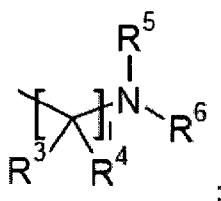
10 El procedimiento de preparación (d) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere a un grupo - $CSNR^1R^2$:

El procedimiento (d) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (If) o fórmula (Id):

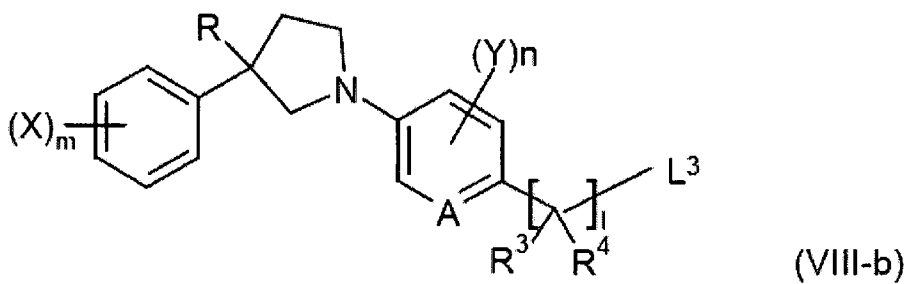
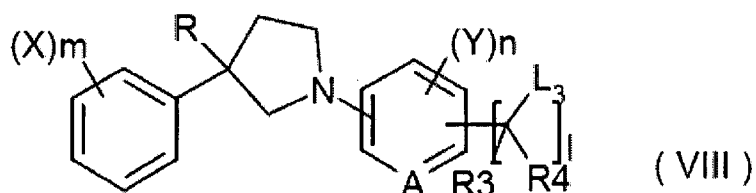


en las que X, Y, R, R¹, R², A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con agentes de sulfatación.

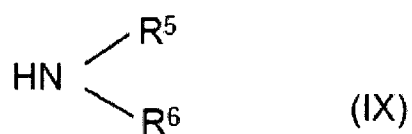
- 5 Los procedimientos de preparación (e), (f) y (g) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere a



- 10 El procedimiento (e) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VIII) o fórmula (VIII-b):



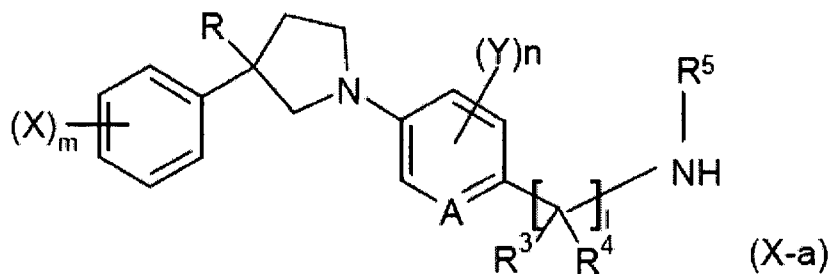
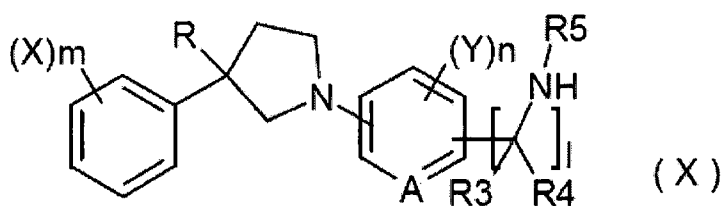
en las que X, Y, R, R³, R⁴, A, I, m, n y L³ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con un compuesto representado por la fórmula (IX):



5

en la que R⁵ y R⁶ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , si se desea , en presencia de base.

El procedimiento (f) comprende hacer reaccionar un compuesto representado
10 por la fórmula (X) o fórmula (X-a):

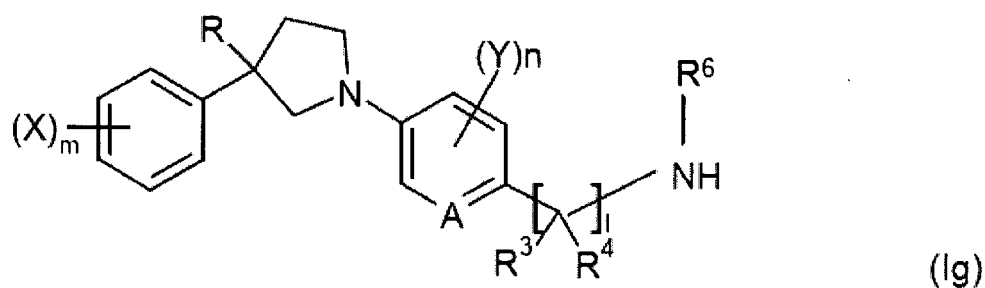
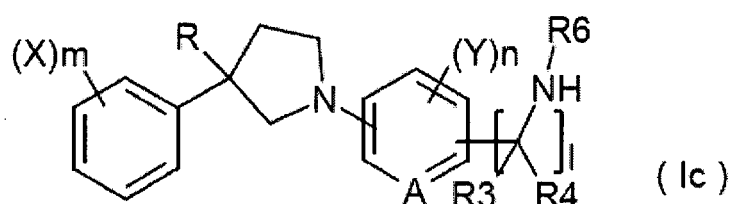


en las que X, Y, R, R³, R⁴, R⁵, A, I, m y n tienen los significados que se han definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula:

R^6-L^4 (XI)

- en la que R^6 tiene el mismo significado que se ha definido en el presente documento y L^4 representa flúor, cloro, bromo, alquil C_{1-4} -carboniloxi, alcoxi
- 5 C_{1-4} - carboniloxi, azolilo, alquil C_{1-4} sulfoniloxi, haloalquil C_{1-4} sulfoniloxi, arilsulfoniloxi, si se desea , en la presencia de una base.

El procedimiento (g) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (Ic) o fórmula (Ig):



10

en las que X, Y, R, R^3 , R^4 , R^6 , A, I, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con un compuesto representado por la fórmula

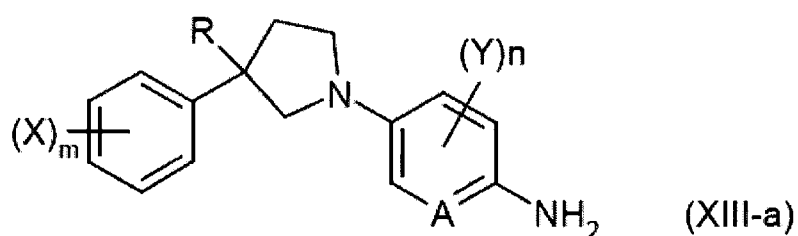
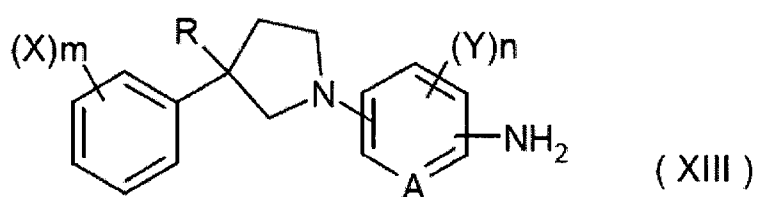
15 R^5-L^4 (XII),

-30-

en la que R^5 y L^4 tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , si se desea , en presencia de una base.

El procedimiento de preparación (h) para la preparación de los compuestos de
5 acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere G1, G6 o G8:

El procedimiento (h) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a):



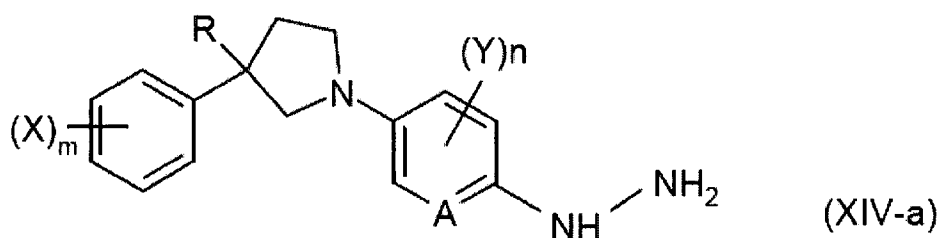
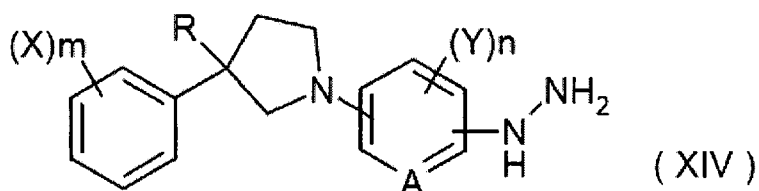
10 en las que X, Y, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con dialcoxitetrahydrofurano, 1,2-diformilohidrazina o azida de sodio y ortoformiato de trialquilo.

El procedimiento de preparación (i) para la preparación de los compuestos de
15 acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere a G2:

El procedimiento (i) comprende hacer reaccionar un compuesto representado

-31-

por la fórmula (XIV) o fórmula (XIV-a):



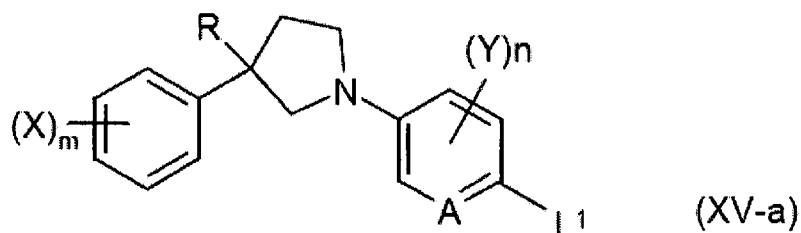
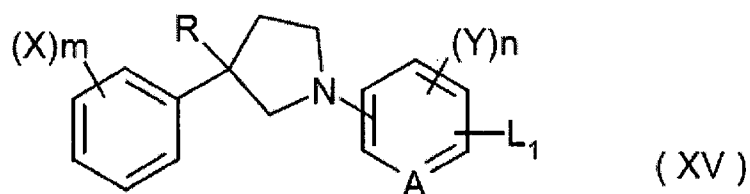
en las que X, Y, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , con 1,1,3,3-tetraalcoxipropano.

5

El procedimiento de preparación (j) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G se refiere a G2, G3, G4, G5, G6, G8 o G9:

- 10 El procedimiento (j) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XV) o fórmula (XV-a):

-32-

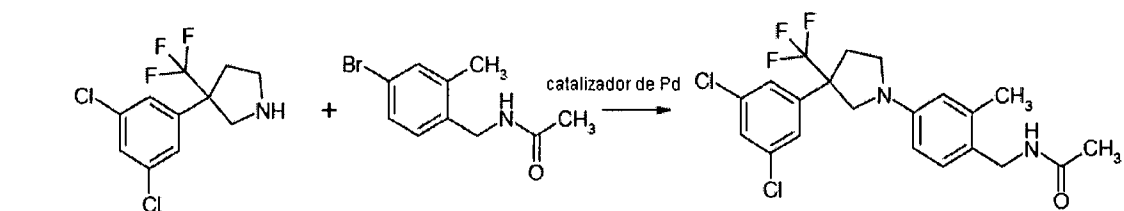


en las que X, Y, R, A, m, n y L1 tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con los grupos con protones llamados G2, G3, G4, G5, G6, G8 o G9, a saber G2-H, G3-H, G4-H, G5-H, G6-H o G8-H.

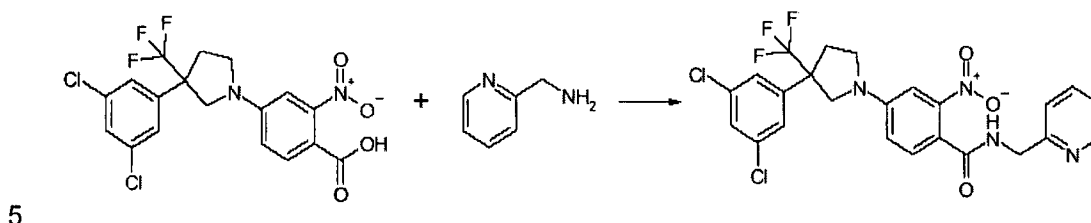
5

De acuerdo con la presente invención, las aril pirrolidinas de la fórmula anterior (I) o fórmula (Ia) de la invención muestran una potente acción insecticida.

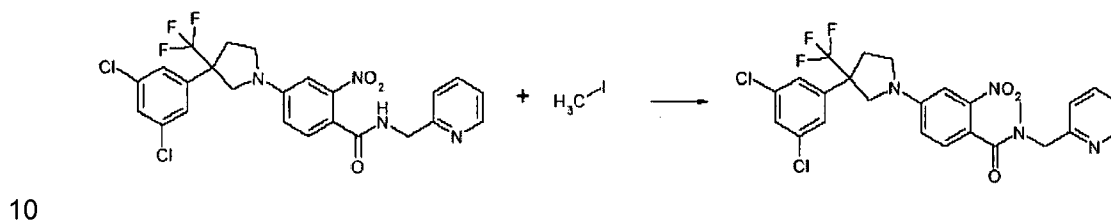
El procedimiento de preparación mencionado anteriormente (a), cuando se usa, por ejemplo, 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y N-(4-bromo-2-metilbencil)acetamida como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



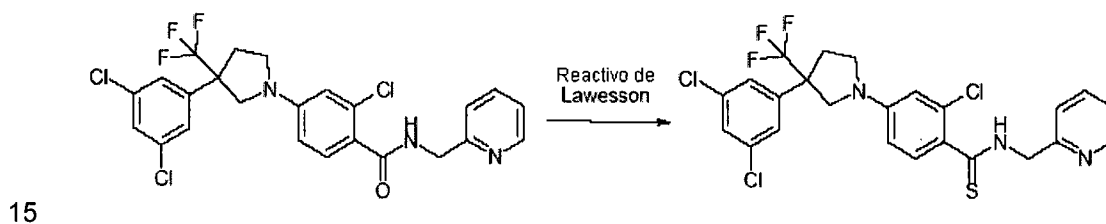
El procedimiento de preparación (b), cuando se usa, por ejemplo, ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico y 2-picolilamina como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



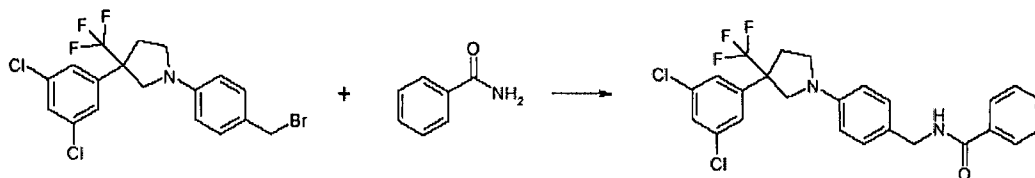
El procedimiento de preparación (c), cuando se usa, por ejemplo, 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridina-2-il-metil)benzamida y yodometano como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



El procedimiento de preparación (d), cuando se usa, por ejemplo, 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridina-2-il-metil)benzamida y reactivo Lawesson como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.

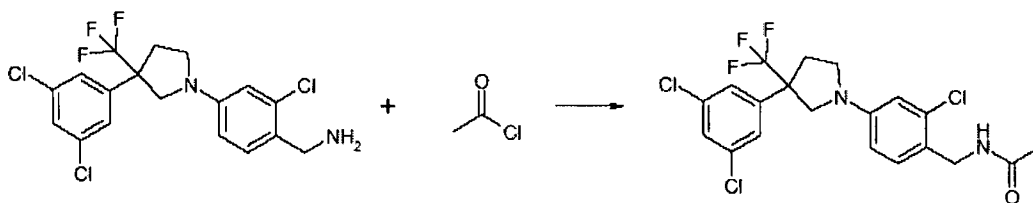


El procedimiento de preparación (e), cuando se usa, por ejemplo, 1-[4-(bromometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y benzamida como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



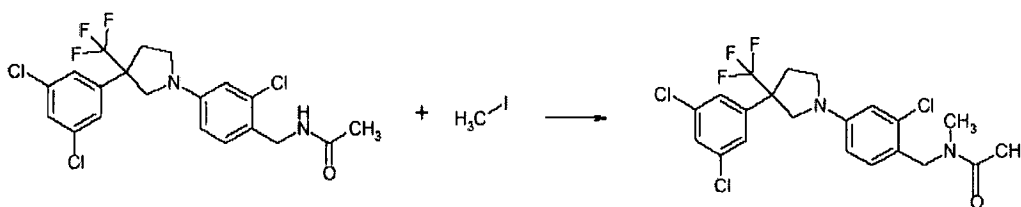
5

El procedimiento de preparación (f), cuando se usa, por ejemplo, 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina y cloruro de acetilo como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



10

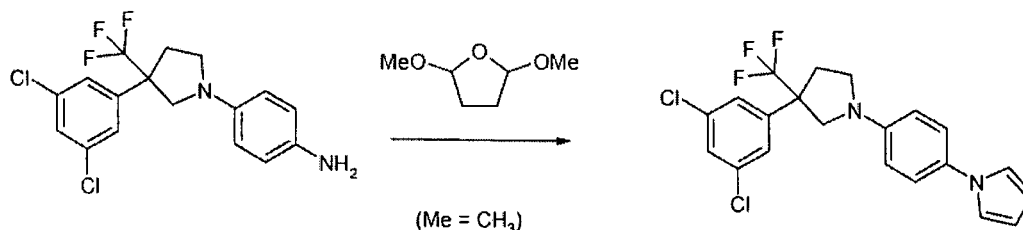
El procedimiento de preparación (g), cuando se usa, por ejemplo, N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencil}acetamida y yodometano como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



15

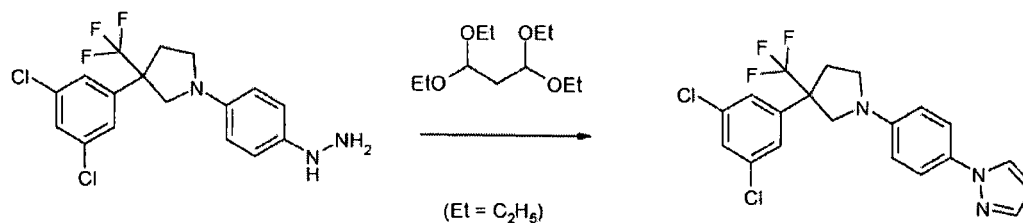
-35-

El procedimiento de preparación (h), cuando se usa, por ejemplo, 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il] anilina y 2,5-dimetoxitetrahidrofurano como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



5

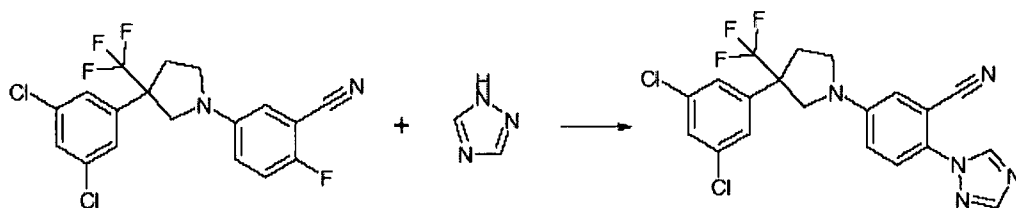
El procedimiento de preparación (i), cuando se usa, por ejemplo, 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazinofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y 1,1,3,3-tetraetoxipropano como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.



10

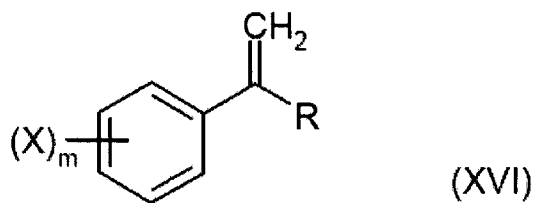
El procedimiento de preparación (j), cuando se usa, por ejemplo, 5-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo y 1H-1,2,4- triazol como materiales de partida, se puede representar por la siguiente fórmula de reacción.

-36-



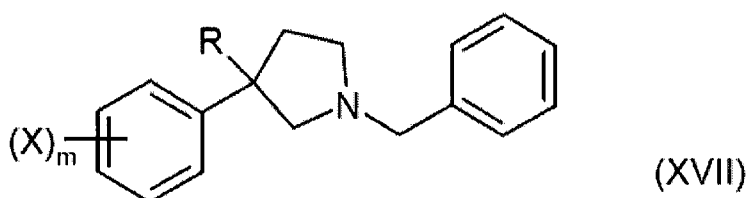
Muchos de los compuestos de la fórmula (II), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (a), son compuestos novedosos y se pueden sintetizar mediante el procedimiento descrito a continuación. El

5 compuesto representado por la fórmula (XVI):



en la que X, m y R tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento se hace reaccionar con, por ejemplo, N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil)metil]metanamina en la presencia de un catalizador para obtener

10 el compuesto representado por la fórmula (XVII) a continuación:



en la que X, m y R tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , que después se desbencila para obtener el compuesto

de la fórmula (II).

Los compuestos conocidos que tienen la fórmula (XVI) se describen por ejemplo en "The Journal of Organic Chemistry, 1991, vol.56, p.7336 - 7340";

- 5 "The Journal of Organic Chemistry, 1994, vol.59, p.2898 - 2901"; "Journal of Fluorine Chemistry, 1999, vol.95, p.167 - 170"; documento "WO2005/05085216A". Tales compuestos también se pueden sintetizar mediante los procedimientos descritos en estas publicaciones.

- 10 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XVI) incluyen [1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-cloro-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-bromo-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-nitro-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-trifluorometil-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-fluoro-2-(trifluorometil)-4-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,2,3-tricloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; o 1,3-dimetil-2-nitro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno.
- 15

- En lugar de N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil)metil] metanamina en la reacción anterior, se puede usar N-bencil-1-butoxi-N-[(trimetilsilil)metil] metanamina o N-(butoximetil)-N-[(trimetilsilil)metil] ciclohexilamina. Estos compuestos son bien conocidos.
- 20

- Los catalizadores usados en la reacción anterior pueden incluir ácido trifluoroacético, trimetilsilil trifluorometansulfonato, yodotrimetilsilano, fluoruro
- 25

de cesio y similares.

La reacción anterior se puede realizar de acuerdo con los procedimientos descritos en "Chemistry Letters, 1984, 1117 - 1120" y "Tetrahedron Letters, 1993, 34, 3279 - 3282", y la reacción de desprotección tal como desbencilación se puede realizar de acuerdo con los procedimientos descritos en "Journal of the Organic Chemistry, 1984, 49, 2081" y "PROTECTIVE GROUPS en ORGANIC CHEMISTRY TERCERA EDICIÓN, JOHN WILEY & SONS, INC".

- 10 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (II) en el procedimiento de preparación (a) incluyen:

3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina; 3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil) pirrolidina; 3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina; 3-(3,5-dimetil-4-nitrofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina.

15

Muchos de los compuestos de la fórmula (III) o fórmula (III-a), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (a), son compuestos conocidos, que se pueden sintetizar mediante los procedimientos bien conocidos en la química orgánica.

20

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (III) y fórmula (III-a), respectivamente, incluyen: N-(4-bromobencil)acetamida, N-(4-yodobencil)acetamida.

- 25 La reacción de los procedimientos de preparación (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g),

(h), (i) y (j) se puede realizar en un diluyente adecuado tal como hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano, heptano etc.), hidrocarburos halogenados alifáticos (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno etc.), éteres (por ejemplo, dietiléter, dibutiléter, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano, dioxano etc.), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, propionato de etilo etc.), amidas (por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona etc.), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo etc.), dimetilsulfóxido (DMSO),
10 agua o sus disolventes mixtos.

La reacción de los procedimientos de preparación (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) y (j) se puede realizar usando las siguientes bases tales como bases de metales alcalinos (por ejemplo, hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, butil litio, terc-butil litio, trimetilsilil litio, hexametildisilazida de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, fosfato de tripotasio, acetato de sodio, acetato de potasio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, terc- butóxido de sodio, y terc-butóxido de potasio, etc.), bases orgánicas (por ejemplo, trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano, imidazol etc.).
15
20

Los procedimientos de preparación (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) y (j) se pueden realizar dentro de un amplio intervalo de temperatura. En general, se
25 puede realizar a la temperatura en el intervalo entre aproximadamente - 78 °C y

aproximadamente 200 °C, preferiblemente entre aproximadamente -10 °C y aproximadamente 150 °C. Dicha reacción se realiza preferiblemente a presión normal aunque se puede realizar a alta presión o presión reducida. El tiempo de reacción está entre 0,1 y 72 horas, preferiblemente entre 0,1 y 24 horas.

5

La reacción del procedimiento de preparación (a) también se puede realizar usando catalizadores metálicos adecuados tales como catalizadores de metales de transición como por ejemplo $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$, $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ (dba=dibenciliden acetona), $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, CuI , o Cu_2O . Si se desea, se puede

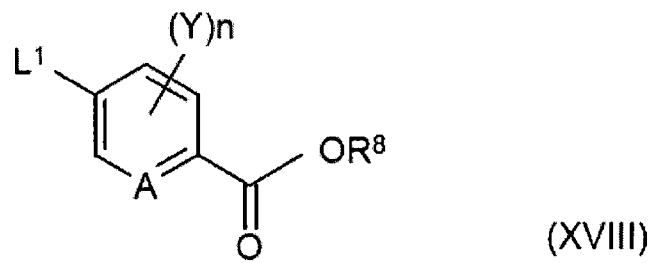
10 realizar usando ligandos de fosfina tales como 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (BINAP), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (Xantphos) tributilfosfina y similares o ligandos de amina tales como 8-quinolinol, prolina, N,N-dimetilglicina y similares.

- 15 En la realización del procedimiento de preparación (a), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (II) se hace reaccionar con 1 a 3 moles del compuesto de la fórmula (III) o fórmula (III-a) en presencia de 1 a 3 moles de base y una cantidad catalítica de $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ y Xantphos en un diluyente tal como tolueno para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o
- 20 fórmula (Ia) de la invención.

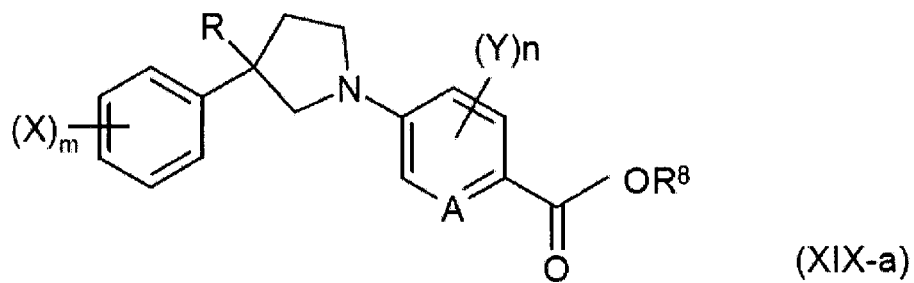
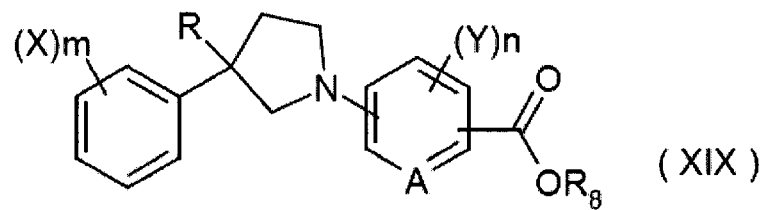
Los compuestos de la fórmula (IV) o fórmula (IV-a), que se usan en el procedimiento de preparación (b), son compuestos novedosos. Se pueden sintetizar mediante los procedimientos descritos a continuación. El compuesto

25 de la fórmula (II) se puede hacer reaccionar con un compuesto representado

por la fórmula (XVIII):



en la que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el
5 presente documento, R⁸ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄, para obtener un
compuesto de la fórmula (XIX) o fórmula (XIX-a):



10

en la que X, Y, R, A, m, n y R⁸ tienen los mismos significados que se han
definido en el presente documento. Cuando R⁸ representa alquilo C₁₋₄, el

compuesto de la fórmula anterior (XIX) o fórmula (XIX-a) se puede hidrolizar para obtener el compuesto de la fórmula (IV) o fórmula (IV-a).

Los compuestos de la fórmula (XVIII) se conocen e incluyen por ejemplo, los
5 siguientes compuestos: 4-yodobenzoato de metilo; 4-bromo-2-metilbenzoato de metilo; 2-fluoro-4-yodobenzoato de etilo; 2-cloro-4-yodobenzoato de metilo; 2-bromo-4-yodobenzoato de metilo; 4-fluoro-2-nitrobenzoato de metilo; y 4-fluoro-2-(trifluorometil) benzoato de etilo.

10 Los compuestos de la fórmula (V) o fórmula (V-a), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (b), son compuestos bien conocidos.

Por ejemplo, el compuesto de formula (IV) o fórmula (IV-a) se puede obtener
15 fácilmente mediante el procedimiento que comprende una reacción con un agente de cloración tales como cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, o pentacloruro de fósforo, o el procedimiento que comprende una reacción con un haluro orgánico tal como cloruro de pivaloilo, o el procedimiento que comprende una reacción con carbonil diimidazol o sulfonil imidazol etc.

20 Los compuestos representativos de la fórmula (IV) y fórmula (IV-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (b) incluyen:

ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il] benzoico; ácido 4-[3-
25 (3,5-

-43-

diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico; ácido 4-{3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico; ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(trifluorometil) benzoico y similares.

5

Los compuestos representativos de la fórmula (V) y fórmula (V-a), respectivamente, incluyen: cloruro de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il] benzoílo; cloruro de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoílo; cloruro de 4-{3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoílo y similares.

10

Los compuestos de la fórmula (VI), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (b), son compuestos bien conocidos.

15 Los ejemplos representativos incluyen: metilamina; etilamina, ciclopropilamina, propargilamina, 2,2,2-trifluoroetilamina, 2-picolilamina, 3-aminometil-6-cloropiridina y similares.

La reacción del procedimiento de preparación (b) se puede realizar usando los siguientes agentes de condensación: 1,3-diciclohexil carbodiimida (DCC), clorhidrato de 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)-carbodiimida (WSCl), carbonildiimidazol (CDI), dietil cianofosfato (DEPC), yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio (Mukouyama Reagent) y similares.

20

25 En la realización del procedimiento de preparación (b), por ejemplo, 1 mol del

compuesto de la fórmula (IV) o fórmula (IV-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles del compuesto de la fórmula (VI) usando 1 mol a 3 moles de un agente de condensación, si se desea, con una cantidad catalítica de un aditivo tal como 1-hidroxibenzotriazol en un diluyente (por ejemplo, DMF) para obtener
5 el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia).

Los compuestos de la fórmula (Ib) o fórmula (Ie), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (c), están comprendidos en la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención obtenidos mediante el
10 procedimiento de preparación (b).

Los compuestos de la fórmula (VII), que son los materiales de partida son compuestos bien conocidos y los ejemplos específicos incluyen yodometano, yodoetano y similares.

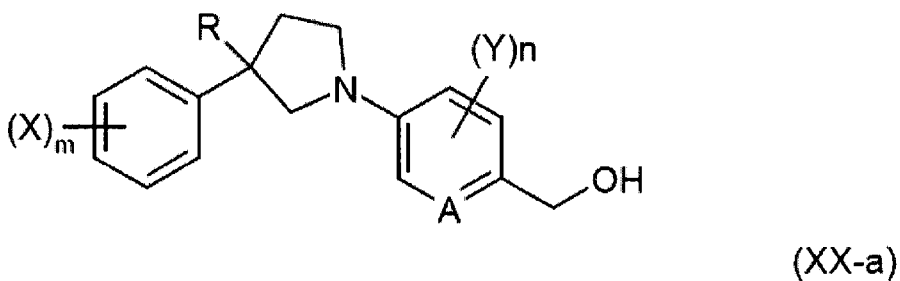
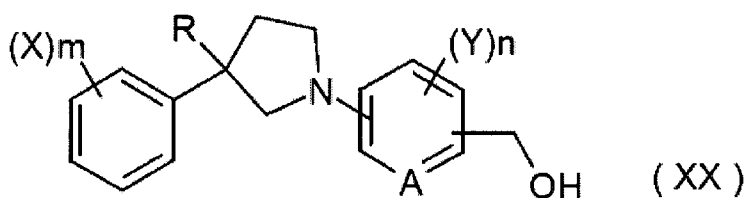
15

En la realización del procedimiento de preparación (c), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (Ib) o fórmula (Ie) se puede hacer reaccionar con 1 a 5 moles del compuesto de la fórmula (VII) en la presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la
20 fórmula (I) o fórmula (Ia).

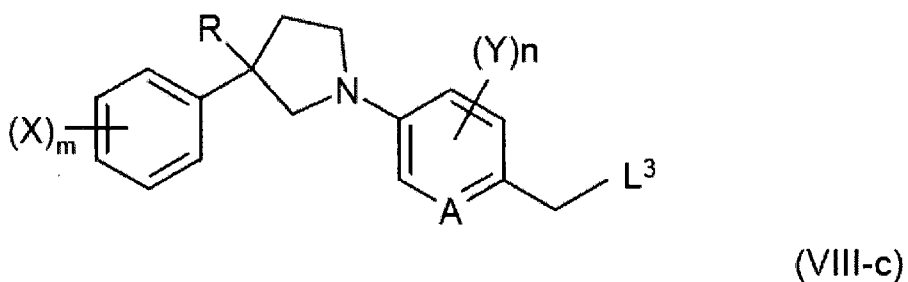
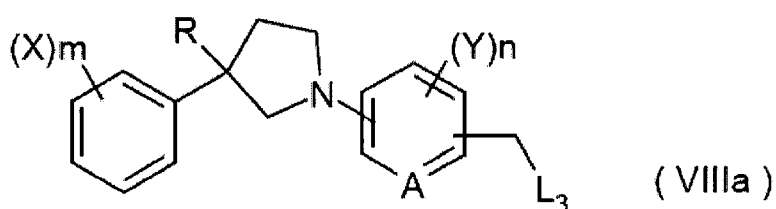
Los compuestos de la fórmula (If) o fórmula (Id), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (d), están comprendidos en la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención obtenidos por el
25 procedimiento de preparación anterior (b) o (c).

Los agentes de sulfuración usados en el procedimiento de preparación (d) pueden incluir pentasulfuro de fósforo, reactivo de Lawesson y similares.

- 5 En la realización del procedimiento de preparación (d), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula general (If) o fórmula (Id) se puede hacer reaccionar con 0,5 a 3 moles de reactivo de Lawesson en un diluyente (por ejemplo, tolueno) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia).
- 10 Los compuestos de la fórmula (VIII) o fórmula (VIII-b), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (e), son compuestos novedosos y se pueden sintetizar mediante el procedimiento de más adelante. El compuesto de la formula anterior (XIX) o fórmula (XIX-a) se puede reducir para obtener el compuesto representado por la fórmula (XX) o fórmula (XX-a):



en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, que después se pueden someter a una reacción tal como halogenación o alquilsulfonilación de la manera usual para obtener el compuesto representado por la fórmula (VIII-a) o (VIII-c):



5

en las que X, Y, R, A, m, n y L^3 tienen las mismas definiciones que antes.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (VIII) y fórmula (VIII-b), respectivamente, en el procedimiento de preparación (e) incluyen: 1-[3-cloro-4-(clorometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il] bencilmetansulfonato; 1-[3-bromo-4-(clorometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y similares.

15

Los compuestos de la fórmula (IX), que son los materiales de partida en el

procedimiento de preparación (e), son compuestos bien conocidos y los ejemplos representativos incluyen: acetoamida; propionamida; benzamida; 2-clorobenzamida; 3-clorobenzamida; 4-clorobenzamida y similares.

- 5 En la realización del procedimiento de preparación (e), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (VIII) o fórmula (VIII-b) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (IX) en la presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia).

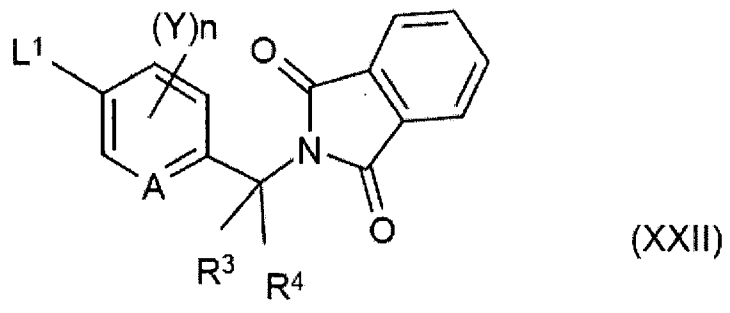
10

Los compuestos de la fórmula (X), o fórmula (X-a) que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (f), son compuestos novedosos y se pueden obtener haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula (VIII) o fórmula (VIII-b) con un compuesto R^5-NH_2 (XXI) en la que R^5 tiene el mismo

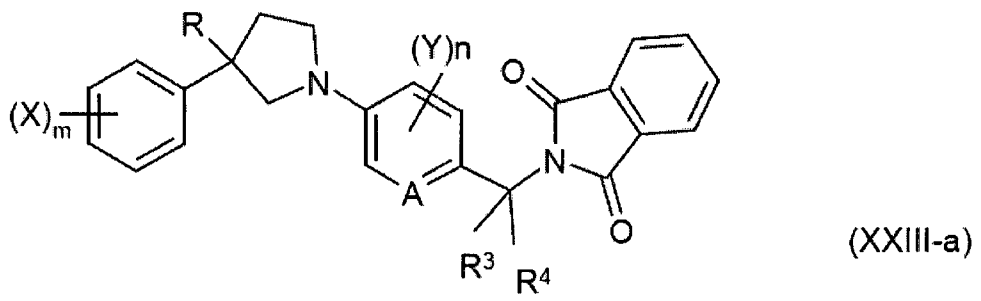
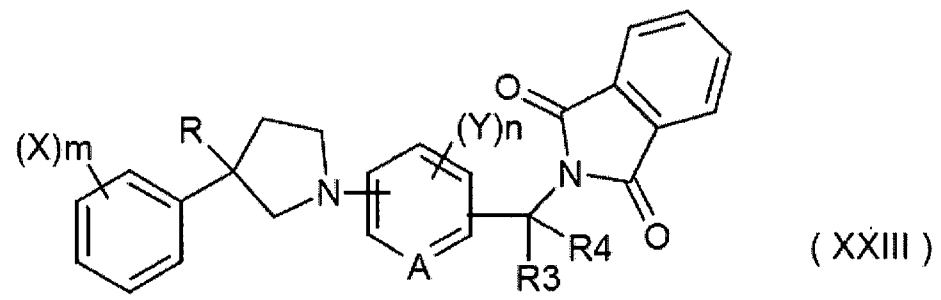
15 significado que se ha definido en el presente documento.

Los compuestos de la fórmula (X) o fórmula (X-a) en la que I es 1 también se pueden sintetizar mediante el procedimiento alternativo que comprende hacer reaccionar un compuesto de la fórmula anterior (II) con un compuesto

20 representado por la fórmula (XXII):



en la que Y, A, R³, R⁴, n y L¹ tienen los mismos significados que se han
definido en el presente documento , para obtener el compuesto representado
5 por la fórmula (XXIII) o fórmula (XXIII-a):



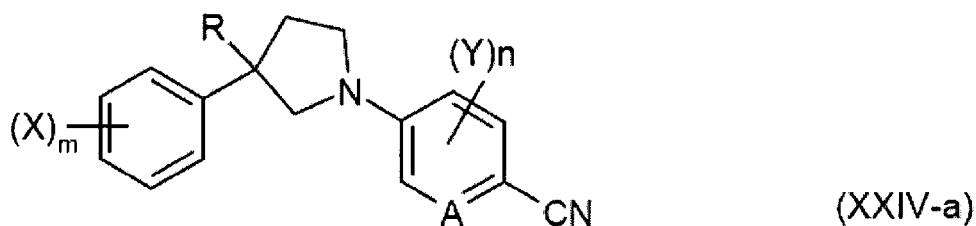
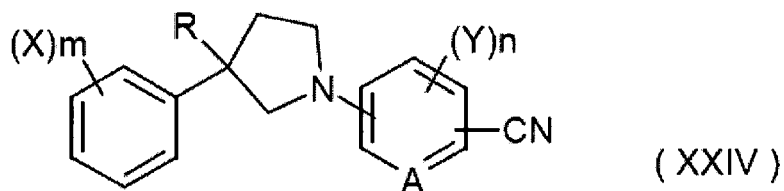
en las que X, Y, R, A, m, n, R³ y R⁴ tienen los mismos significados que se han

definido en el presente documento, que después se hace reaccionar de acuerdo con la reacción sintética de Gabriel.

Los compuestos de la fórmula anterior (XXII) son compuestos conocidos e incluyen: 2-(4-bromobencil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona; 2-(4-bromo-2-nitrobencil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona; 2-(4-yodobencil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona; 2-(4-yodo-2-nitrobencil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona; 2-(2-cloro-4-yodobencil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona.

10 Los compuestos de la fórmula (X) o fórmula (X-a) en las que R^3 , R^4 y R^5 representan hidrógeno se pueden sintetizar fácilmente mediante el procedimiento alternativo que comprende la reacción de reducción usual del compuesto nitrilo

Representado por la fórmula (XXIV) o fórmula (XXIV-a):



en las que X, Y, R, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento.

Los compuestos de la fórmula anterior (XXIV) o fórmula (XXIV-a) son
5 compuestos novedosos y se pueden obtener como se muestra en el ejemplo de síntesis 8 descrito a continuación.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (X) y fórmula (X-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (f) incluyen: 1-{2-cloro-
10 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina; 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]fenil}metanamina y similares.

Los compuestos de la fórmula (XI), que son los materiales de partida en el
15 procedimiento de preparación (f), son compuestos bien conocidos, y los ejemplos específicos incluyen: cloruro de acetilo; cloruro de propionilo; cloruro de benzoilo; cloruro de 2-clorobenzoilo; cloruro de 3-clorobenzoilo; cloruro de 4-clorobenzoilo; clorhidrato de nicotinoilcloruro y similares.

20 En la realización del procedimiento de preparación (f), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (X) fórmula (X-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (XI) en la presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia).

Los compuestos de la fórmula (Ic) o fórmula (Ig), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (g), están comprendidos en la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención obtenidos mediante el procedimiento de preparación anterior (e) o (f).

5

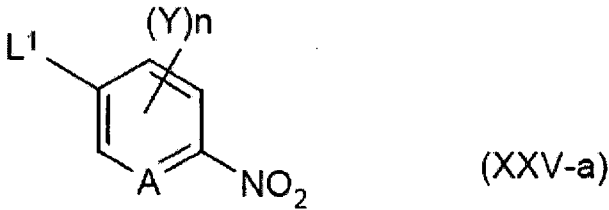
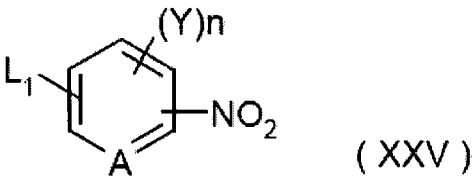
Los compuestos de la fórmula (XII), que son los materiales de partida son bien conocidos y los ejemplos específicos incluyen yodometano, yodoetano, cloruro de acetilo y similares.

En la realización del procedimiento de preparación (g), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (Ic) o fórmula (Ig) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (XII) en la presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia).

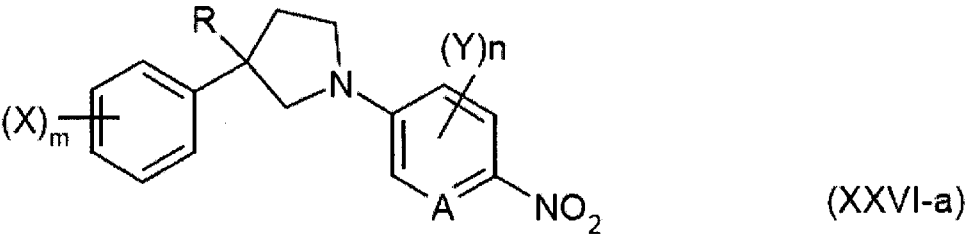
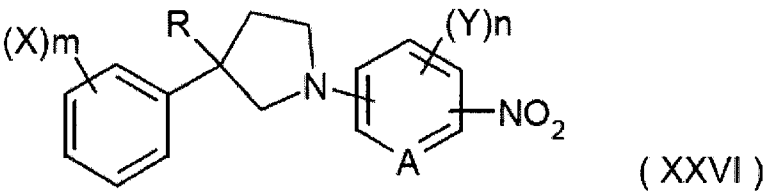
15 Los compuestos de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (h), son compuestos novedosos y se pueden sintetizar mediante el procedimiento descrito a continuación.

Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (II) se hace reaccionar con un compuesto representado por la fórmula (XXV) o fórmula (XXV-a):

20



en las que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , para obtener un compuesto representado por la fórmula
5 (XXVI) o fórmula(XXVI-a):



en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento , que después se reduce para obtener el compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a).

Los ejemplos específicos de los compuestos de fórmula (XXV) y fórmula (XXV-a) incluyen: 2-fluoro-4-nitrobenceno; 2-bromo-4-nitrobenceno; 2-yodo-4-nitrobenceno; 2-bromo-4-fluoronitrobenceno; 4-fluoro-2-metilnitrobenceno y
5 similares.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XIII) y fórmula (XIII-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (h) incluyen: 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]anilina; 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]anilina y similares.
10

Dialcoxi tetrahidrofuranos, que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (h), son compuestos conocidos y los ejemplos específicos incluyen: 2,5-dimetoxitetrahidrofurano; 2,5-dietoxitetrahidrofurano y
15 similares.

En la realización del procedimiento de preparación anterior (h), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 5 moles de 2,5-dimetoxitetrahidrofurano en un diluyente (por
20 ejemplo, ácido acético) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención.

En el procedimiento de preparación (h), dicha reacción, cuando se usa 1,2-diformilhidrazina, se puede realizar en presencia de una base y
25 trialquilhalosilano.

Los ejemplos de la base pueden incluir bases orgánicas tales como trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, 5 diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano, imidazol etc.

Los ejemplos representativos de trialquilhalosilanos incluyen: trimetilclorosilano; trietilclorosilano; trimetilbromosilano y similares.

10 En la realización del procedimiento de preparación (h), 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 5 moles de 1,2-diformilhidrazina, 1 a 10 moles de base y 1 a 25 moles de trialquilhalosilano en una cantidad en gran exceso de piridina para obtener el compuesto correspondiente deseado de la fórmula (I) o fórmula (Ia).

15

En el caso de la reacción de azida de sodio con ortoformiato de trialquilo en el procedimiento de preparación (h), los ejemplos de ortoformiatos de trialquilo pueden incluir ortoformiato de trimetilo y ortoformiato de trietilo y similares.

20 En la realización del procedimiento de preparación (h), 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles de azida de sodio y 1 a 10 moles de ortoformiato de trialquilo en un diluyente (por ejemplo, ácido acético) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención.

25

-55-

Los compuestos de la fórmula (XIV) o fórmula (XIV-a), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (i), son compuestos novedosos y se pueden sintetizar mediante el procedimiento descrito a continuación. Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (XIII) o fórmula (XIII-a) se
5 somete a reacción de Sandmeyer, que se conoce en el campo de la química orgánica, seguido de la reducción para obtener el compuesto de la fórmula (XIV) o fórmula (XIV-a).

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XIV) y fórmula
10 (XIV-a), respectivamente pueden incluir: 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazinofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazino-3-metilfenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y similares.

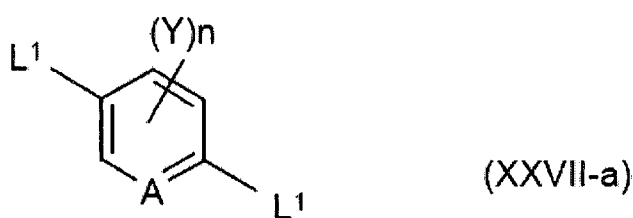
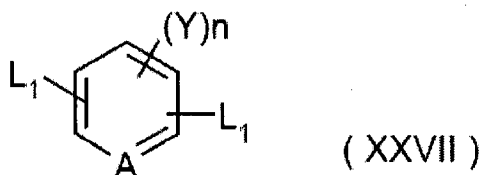
Los 2,5-dialcoxi tetrahidrofuranos, que se usan como material de partida en el
15 procedimiento de preparación (i), son compuestos conocidos y los ejemplos representativos incluyen: 1,1,3,3-tetrametoxipropano; 1,1,3,3-tetraetoxipropano y similares.

En la realización del procedimiento de preparación anterior (i), por ejemplo, 1
20 mol del compuesto de la fórmula (XIV) o fórmula (XIV-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 5 moles de 1,1,3,3-tetraalcoxipropano con, si se desea, la adición de una cantidad catalítica de ácido tal como ácido sulfúrico en un diluyente (por ejemplo, etanol) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención.

25

Los compuestos de la fórmula (XV) o fórmula (XV-a), que son el material de partida en el procedimiento de preparación (j), son compuestos novedosos y se pueden sintetizar mediante el procedimiento descrito a continuación. Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (II) se hace reaccionar

5 con un compuesto representado por la fórmula (XXVII) o fórmula (XXVII-a)



en las que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, para obtener el compuesto de la fórmula (XV) o fórmula

10 (XV-a).

Los ejemplos específicos de los compuestos de la fórmula anterior (XXVII) y fórmula (XXVII-a), respectivamente, incluyen: 2-fluoro-5-yodobenzonitrilo; 5-bromo-2-fluorobenzonitrilo; 1-cloro-4-yodo-2-nitrobenceno; 1,4-

15 dibromobenceno; 1,4-diyodo benceno y similares.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XV) y fórmula (XV-a), respectivamente en el procedimiento de preparación (j) pueden incluir:

-57-

5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo; 5-{3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il}-2-fluorobenzonitrilo y similares.

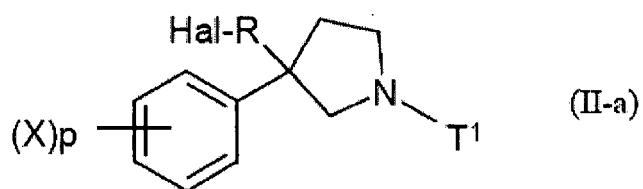
- 5 Muchos de los compuestos representados por la fórmula G2-H, G3-H, G4-H, G5-G, G6-H, G8-H, G9-H, que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (j), son compuestos conocidos y los ejemplos específicos pueden incluir: 1H-imidazol; 1H-pirazol; 4-metil-1H-pirazol; 4-fluoro-1H-pirazol; 4-cloro-1H-pirazol; 4-bromo-1H-pirazol; 4-yodo-1H-pirazol; 4-nitro-1H-pirazol; 4-metil-1H-pirazol; 3-trifluorometil-1H-pirazol; 4-trifluorometil-1H-pirazol; 4-ciano-1H-pirazol; 1H-1,2,3-triazol; 1H-1,2,4-triazol; 1H-tetrazol; 5-metil-1H-tetrazol; 5-(metiltio)-1H-tetrazol y similares.

- En la realización del procedimiento de preparación (j), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (XV) o fórmula (XV-a) se puede hacer reaccionar con 1 a 3 moles of G6-H en la presencia de 1 a 3 moles de base en un diluyente (por ejemplo, DMF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención.

- 20 En los procedimientos de preparación de los compuestos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención, los materiales novedosos entre los compuestos que son las materias primas (materiales de partida e intermedios) se pueden representar de manera colectiva por la fórmula descrita a continuación.

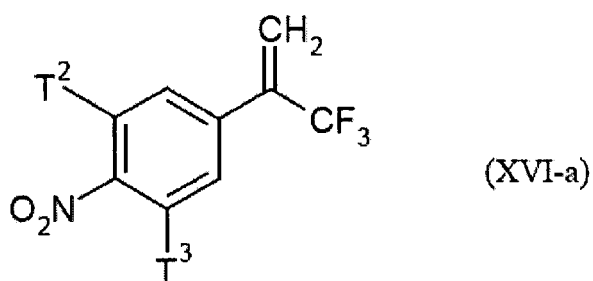
-58-

Fórmula (II-a)



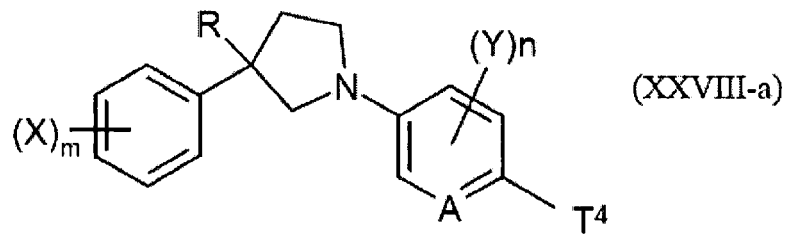
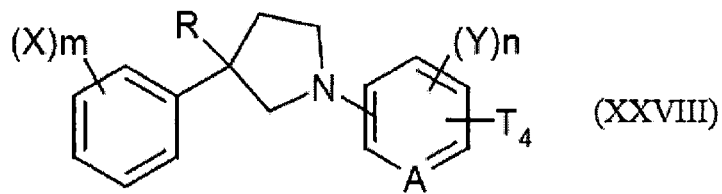
en la que X tiene el mismo significado que se ha definido en el presente
 5 documento, T¹ representa hidrógeno o bencilo, Hal-R representa haloalquilo y p
 representa 1, 2, 3, 4 ó 5.

Fórmula (XVI-a)

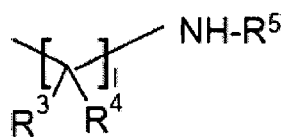
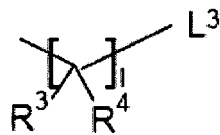
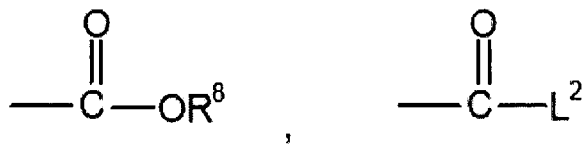


10 en la que T² y T³ cada uno de ellos representa independientemente alquilo.

Los compuestos de la fórmula (XXVIII) o los compuestos de fórmula (XXVIII-a)



en las que X, Y, R, A, m y n tienen la misma definición que antes, T⁴ representa:



5

ciano, amino o nitro, R⁸, L², L³, R³, R⁴ y R⁵ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento .

Los compuestos de acuerdo con la presente invención tienen una potente actividad insecticida y acaricida. Por lo tanto, los compuestos representados por la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención se pueden usar como insecticidas y / o acaricidas. Son particularmente útiles en el campo agrícola.

- 5 Los compuestos de acuerdo con la presente invención también ejercen un efecto de control apropiado contra los insectos perjudiciales sin fitotoxicidad contra las plantas cultivadas. Además, los compuestos de la presente invención se pueden usar para controlar una amplia diversidad de plagas que incluyen, por ejemplo, insectos succionadores perjudiciales, insectos mordedores, y otras
- 10 plantas parásitas de plantas, plagas de grano almacenado y plagas higiénicas así como las plagas en el campo veterinario y se pueden aplicar para su control, en particular la erradicación y exterminación. Por lo tanto, la presente invención también abarca un procedimiento para combatir plagas perjudiciales.

- 15 Tales insectos de plaga incluyen por ejemplo

escarabajos, tales como el escarabajo de la alubia adzuki (*Callosobruchus Chinensis*), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), escarabajo de la harina rojo (*Tribolium Castaneum*), mariquita grande de 28 manchas (*Epilachna*

20 *vigintioctomaculata*), gusano de alambre de la cebada (*Agriotes fuscicollis*), escarabajo de la soja (*Anomala rufocuprea*), escarabajo de la patata colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), diabrotica (*Diabrotica spp.*), aserrador del pino japonés (*Monochamus alternatus*), gorgojo del agua de arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), escarabajo pulverizador de la madera (*Lyctus bruneus*),

25 escarabajo de la hoja de curcubitáceas (*Aulacophora femoralis*).

Plagas de Lepidoptera, tales como la polilla gitana (*Lymantria dispar*), oruga de la tienda (*Malacosoma neustria*), oruga blanquita de la col (*Pieris rapae*), oruga común (*Spodoptera litura*), polilla de la col (*Mamestra brassicae*), barrenador
 5 del arroz de rayas (*Chilo suppressalis*), taladro del maíz (*Prausta nubilalis*), polilla de la grosella (*Ephesia cautella*), polilla tortrix de los frutos de verano (*Adoxophyes orana*), polilla de la manzana (*Carpocapsa pomonella*), polilla de la oruga común (*Agrotis fucosa*), polilla de la cera (*Galleria mellonella*), polilla dorso de diamante (*Plutella maculipennis*), *Heliothis* (*Heliothis virescens*),
 10 taladrador de la hoja de cítricos (*Phyllocnistis citrella*).

Plagas de Hemípteros, tal como saltamontes de la hoja del arroz verde (*Nephotettix cincticeps*), saltamontes de la planta marrón (*Nilaparvata lugens*), piojo harinosos de Comstock mealybug (*Pseudococcus comstocki*), cochinilla
 15 asiática (*Unaspis yanonensis*), pulgón verde (*Myzus persicae*), pulgón verde de la manzana (*Aphis pomi*), pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), pulgón del nabo (*Phopalosiphum pseudobrassicae*), Nashi-gunbai chinche del peral (*Stephanitis nashi*), *Nazara* (*Nazara* spp.), mosca blanca de invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), *Pshylla* (*Pshylla* spp.).

20

Plagas de Thrips, tales como thrips del melon (*Thrips palmi*), thrip de las flores de verano (*Frankliniella occidentalis*).

Plagas de ortópteros, tales como la cucaracha alemana (*Blattella germanica*),
 25 cucaracha americana (*Periplaneta americana*), grillo topo (*Gryllotalpa africana*),

langosta migratoria (*Locusta migratoria migratoria*)

Plagas de isópteros, tales como termita subterránea japonesa (*Reticulitermes speratus*), termita (*Coptotermes formosanus*);

5

Plagas de dípteros, tales como la mosca común (*Musca domestica*), mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), mosca de la semilla de alubia (*Hylemia platura*), Mosquito Aka-ie-ka (*Culex pipiens*), mosquito anopheles Sina-hamadara-ka (*Anopheles sinensis*), kodaka-aka-ie-ka mosquito del arroz
10 (*Culex tritaeniorhynchus*), minador de la hoja en serpentina americano (*Liriomyza trifolii*).

Plagas de ácaros, tales como Nise-nami-hadani arena color carmín (*Tetranychus cinnabarinus*), Nami-ha-dani (*Tetranychus urticae*), ácaro rojo de
15 de los cítricos (*Panonychus citri*), ácaro rosa de los cítricos (*Aculops pelekassi*), *Tarsonemus* (*Tarsonemus* spp.).

Plagas de nematodos, tales como nematodo de la raíz de patata dulce (*Meloidogyne incognita*), nematodo de la madera del pino (*Bursaphelenchus*
20 *lignicolus* Mamiya et Kiyohara), nematodo del arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nematodo del quiste de la soja (*Heterodera glycines*), nematodo del prado (*Pratylenchus* spp.).

25 De manera adicional, los compuestos de acuerdo con la invención, en

combinación con una buena tolerancia de plantas y toxicidad favorable para los animales de sangre caliente que son bien tolerados por el ambiente, son adecuados para la protección de las plantas y los órganos de las plantas, para incrementar los rendimientos de las cosechas, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar las plagas de animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en agricultura, en horticultura, en la cría de animales de granja, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio, en la protección de los productos y materiales almacenados, en higiene y sector de la salud animal. Se pueden empelar preferiblemente como agentes de protección de plantas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas fases de desarrollo. Las plagas que se pueden combatir mediante el uso de los compuestos y composiciones de acuerdo con la invención incluyen además entre otros:

15

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

De la clase de los Arachnida, 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.,

25

Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Scorpio maurus, Stenotarsonemus spp., Tarsonemus spp., Tetranychus spp., Vasates lycopersici.

- 5 De la clase de los Bivalva, por ejemplo, Dreissena spp.

Del orden de los Chilopoda, por ejemplo, Geophilus spp., Scutigera spp.

- Der orden de los Coleoptera, por ejemplo, Acanthoscelides obtectus, Adoretus
- 10 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., Ceuthorrhynchus spp., Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., Costelytra zealandica, Curculio spp., Cryptorhynchus lapathi, Dermestes spp.,
- 15 Diabrotica spp., Epilachna spp., Faustinus cubae, Gibbium psyllodes, 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
- 20 xanthographus, Niptus hololeucus, 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.,
- 25 Tenebrio molitor, Tribolium spp., Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus

spp., *Zabrus* spp.; así como *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium Castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lyctus bruneus*, y *Aulacophora*
5 *femoralis*.

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

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

10

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

Del orden de los Diptera, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp.,
15 *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 hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxis* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula*
20 *paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.; así como *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus* y *Liriomyza trifolii*.

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

- 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.,
- 5 *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa* *Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp.,
- 10 *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

15

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

- Del orden de los Heteroptera, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp.,
- 20 *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 quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp.,
- 25 *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp.,

Triatoma spp.

- Del orden de los Homoptera, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonosцена* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp.,
- 5 *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., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis*
- 10 *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*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca*
- 15 *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*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia*
- 20 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 piriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pirilla* spp., *Quadraspidotus*
- 25 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, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus
 5 vitifolii.

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

10 Del orden de los Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, Reticulitermes spp., Odontotermes spp.; así como Reticulitermes speratus y Coptotermes formosanus.

15

Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, 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
 20 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., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Malacosoma
 25 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, Pirausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatilis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp.; así como Lymantria dispar, Malacosoma neustria, Pieris rapae, Spodoptera litura, Mamestra brassicae, Chilo suppressalis, Pirausta nubilalis, Ephestia cautella, Adoxophyes orana, Carpocapsa pomonella, Agrotis fucosa, Galleria mellonella, Plutella maculipennis, Heliothis virescens y Phyllocnistis citrella.

10

Del orden de los Orthoptera, por ejemplo, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Schistocerca gregaria; así como Blattella germanica, Periplaneta americana, Gryllotalpa africana y Locusta migratoria migratoriaodes.

15

Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Xenopsylla cheopis.

Del orden de los Symphyla, por ejemplo, Scutigera immaculata.

20

Del orden de los Thysanoptera, por ejemplo, Baliothrips biformis, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamoni, Thrips spp.; así como Thrips palmi y Frankliniella occidentalis.

25

-70-

Del orden de los Hemiptera, por ejemplo, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicas*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Rhopalosiphum pseudobrassicas*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Trialeurodes vaporariorum* y *Psylla* spp;

5

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

Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus* 10 *dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.; así como *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus lignicolus*, *Mamiya* et *Kiyohara*, *Aphelenchoides besseyi*, y *Heterodera glycines* y 15 *Pratylenchus* spp.

Los ácaros incluyen, por ejemplo, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi* y *Tarsonemus* spp. o ácaros, tales como *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp., *Boophilus* spp. y similares.

20

En la presente invención, las sustancias que tienen efectos insecticidas contra animales dañinos que comprenden todas estas plagas se denominan insecticidas.

25

Si es apropiado, los compuestos de acuerdo con la invención pueden, a ciertas concentraciones o tasas de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores de cultivo, reguladores de crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos de tipo *Mycoplasma*) y RLO (organismos de tipo *Rickettsia*). Si es apropiado, también se pueden emplear como intermedios o precursores para la síntesis de otros compuestos activos.

10 En el campo veterinario, los compuestos novedosos de la invención se pueden usar de manera eficaz para diversos parásitos animales perjudiciales (endoparásitos y ectoparásitos), incluyendo insectos y gusanos.

Los ejemplos de tales parásitos animales pueden incluir los siguientes animales dañinos: insectos, tales como la mosca zumbadora (*Gastrophilus* spp.), mosca estable (*Stomoxys* spp.), piojo mordedor (*Trichodectes* spp.), *Rhodnius* (*Rhodnius* spp.), inu-nomi pulga del perro (*Ctenocephalides canis*), *clinocoris* (*Cimex lecturarius*), neko-nomi pulga del gato (*Ctenocephalides felis*), mosca azul de la carne (*Lucilia cuprina*) y similares.

20

Como ya se ha mencionado anteriormente, en el campo veterinario, es decir, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención son activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye en particular
25 helmintos, tales como cestodos, nematodos o trematodos, y protozoos, tales

como coccidios. Los ectoparásitos son típicamente y preferiblemente artrópodos, en particular insectos tales como moscas (hirientes y lamedores), larvas de moscas parásitos, piojo, piojo del pelo, piojo de los pájaros, pulgas y similares; o acáridos, tales como garrapatas, por ejemplos garrapatas duras o

5 garrapatas blandas, o ácaros, tales como ácaros de la roña, ácaros de la cosecha, ácaros de los pájaros y similares.

Estos parásitos incluyen:

- 10 Del orden de los Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; ejemplos particulares son: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurytenuis*, *Haematopinus suis*, *Pediculus*
- 15 *humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*.

- Del orden de los Mallophagida y los subórdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp.,
- 20 *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; ejemplos particulares son: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*.

- 25 Del orden de los Diptera y los subórdenes Nematocerina y Brachyocerina, por



2020
Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	09 112449
	Solicitud internacional	PCT/EP2008/003105
	Fecha inicio fase nacional	23/11/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	11263
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

22 SET. 2010

ALEX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

jfernand

PATENTE

DE

INVENCIÓN

09-112449

2/2

- ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp.,
- 5 *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., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; ejemplos particulares son: *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*,
- 10 *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia ornata*, *Wilhelmia equina*, *Boophthora*
- 15 *erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitra ciurea*, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Haematobia irritans irritans*, *Haematobia irritans exigua*, *Haematobia stimulans*, *Hydrotaea irritans*, *Hydrotaea albipuncta*, *Chrysomya*
- 20 *cloropyga*, *Chrysomya bezziana*, *Oestrus ovis*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Przhevalskiana silenus*, *Dermatobia hominis*, *Melophagus ovinus*, *Lipoptena capreoli*, *Lipoptena cervi*, *Hippobosca variegata*, *Hippobosca equina*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorroidalis*, *Gasterophilus inermis*, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricornis*, *Gasterophilus pecorum*,
- 25 *Braula coeca*.

Del orden de los Siphonapterida, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.; ejemplos particulares son: *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga*
5 *penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

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

10 Del orden de los Blattarida, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp. (por ejemplo, *Suppella longipalpa*).

De la subclase de los ácaros (Acarina) y los órdenes Meta- y Mesostigmata, por ejemplo *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp.,
15 *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp. *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de multi garrapatas del huésped) *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; los ejemplos particulares son: *Argas persicus*,
20 *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes*
25 *canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes*

- holocyclus, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*, *Haemaphysalis cinnabarina*, *Haemaphysalis otophila*, *Haemaphysalis leachi*, *Haemaphysalis longicorni*, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor albipictus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*,
 5 *Hyalomma mauritanicum*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma cajennense*, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus*
 10 *sylviarum*, *Varroa jacobsoni*.

- Del orden de los Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus*
 15 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 ejemplos particulares son: *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*, *Demodex caprae*, *Demodex equi*, *Demodex*
 20 *caballi*, *Demodex suis*, *Neotrombicula autumnalis*, *Neotrombicula desaleri*, *Neoschöngastia xerothermobia*, *Trombicula akamushi*, *Otodectes cynotis*, *Notoedres cati*, *Sarcoptes canis*, *Sarcoptes bovis*, *Sarcoptes ovis*, *Sarcoptes rupicaprae* (=S. caprae), *Sarcoptes equi*, *Sarcoptes suis*, *Psoroptes ovis*, *Psoroptes cuniculi*, *Psoroptes equi*, *Chorioptes bovis*, *Psoergates ovis*,
 25 *Pneumonyssoides Mange*, *Pneumonyssoides caninum*, *Acarapis woodi*.

Los compuestos activos de acuerdo con la invención son también adecuados para tratar artrópodos, helmintos y protozoos, que atacan animales. Se prefiere el control de artrópodos. El control de insectos es particularmente preferido.

5 Igualmente, el control of ácaros es particularmente preferido.

Los animales que se pueden tratar para controlar los parásitos incluyen pájaros, insectos y en particular mamíferos. Los animales incluyen ganado agrícola tal como, por ejemplo, ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos,
10 cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, animales de peletería, pavos, patos, gansos, peces de cultivo, abejas de miel. Además, los animales incluyen animales domésticos - también denominados animales de compañía - tales como, por ejemplo, perros, gatos, hurones, pájaros enjaulados, peces de acuario, reptiles y los que se conocen como animales experimentales, tales
15 como, por ejemplo, hámsters, cobayas, ratas y ratones.

Mediante el control de estos artrópodos, helmintos y / o protozoos, se pretende que se reduzcan las muertes y la mejora del comportamiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares) y la salud del animal
20 huésped, de manera que sea posible el mantenimiento del animal más económico y más simple mediante el uso de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

Por ejemplo, es deseable prevenir o interrumpir la absorción de sangre por
25 parte de los parásitos a partir de los huéspedes (cuando es aplicable).

También, el control de los parásitos puede ayudar a prevenir la transmitancia de agentes infecciosos.

El término "control" como se usa en el presente documento con relación al
5 campo veterinario, significa que los compuestos activos son eficaces en la
reducción de la incidencia del parásito respectivo en un animal infectado con
tales parásitos hasta niveles inocuos. Más específicamente, "control", como se
usa en el presente documento, significa que el compuesto activo es eficaz en la
eliminación del parásito respectivo, inhibiendo su crecimiento, o inhibiendo su
10 proliferación.

Los compuestos activos de la presente invención, cuando se usan como
insecticidas, se puede formar en formas de formulación convencionales. Tales
formas de formulación incluyen, por ejemplo, soluciones, emulsiones, polvos
15 humectables, gránulos dispersables en agua, suspensiones, polvos, espumas,
pastas, comprimidos, gránulos, aerosoles, sustancias naturales y sintéticas
impregnadas en compuesto activo, microcápsulas, agentes que recubren
semillas, las formulaciones usadas con dispositivos de combustión (los
dispositivos de combustión incluyen, por ejemplo, fumigación y cartuchos de
20 humo, latas y serpentinas) y UVL [niebla fría, niebla caliente].

Los compuestos activos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención pueden
estar presentes en formulaciones comercialmente útiles y formas de uso
preparadas a partir de sus formulaciones, como una forma de formulación
25 mixta con otros compuestos activos tales como insecticidas, cebos tóxicos,

bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, agentes reguladores de crecimiento, herbicidas y similares. Los insecticidas mencionados anteriormente pueden incluir, por ejemplo, agentes organofosforados, agentes carbamato, agentes químicos carboxilato, agentes químicos de tipo
5 clorohidrocarburo, sustancias insecticidas producidas por microorganismos y similares.

Estas formulaciones se pueden preparar mediante el procedimiento conocido *per se*. Por ejemplo, se pueden preparar mediante mezclado de los
10 compuestos activos conjuntamente con agentes de propagación, es decir, diluyentes o vehículos líquidos; diluyentes o vehículos de gas licuado; diluyentes o vehículos sólidos, y de manera opcional, tensioactivos es decir, emulsionantes y / o dispersantes y / o agentes espumantes.

15 Cuando se usa agua como agente de propagación, por ejemplo se pueden usar disolventes orgánicos como un disolvente auxiliar.

Los diluyentes o vehículos líquidos pueden incluir, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno, alquilnaftaleno etc.), hidrocarburos
20 aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobencenos, cloruros de etileno, cloruros de metileno etc.), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, ciclohexanos o parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral)), alcoholes (por ejemplo, butanol, glicol y éteres o ésteres de los mismos, etc.), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona, metilisobuticetona, ciclohexanona etc.),
25 disolventes polares fuertes (por ejemplo, dimetilformamida, dimetilsulfóxido

etc.), agua y similares.

Los diluyentes o vehículos de gas licuado pueden incluir sustancias que existen como gas a temperatura ambiente y presión normal, por ejemplo propulsores
5 de aerosol tales como furano, propano, gas nitrógeno, dióxido de carbono, hidrocarburos halogenados.

Los diluyentes sólidos pueden incluir, por ejemplo, minerales naturales troceados (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, yeso, cuarzo, atapulgita,
10 montmorillonita o tierra de diatomeas etc.), minerales sintéticos troceados (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersable, alúmina, silicato etc.) y similares.

Los vehículos sólidos para gránulos pueden incluir, por ejemplo, rocas troceadas y fraccionadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita,
15 dolomita etc.), gránulos sintéticos de polvos inorgánicos u orgánicos, partículas finas de materiales orgánicos (por ejemplo, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, tallo de mala hierba de India etc.).

Los emulsionantes y / o espumas pueden incluir, por ejemplo, emulsionantes
20 no iónicos o aniónicos (por ejemplo, ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno (por ejemplo, alquilarilpoliglicol éter), sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo etc.), productos hidrolizados de albúmina y similares.

Los ejemplos de dispersantes incluyen, por ejemplo, aguas de desecho de sulfito de lignina, metilcelulosa y similares.

También se pueden usar agentes adhesivos para las formulaciones (polvos,
5 gránulos, emulsiones), tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales o sintéticos (por ejemplo, goma arábiga, poli(alcoholes vinílicos), polilacetatos vinílicos, etc.) y similares.

Se pueden usar colorantes, tales como pigmentos inorgánicos (por ejemplo,
10 óxido férrico, óxido titánico, azul de Prusia etc.), pigmentos orgánicos (por ejemplo, tintes de alizarina, tintes azo o tintes metaloftalocianina etc.) así como oligoelementos (por ejemplo sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc etc).

En general tales formulaciones pueden contener los compuestos activos
15 descritos anteriormente en un intervalo entre 0,1 y 95 % en peso, preferiblemente entre 0,5 y 90% en peso.

Los compuestos de acuerdo con la presente invención se pueden usar de manera ordinaria adecuada para sus formas de aplicación. Se entiende que los
20 compuestos de acuerdo con la invención también pueden estar presentes en composiciones que contienen ingredientes adicionales, tales como ingredientes auxiliares o activos. Los expertos en la técnica elegirán un ingrediente adecuado entre los mencionados en el presente documento y conocidos en la técnica y que se supone que potencian una propiedad que se considera que es
25 favorable en vista de la aplicación propuesta y uso.

Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Las plantas ha de entenderse que significa en el presente contexto todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres o
5 plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural) deseadas y no deseadas. Las plantas de cultivo son plantas que se pueden obtener por procedimientos de cultivo y optimización de plantas convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante las combinaciones de estos procedimientos, que incluyen las plantas transgénicas
10 y que incluyen las variedades de cultivo que se pueden proteger o no proteger por los derechos de los criadores de plantas. Las partes de las plantas se ha de entender que significan todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo, tal como brote, hoja, flor y raíz, los ejemplos que se pueden mencionar son hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de los
15 frutos, frutos, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas incluyen también material cosechado, y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, brotes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de
20 plantas con los compuestos activos se lleva a cabo directamente o permitiendo a los compuestos actuar en los alrededores, el hábitat o el espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo mediante inmersión, pulverización, evaporación, formación de niebla, dispersión, pintado sobre, inyección y, en el caso de material de propagación,
25 en particular en el caso de semillas, también aplicando uno o más

revestimientos.

Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan las especies de plantas silvestres y variedades de cultivo de las plantas, o las obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencionales, tales como cruzamiento o fusión protoplástica, y partes de las mismas. En una realización adicional preferida, se tratan plantas transgénicas y variedades de cultivo de las plantas obtenidas mediante procedimientos de ingeniería genética, si es apropiado en combinación con procedimientos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente), y sus partes. Los términos "partes", "partes de plantas" y "partes de plantas" se han explicado anteriormente.

Particularmente preferiblemente, plantas de las variedades de cultivo de las plantas que en cada caso están comercialmente disponibles o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Las variedades de cultivo de las plantas se han de entender como que significan las plantas que tienen propiedades novedosas ("rasgos") que se han obtenido mediante reproducción convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades de cultivo, bio- o genotipos.

Dependiendo de las especies de plantas o variedades de cultivo de plantas, su localización y condiciones de crecimiento (suelos, clima, período de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede

dar como resultado efectos superaditivos ("sinérgicos"). De este modo, por ejemplo, son posibles tasas de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un incremento en la actividad de los compuestos activos y composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención,

5 mejor desarrollo de plantas, incremento de la tolerancia a temperaturas altas o bajas, incremento de la tolerancia a la sequía o al contenido de agua o sal en suelo, rendimiento de la floración incrementado, recolección más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cosecha más altos, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor estabilidad

10 durante almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados, que superan los efectos que realmente se esperaban.

Las plantas transgénicas o variedades de cultivo de plantas (obtenidas mediante ingeniería genética) preferidas que se han de tratar de acuerdo con la

15 invención incluyen todas las plantas que, en virtud de la modificación genética, recibieron material genético que impartía rasgos particularmente ventajosos, útiles a estas plantas. Los ejemplos de tales rasgos son mejor crecimiento de plantas, incremento de tolerancia a temperaturas altas o bajas, incremento de tolerancia a la sequía o al contenido de agua o sal en el suelo, rendimiento de

20 la floración incrementado, recolección más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cosecha más altos, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor estabilidad durante almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente enfatizados de tales

25 rasgos son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y

microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatogénicos, bacterias y/o virus, y también tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos activos desde el punto de vista herbicida. Los ejemplos de plantas transgénicas que se pueden mencionar son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, semillas de soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza oleaginosa y también plantas frutales (con los frutos de manzana, peras, frutos cítricos y uvas), y se proporciona énfasis particular a maíz, semilla de soja, patatas, algodón, tabaco y semilla de colza oleaginosa.

Los rasgos que se enfatizan son en particular defensa incrementada de las plantas contra los insectos, arácnidos, nemátodos y babosas y caracoles en virtud de las toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también sus combinaciones) (denominadas de aquí en adelante como "plantas Bt"). Los rasgos que también se enfatizan de manera particular son el incremento en defensa de las plantas contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, facilitadores y genes de resistencia y las proteínas y toxinas que se expresan de manera correspondiente. Los rasgos que además se enfatizan de manera particular son la tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos activos desde el punto de vista herbicida, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que imparten los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinación unos con otros en las plantas

transgénicas. Los ejemplos de las "plantas Bt" que se pueden mencionar son las variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de semilla de soja y variedades de patata que se venden con los nombres comerciales YIELD GARD ® (por ejemplo maíz, algodón, semilla de soja), KnockOut ® (por ejemplo maíz), StarLink ® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn ® (algodón) y NewLeaf ® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas que se pueden mencionar son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de semilla de soja que se venden con los nombres comerciales Roundup Ready ® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, semilla de soja), Liberty Link ® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo semilla de colza oleaginosa), IMI ® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Plantas resistentes a herbicida (plantas cultivadas de una manera convencional para tolerancia a herbicida) que se pueden mencionar incluyen las variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). De hecho, estas afirmaciones también se aplican a variedades de cultivo de plantas que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos todavía a desarrollar, variedades de cultivo de plantas que se desarrollarán y/o se comercializarán en el futuro.

Las plantas enumeradas se pueden tratar de acuerdo con la invención de una manera particularmente ventajosa con los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos establecidos anteriormente para los compuestos activos o composiciones también se aplican para el tratamiento de estas plantas. Se proporciona énfasis particular para el tratamiento de plantas con los compuestos o composiciones mencionados de

manera específica en el presente texto.

Además se ha encontrado que los compuestos de acuerdo con la invención también tienen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen
5 materiales industriales.

Los siguientes insectos se pueden mencionar como ejemplos y como preferidos - pero sin ninguna limitación:

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

Himenópteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

- 20 Termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

- 25 Tisanuros, tal como *Lepisma saccharina*.

Los materiales industriales en la presente relación se han de entender como que significan materiales no vivos, tales como, preferiblemente, plásticos, adhesivos, pegamentos, papeles y cartones, cuero, madera y productos de
5 madera procesados y composiciones de revestimiento.

Las composiciones listas para usar pueden, si es apropiado, comprender insecticidas adicionales y, si es apropiado, uno o más fungicidas.

10 Con respecto a los posibles aditivos adicionales, se puede hacer referencia a insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden emplear de la misma manera para proteger objetos que se ponen en contacto con el agua del
15 mar o agua salobre, tales como cascos de buques, tamices, redes, edificios, amarras, y sistemas de señalización, contra la suciedad.

Además, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinaciones con otros compuestos activos, se pueden emplear como
20 agentes contra la suciedad.

En la protección de los productos domésticos, de higiene y productos almacenados, los compuestos activos son también adecuados para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran
25 en espacios cerrados tales como, por ejemplo, domicilios, vestíbulos de fábrica,

oficinas, cabinas de los vehículos y similares. Se pueden emplear solos o en combinación con otros compuestos activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para controlar estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todas las fases de desarrollo. Estas
5 plagas incluyen:

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

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

Del orden de los Araneae, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.
15

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

Del orden de los Isopoda, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
20

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

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

25 Del orden de los Zygentoma, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma*

saccharina, *Lepismodes inquilinus*.

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

Del orden de los Saltatoria, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

10 Del orden de los Dermaptera, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

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

15

Del orden de los Coleoptera, 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 Diptera, 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*,

25 *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

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

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

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

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

- En el campo de los insecticidas domésticos, se puede usar y es especialmente preferible una combinación con otros compuestos activos
20 adecuados, tales como ésteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores de crecimiento o compuestos activos de otras clases conocidas de insecticidas.

- Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención, preferible en su forma de aplicación adecuada, se pueden usar en aerosoles, productos
25 de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizaciones por bomba y

atomizador, sistemas de nebulización automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de evaporador con comprimidos de evaporador hechos de celulosa o polímero, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores dirigidos por propulsor, sistemas de evaporación sin
5 energía, o pasivos, papeles contra polillas, bolsas contra polillas y geles contra polillas, como gránulos o polvo, en cebos para distribución o en localizaciones de cebo.

Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención son particularmente adecuados para tratar las semillas. Una gran parte del daño a
10 las plantas de cultivo que está provocado por las plagas se produce tan pronto como cuando la semilla es atacada durante el almacenamiento y después de que la semilla se introduce en el suelo, durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es particularmente crítica ya que las raíces y brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e
15 incluso un daño menor puede conducir a la muerte de la planta entera. La protección de la semilla y planta en germinación mediante el uso de las composiciones adecuadas es por lo tanto de interés particularmente grande.

El control de las plagas mediante tratamiento de las semillas de las plantas se
20 ha conocido desde hace mucho tiempo y es objeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de semillas supone una serie de problemas que no siempre se pueden solucionar de una manera satisfactoria. De este modo, es deseable desarrollar procedimientos para la protección de la semilla y la planta en germinación que prescindan de la aplicación adicional de agentes de
25 protección de cultivo después de la siembra o después del brote de las plantas.

Además es deseable optimizar la cantidad del compuesto activo empleada de tal forma que proporcione una protección máxima para la semilla y planta en germinación frente al ataque de plagas, pero sin dañar la propia planta por el compuesto activo empleado. En particular, los procedimientos para el

5 tratamiento de semilla deberían también tener en consideración las propiedades insecticidas intrínsecas de las plantas transgénicas con el fin de lograr una protección óptima de la semilla y también de la planta en germinación empleándose un mínimo de agentes de protección del cultivo.

10 Por lo tanto la presente invención en particular también se refiere a un procedimiento para la protección de la semilla y plantas en germinación frente al ataque de plagas, mediante tratamiento de la semilla con una composición de acuerdo con la invención. Del mismo modo la invención se refiere al uso de las composiciones de acuerdo con la invención para el tratamiento de semilla

15 para la protección de la semilla y de la planta resultante frente a las plagas. Además, la invención se refiere a una semilla que se ha tratado con una composición de acuerdo con la invención de manera que produzca protección frente a las plagas.

20 Una de las ventajas de la presente invención es que las propiedades sistémicas particulares de las composiciones de acuerdo con la invención significan que el tratamiento de la semilla con estas composiciones no solamente protege a la propia semilla, sino también a las plantas resultantes después del brote, frente a las plagas. De esta manera, se puede prescindir del

25 tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después

de la misma.

Además, se debe considerar como ventajoso que los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención también se pueden emplear en particular en semilla transgénica, siendo capaces las plantas que surgen de esta semilla de expresar una proteína dirigida contra plagas. Mediante el tratamiento de tal semilla con las composiciones de acuerdo con la invención, se pueden controlar ciertas plagas solamente mediante la expresión de, por ejemplo, la proteína insecticida, y adicionalmente protegerse mediante las composiciones de acuerdo con la invención contra el daño.

Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención son adecuados para proteger la semilla de cualquier variedad de planta como ya se ha mencionado anteriormente que se emplea en agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, esto toma la forma de semilla de maíz, cacahuete, canola, semilla de colza oleaginosa, amapola, semillas de soja, algodón, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), arroz, sorgo y mijo, trigo, cebada, avena, centeno, girasol, tabaco, patatas u hortalizas (por ejemplo tomates, plantas de col). Las composiciones de acuerdo con la invención son del mismo modo adecuadas para tratar la semilla de plantas frutales y hortalizas como ya se ha mencionado anteriormente. El tratamiento de la semilla de maíz, semillas de soja, algodón, trigo y canola o semilla de colza oleaginosa es de particular importancia.

Como ya se ha mencionado anteriormente, el tratamiento de la semilla

transgénica con una composición de acuerdo con la invención también es de particular importancia. Esto toma la forma de semilla de plantas que, como regla, comprenden al menos un gen heterólogo que gobierna la expresión de un polipéptido con propiedades en particular insecticidas. En este contexto, los

5 genes heterólogos en la semilla transgénica se pueden derivar de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semilla transgénica que comprende al menos un gen heterólogo que se origina a partir de *Bacillus* sp. y

10 cuyo producto génico muestra actividad contra el gusano barrenador de maíz Europeo y/o el gusano de la raíz de maíz. Es particularmente preferiblemente un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En el contexto de la presente invención, la composición de acuerdo con

15 la invención se aplica a la semilla bien sola o en una formulación adecuada. Preferiblemente, la semilla se trata en un estado que es suficientemente estable para evitar el daño durante el tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la recolección y la siembra. La semilla usualmente usada se ha separado de la planta y liberado de las mazorcas,

20 cáscaras, tallos, recubrimientos, pelos o la carne de los frutos.

Cuando se trata la semilla, se debe en general tener cuidado de que la cantidad de la composición de acuerdo con la invención aplicada a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se elija de tal manera que la germinación

25 de la semilla no esté afectada de manera adversa, o que la planta resultante no

se dañe. Esto se debe tener de manera particular en cuenta en el caso de los compuestos activos que puedan tener efectos fitotóxicos a ciertas tasas de aplicación.

- 5 Los compuestos activos de la presente invención, cuando se usan contra plagas higiénicas y plagas de grano almacenado, tienen una buena estabilidad frente a álcali sobre sustancias calcáreas y también muestran una excelente actividad residual en madera y suelo.
- 10 Además, los compuestos activos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención pueden estar presentes en forma de una formulación mixta con agentes sinérgicos y tales formulaciones y formas de uso pueden incluir las formulaciones y formas comercialmente útiles. Tales agente sinérgicos, que no son necesariamente activos per se, son compuestos que potencian la acción
- 15 de los compuestos activos.

En general, cuando se usan para el tratamiento de animales, los compuestos activos de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente. Preferiblemente se aplican como composiciones farmacéuticas que pueden

20 contener excipientes y / o auxiliares farmacéuticamente aceptables que se conocen en la técnica.

En el campo veterinario y en el mantenimiento de los animales, los compuestos activos se aplican (= administran) de una manera conocida

25 mediante la administración entérica en la forma de, por ejemplo, comprimidos,

cápsulas, bebidas, enjuagues, gránulos, pastas, inyecciones intravenosas rápidas, el proceso a través de la alimentación; supositorios; mediante administración parenteral, tales como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, 5 mediante la administración nasal, mediante aplicación dérmica en la forma de, por ejemplo, inmersión o baño, pulverización, vertido sobre y manchado, lavado, espolvoreado, y con la ayuda de artículos conformados que comprenden el compuesto activo tales como collares, marcas en la oreja, marcas en la cola, bandas en los miembros, ronzales, dispositivos de marcado 10 y similares. Los compuestos activos se pueden formular en forma de champú o en forma de formulaciones adecuadas que se pueden usar en aerosoles, pulverizaciones sin presión, por ejemplo pulverizaciones por bomba y pulverizaciones por atomizador.

15 Cuando se usan para el ganado vacuno, aves de corral, animales domésticos y similares, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención se pueden aplicar como formulaciones (por ejemplo polvos, polvos humectables ["WP"], emulsiones, concentrados emulsionables ["EC"], sustancias de flujo libre, soluciones homogéneas y concentrados de 20 suspensión ["SC"]), que comprenden los compuestos activos en una cantidad del 1 al 80% en peso, o bien directamente o después de dilución (por ejemplo de 100 a 10.000 veces), o si no como un baño químico.

Cuando se usan en el campo veterinario los compuestos activos de acuerdo 25 con la invención se pueden usar en combinación con agentes sinérgicos

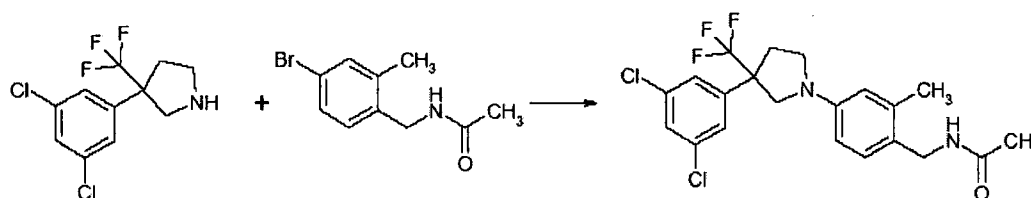
-97-

adecuados u otros compuestos activos, tales como por ejemplo, fármacos acaricidas, insecticidas, antihelmínticos, antiprotozoos.

La presente invención se ilustra más específicamente mediante los siguientes
5 ejemplos. Sin embargo la presente invención no se debe limitar solamente a estos ejemplos.

Ejemplo sintético 1

10 Síntesis de N-{4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-metilbencil}acetamida (No. 3-11)



Terc-butóxido de sodio (0,3 g), Tris (dibenciliden acetona)dipalladio (0) (aducto de cloroformo) (0,04 g) y Xantphos (0,07 g) se añadieron a la solución de 3-
15 (3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,59 g) y N-(4-bromo-2-metilbencil)acetamida (0,5 g) en tolueno en atmósfera de argón, y la mezcla se calentó con agitación a 80 °C durante 5 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se destiló el disolvente a
20 presión reducida, y después el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice produciendo N-{4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-metilbencil}acetamida (0,6 g).

^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,13 - 2,18 (6H, m), 2,51 - 2,53 (1H, m), 2,81 - 2,83 (1H, m), 3,45 - 3,56 (2H, m), 3,75 - 3,78 (1H, m), 4,01 - 4,04 (1H, m), 4,25 (1H, s), 4,57 (1H, s), 6,40 - 6,44 (2H, m), 6,93 - 6,96 (1H, m), 7,30 - 7,38 (3H, m)

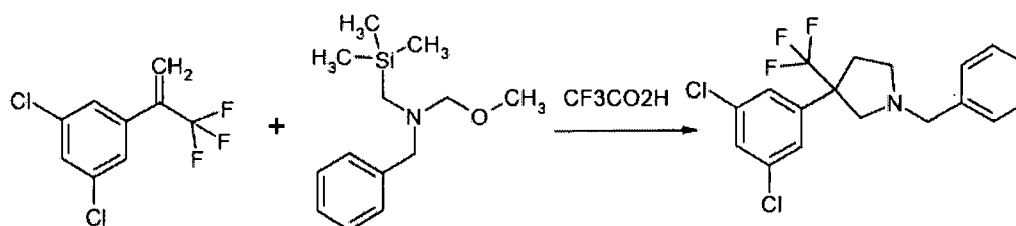
5

Ejemplo sintético 2

Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (No.1-16)

10 Ejemplo sintético 2-1

Síntesis de 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina (No.5-11)

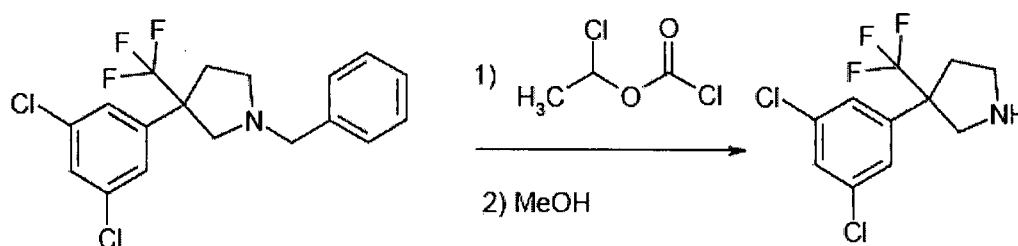


A la solución de 1,3-dicloro-5-[1-trifluorometil]vinil]benceno (6,1 g) y N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil) metil]metanamina (5,0 g) en diclorometano se añadió
 15 gota a gota la solución de ácido trifluoro acético (0,24 g) en diclorometano mientras se enfriaba con hielo. Tras la finalización de la adición gota a gota, la mezcla se calentó hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. La solución se concentró a presión reducida, y después el residuo se diluyó con t-butilmetiléter. La solución se lavó con solución acuosa saturada de bicarbonato
 20 de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de retirar por filtración el agente de secado, se destiló el disolvente a presión reducida, y después el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice

produciendo 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina (5,7 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,27 - 2,36 (1H, m), 2,53 - 2,62 (1H, m), 2,69 - 2,83 (2H, m), 3,08 (2H, dd), 3,67 (2H, s), 7,25 - 7,36 (8H, m)

5 Ejemplo sintético 2-2

Síntesis de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (No.5-12)

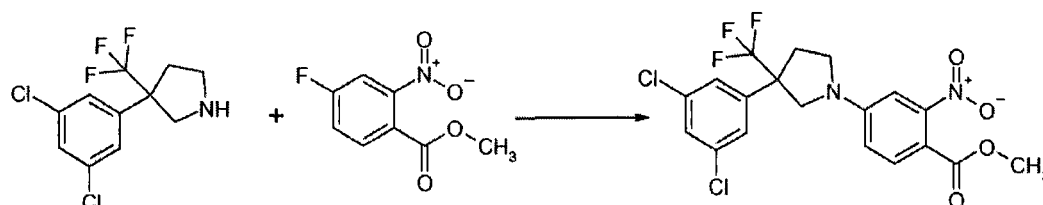


La solución de 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidina (5,7 g) y cloroformiato de 1-cloroetilo (4,4 g) en dicloroetano se calentó a reflujo durante 10 3 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se concentró a presión reducida. Se añadió metanol al residuo resultante, que después se calentó con agitación a 60°C durante dos horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, a la que se añadió después agua. La solución se lavó dos veces con el disolvente mixto de hexano y acetato de etilo 15 (9:1). Se hizo alcalina la solución con carbonato ácido de sodio y después se extrajo con acetato de etilo tres veces. Se combinaron las fases orgánicas que después se lavaron con salmuera y se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro. Después el agente de secado se retiró por filtración, y se destiló el disolvente a presión reducida produciendo 3-(3,5-diclorofenil)-3- 20 (trifluorometil)pirrolidina (4,2 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,24 - 2,33 (1H, m), 2,51 - 2,56 (1H, m), 2,97 - 3,07 (1H, m), 3,19 - 3,26 (2H, m), 3,74 (1H, d), 7,25 (2H, d),

7,35 (1H, t)

Ejemplo sintético 2-3

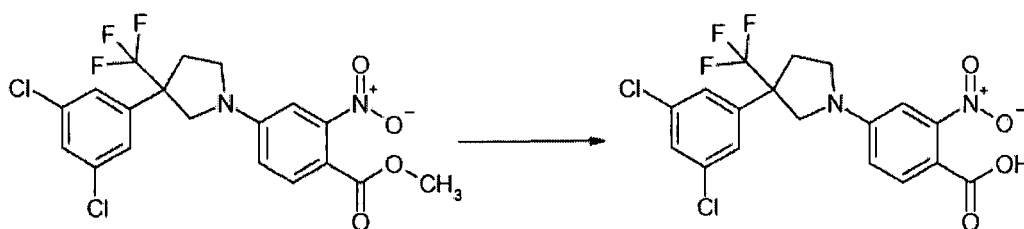
Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (nº 4-6)



A la solución de 4-fluoro-2-nitrobenzoato de metilo (1,1 g) y 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,5 g) en 1-metil-2-pirrolidinona se añadió carbonato de potasio (1,5 g) y la mezcla se calentó con agitación a 100°C durante dos horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y después el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (1,24 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,53 - 2,67 (1H, m), 2,89 - 2,97 (1H, m), 3,50 - 3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,26 (2H, d), 7,42 (1H, t), 7,81 (1H, d)

Ejemplo sintético 2-4

Síntesis de ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (No. 4-7)

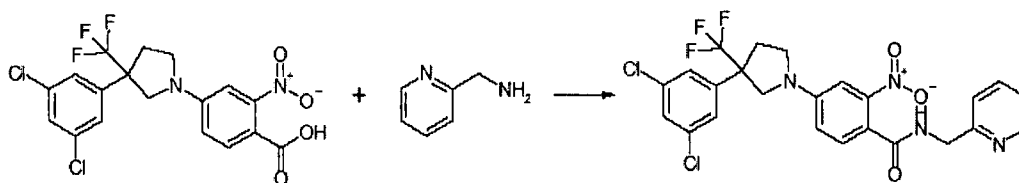


- 5 A la solución de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (1,24 g) en 1,4-dioxano se añadió hidróxido sódico acuoso 2 N (5,4 ml), y la mezcla se calentó con agitación a 80°C. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se acidificó con ácido clorhídrico 2 N antes de que la mezcla se extrajera dos veces con acetato de etilo. Se
- 10 combinaron las fases orgánicas que después se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a la presión reducida produciendo el ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (0,85 g). ¹H-RMN (DMSO-d₆): δ2,58 - 2,72 (1H, m), 2,91 - 3,04 (1H, m), 3,47 - 3,57 (2H, m),
- 15 3,87 (1H, d), 4,32 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,65 (2H, d), 7,71 (1H, t), 7,78 (1H, d)

Ejemplo sintético 2-5

- 20 Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (No.1-16)

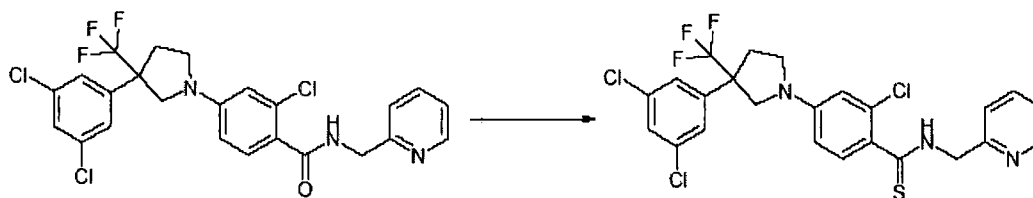
-102-



A la solución del ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (0,3 g) y 2-picolilamina (0,07 g) en DMF se añadió clorhidrato de 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (0,13 g) y monohidrato de 1-hidroxibenzotriazol (0,01 g), y la mezcla se agitó durante 6 horas a temperatura ambiente. La solución de reacción se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y después el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridina-2-ilmetil)benzamida (0,19 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,54 - 2,65 (1H, m), 2,89 - 2,97 (1H, m), 3,51 - 3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,15 - 7,23 (2H, m), 7,28 (2H, s a), 7,37 (1H, d), 7,41 (1H, t), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).

Ejemplo sintético 3

2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridin-2-ilmetil)bencenocarbotoamida (No.1-81)



A la solución de 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin1-il]-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (0,35 g) en tolueno se añadió reactivo de Lawesson (0,28 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. Después la mezcla se
 5 enfrió hasta temperatura ambiente, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin1-il]-N-(piridin-2-ilmetil) bencenocarbotoamida (0,10 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,51 - 2,61 (1H, m), 2,84 - 2,92 (1H, m), 3,45 - 3,61 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,08 (1H, d), 5,08 (2H, d), 6,49 -
 10 6,54 (2H, m), 7,22 - 7,28 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,72 (1H, td), 7,79 (1H, d), 8,54 (1H, d), 9,27 (1H, s a).

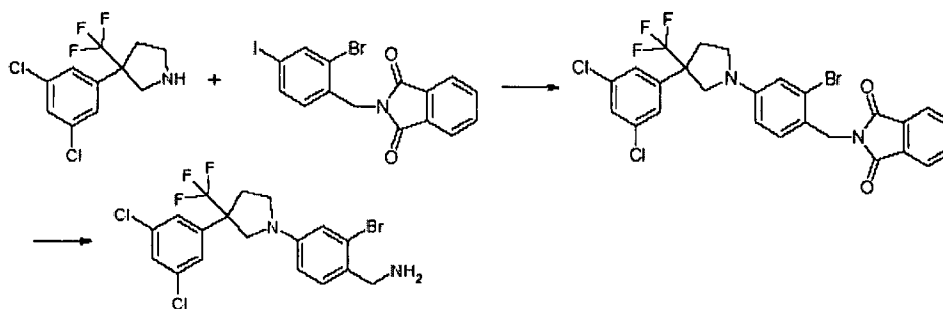
Ejemplo sintético 4

Síntesis de N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (No.3-3)
 15

Ejemplo sintético 4-1

Síntesis de 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (No.4-49)

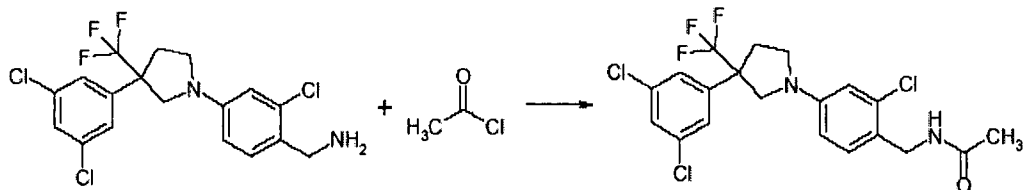
-104-



Terc-butóxido de sodio (0,2 g), Tris (dibenciliden acetona) dipaladio (0) (aducto de cloroformo) (0,03 g) y Xantphos (0,05 g) se añadió a la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,4 g) y 2-(2-cloro-4-yodobencil)- 1H-isoindol-1,3-(2H)-diona (0,69 g) en tolueno en atmósfera de argón, y la mezcla se calentó con agitación a 80°C durante 3 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se destiló el disolvente a presión reducida produciendo el producto bruto. El producto se disolvió en metanol, al que después se añadió hidrazina acuosa (0,03 g), después la mezcla se calentó a reflujo durante 12 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con solución salina saturada. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se destiló a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (0,12 g). ¹H-RMN (CDCl₃): δ 2,47 - 2,54 (1H, m), 2,78 - 2,85 (1H, m), 3,46 - 3,49 (2H, m), 3,69 - 4,01 (4H, m), 6,47 - 6,50 (1H, m), 6,73 - 6,76 (1H, m), 7,25 - 7,35 (4H, m).

20 Ejemplo sintético 4-2

Síntesis de N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (No.3-3)



A la solución de 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (0,12 g) y trietilamina (0,04 g) en tetrahidrofurano se añadió gota a gota cloruro de acetilo (0,02 g), y la mezcla se agitó durante una hora a temperatura ambiente. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil) -3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (0,1 g). ¹H-RMN (CDCl₃): δ 1,98 - 2,01 (3H, m), 2,50 - 2,58 (1H, m), 2,82 - 2,87 (1H, m), 3,45 - 3,51 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H, d), 4,41 (2H), 6,43 - 6,46 (1H, m), 6,58 - 6,59 (1H, m), 7,26 - 7,38 (4H, m)

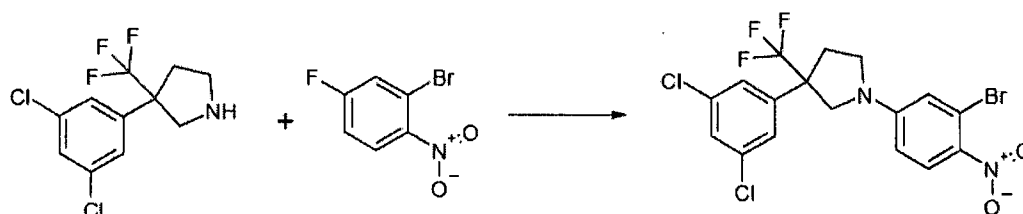
15

Ejemplo sintético 5

Síntesis de 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol (No.2-23)

20 Ejemplo sintético 5-1

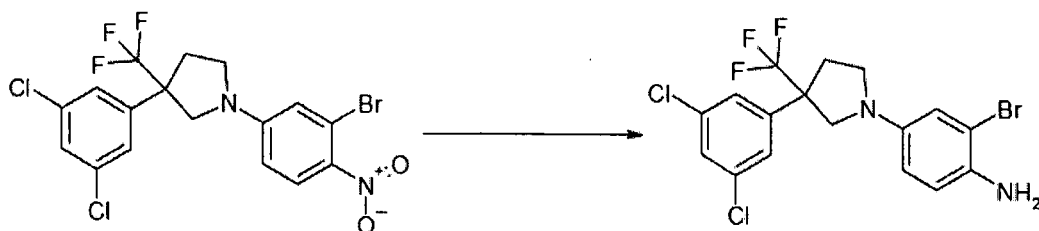
Síntesis de 1-(bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (No.4-20)



A la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,3 g) y 2-bromo-4-fluoro-1-nitrobenceno (1,0 g) en 1-metil-2-pirrolidinona se añadió carbonato de potasio (1,3 g), y la mezcla se calentó con agitación a 100°C durante 3 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en agua, que se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 1-(3-bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,56 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,53 - 2,66 (1H, m), 2,89 - 2,97 (1H, m), 3,51 - 3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,16 (1H, d), 6,53 (1H, dd), 6,84 (1H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,07 (1H, d).

15 Ejemplo sintético 5-2

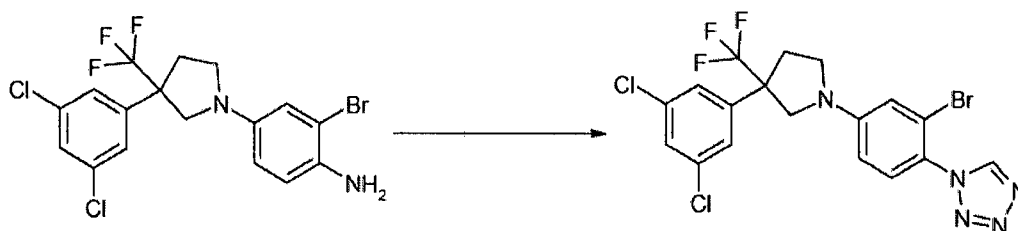
Síntesis de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (No.4-21)



A la solución de 1-(3-bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,10 g) en el disolvente mixto de 1,4-dioxano y etanol se añadió cloruro estannoso dihidrato (2,05 g) y una pequeña cantidad de ácido clorhídrico concentrado, y después la mezcla se agitó durante 4 horas a 90°C. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en la solución mixta de acetato de etilo y agua, que después se neutralizó con carbonato ácido de sodio con agitación vigorosa. Después de la filtración del precipitado a través de celita, se separó la fase orgánica y se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después el agente de secado se retiró por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y después el residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (0,73 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,44 - 2,54 (1H, m), 2,75 - 2,83 (1H, m), 3,32 - 3,50 (2H, m), 3,56 - 3,76 (3H, m), 3,92 (1H, d), 6,46 (1H, dd), 6,70 - 6,78 (2H, m), 7,29 (2H, s a), 7,37 (1H, t).

Ejemplo sintético 5-3

Síntesis de 1-[2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil]-1H-tetrazol (No.2-23)



A la mezcla de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (0,60 g), ortoformiato de trietilo (0,98 g) y azida de sodio (0,38 g) se
 5 añadió ácido acético (1,1 g), y la mezcla se calentó después con agitación a 100°C durante 4 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por
 10 filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol (0,52 g).
 p. de f. 193 - 194°C.

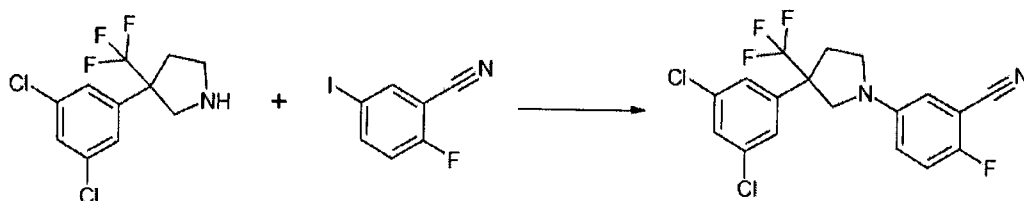
15 Ejemplo sintético 6

Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (No.2-39)

Ejemplo sintético 6-1

20 Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo (No.4-17)

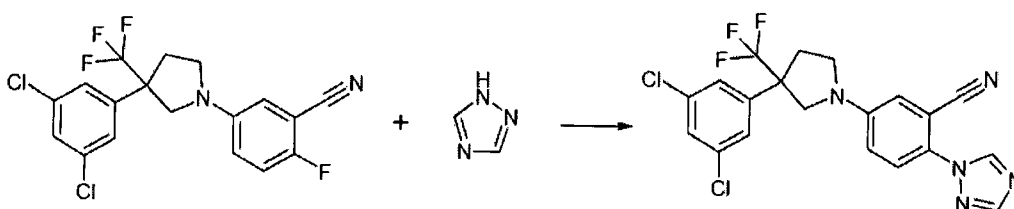
-109-



- 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,6 g) y 2-fluoro-5-yodobenzonitrilo (0,57 g) se disolvió en tolueno, que después se desgasificó 3 veces. A la solución en tolueno se añadió terc-butóxido de sodio (0,20 g),
- 5 complejo Tris (dibenciliden acetona)dipaladio cloroformo (0,04 g) y Xantphos (0,07 g) en atmósfera de argón, y la mezcla se agitó a 80°C durante dos horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se diluyó con acetato de etilo, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después el agente de secado se retiró por filtración, se
- 10 destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo (0,54 g). p. de f. 184 - 186°C.

Ejemplo sintético 6-2

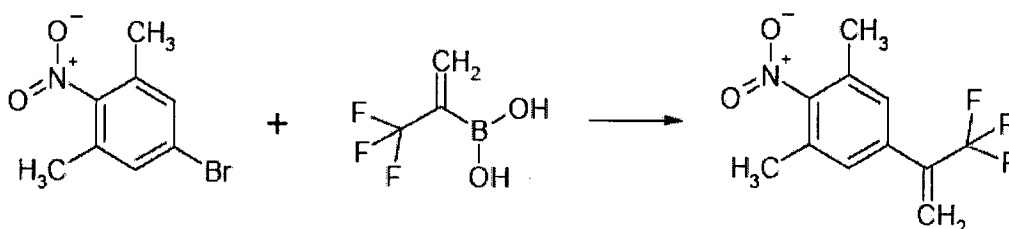
- 15 Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (No.2-39)



A la solución de 1H-1,2,4-triazol (0,06 g) en DMF se añadió hidruro de sodio (0,04 g) mientras se enfriaba con hielo, y la mezcla se calentó hasta temperatura ambiente y después se agitó durante 0,5 horas. A esta solución se añadió la solución de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin -1-il] 2-fluorobenzonitrilo (0,30 g) en DMF, y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (0,18 g). ¹H-RMN (DMSO-d₆): δ 2,62 - 2,73 (1H, m), 2,95 - 3,03 (1H, m), 3,49 - 3,55 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,31 (1H, d), 7,09 (1H, dd), 7,29 (1H, d), 7,61 (1H, d), 7,68 (2H, d), 7,71 (1H, t), 8,26 (1H, s), 8,98 (1H, s)

Ejemplo sintético 7

Síntesis de 1,3-dimetil-2-nitro-5-[1-(trifluorometil) vinil] benceno (No.6-1)



20

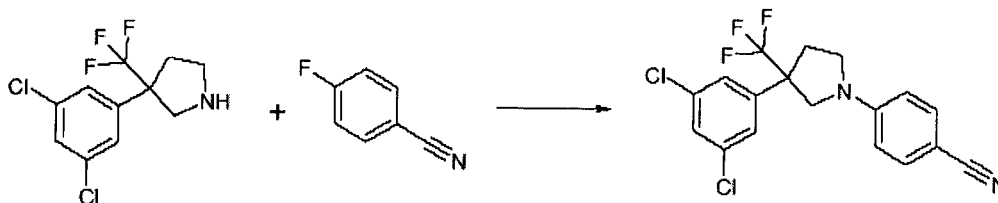
5-bromo-1,3-dimetil-2-nitrobenceno (10,0 g), ácido [1-(trifluorometil) vinil] bórico (pureza: 60%, 13,4 g) y carbonato de potasio (14,4 g) se disolvió en el

-111-

disolvente mixto de THF y agua, que después se desgasificó tres veces. A la solución se añadió dicloro bis(trifenilfosfina) paladio (II) (1,5 g), y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas en atmósfera de argón. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se
 5 extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 1,3-dimetil-2-nitro-5-[1-(trifluorometil) vinil] benceno
 10 (11,2 g). $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3): δ 2,34 (6H, s), 5,78 - 5,80 (1H, m), 6,03 - 6,04 (1H, m), 7,20 (2H, s).

Ejemplo sintético 8

Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]benzonitrilo
 15 (No.4-2)



A la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina (0,30 g) y 4-fluorobenzonitrilo (0,12 g) en DMSO (dimetilsulfóxido) se añadió carbonato de potasio (0,27 g), y la mezcla se calentó con agitación a 120°C durante 6 horas.
 20 La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y después se vertió sobre agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. Se combinó la

-112-

fase orgánica, que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después se retiró el agente de secado por filtración, se destiló el disolvente a presión reducida, y el residuo se purificó después mediante cromatografía en gel de sílice produciendo 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-

5 (trifluorometil) pirrolidin-1-il] benzonitrilo (0,05 g). ^1H -RMN (CDCl_3): δ 2,51 - 2,62 (1H, m), 2,86 - 2,94 (1H, m), 3,56 - 3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,59 (2H, d), 7,26 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 7,52 (2H, d).

Los compuestos e intermedios de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención

10 obtenidos mediante los mismos procedimientos son los de los ejemplos de síntesis anteriores y de acuerdo con los procedimientos descritos en detalle anteriormente, así como sus valores físicos se muestran en cada tabla correspondiente 1-13. Cada compuesto obtenido en los ejemplos de síntesis anteriores también se muestra en cada tabla correspondiente.

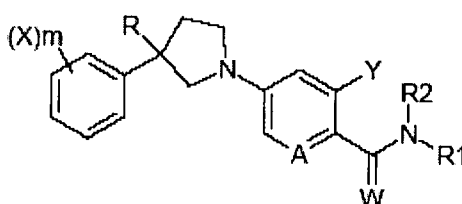
15

En estas tablas, se usan las siguientes abreviaturas.

Me: metilo, Et: etilo, Pr: propilo, Bu :butilo, Ph: fenilo, Pen: pentilo.

20

Tabla 1



	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p. de f. □°C□
1-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-2	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	CH	O	
1-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	CH	O	
1-6	3,5-diCl	CF3	F	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	CH	O	
1-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	CH	O	
1-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-11	3,5-diCl	CF3	Br	Ciclo-Pr	H	CH	O	
1-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	CH	O	
1-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	CH	O	
1-14	3,5-diCl	CF3	I	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-17	3-Cl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-19	3-Br	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-20	3-CF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	169 - 170
1-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-24	3-NO2	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	176 - 179
1-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-29	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-piridilCH2	H	CH	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p. de f. □°C□
1-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-42	3-CH3	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-43	3-CH3O	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-44	3-CN	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-45	3-CF3O	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-46	3-CH3S	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-49	3-CF3S	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-50	3-CF3S(O)	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-51	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-52	3-OH	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-53	3-SH	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-54	3,4-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-55	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	77 - 80
1-56	3,4,5-triCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-57	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-58	3,5-diBr	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-59	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-62	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	CH	S	
1-63	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	CH	O	
1-64	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	CH	O	
1-65	3,5-diCl	CF3	NO2	Iso-Pr	H	CH	O	
1-66	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	CH	O	
1-67	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	CH	O	
1-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	CH	O	

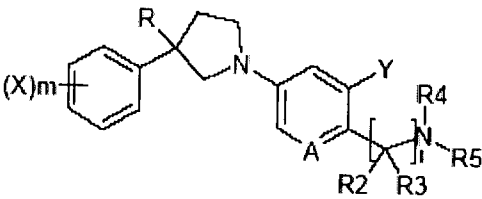
	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p. de f. [°C]
1-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(ciclo)Pr	H	CH	O	
1-70	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2Me	H	CH	O	
1-71	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2CF3	H	CH	O	
1-72	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	CH	O	
1-73	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	CH	O	
1-74	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	CH	O	
1-75	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	CH	O	
1-76	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	CH	O	
1-77	3,5-diCl	CH3	H	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-78	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	N	O	
1-79	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	CH3	CH	O	
1-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-piridilCH2	H	CH	S	
1-82	2-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-piridilCH2	H	CH	O	
1-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-piridilCH2	H	CH	O	
1-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl- piridil)CH2	H	CH	O	
1-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl- piridil)CH2	H	CH	O	
1-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-piridinilCH2	H	CH	O	
1-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-etilpirrolidin-2-il)CH2	H	CH	O	
1-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6--Cl- piridil)CH2	H	CH	O	
1-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		CH	O	
1-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	CH	O	
1-94	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-95	4-Cl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	CH	O	
1-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	CH	O	
1-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-piridilCH2	H	CH	O	
1-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-101	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	N	O	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p. de f. (°C)
2-1	3,5-diCl	CF3	H	G1	H	CH	
2-2	3,5-diCl	CF3	H	G2	H	CH	
2-3	3,5-diCl	CF3	H	G3	H	CH	
2-4	3,5-diCl	CF3	H	G4	H	CH	
2-5	3,5-diCl	CF3	H	G5	H	CH	
2-6	3,5-diCl	CF3	H	G6	H	CH	
2-7	3,5-diCl	CF3	H	G7	H	CH	
2-8	3,5-diCl	CF3	H	G8	H	CH	
2-9	3,5-diCl	CF3	H	G9	H	CH	
2-10	3,5-diCl	CF3	F	G6	H	CH	
2-11	3,5-diCl	CF3	F	G8	H	CH	
2-12	3,5-diCl	CF3	F	G9	H	CH	
2-13	3,5-diCl	CF3	Cl	G6	H	CH	
2-14	3,5-diCl	CF3	Cl	G8	H	CH	
2-15	3,5-diCl	CF3	Cl	G9	H	CH	
2-16	3,5-diCl	CF3	Br	G1	H	CH	
2-17	3,5-diCl	CF3	Br	G2	H	CH	
2-18	3,5-diCl	CF3	Br	G3	H	CH	
2-19	3,5-diCl	CF3	Br	G4	H	CH	
2-20	3,5-diCl	CF3	Br	G5	H	CH	
2-21	3,5-diCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-22	3,5-diCl	CF3	Br	G7	H	CH	
2-23	3,5-diCl	CF3	Br	G8	H	CH	193-194
2-24	3,5-diCl	CF3	Br	G9	H	CH	
2-25	3,5-diCl	CF3	I	G6	H	CH	
2-26	3,5-diCl	CF3	I	G8	H	CH	
2-27	3,5-diCl	CF3	I	G9	H	CH	
2-28	3,5-diCl	CF3	Me	G6	H	CH	
2-29	3,5-diCl	CF3	Me	G8	H	CH	
2-30	3,5-diCl	CF3	CF3	G6	H	CH	
2-31	3,5-diCl	CF3	CF3	G8	H	CH	
2-32	3,5-diCl	CF3	NO2	G6	H	CH	
2-33	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-34	3,5-diCl	CF3	CN	G1	H	CH	
2-35	3,5-diCl	CF3	CN	G2	H	CH	
2-36	3,5-diCl	CF3	CN	G3	H	CH	
2-37	3,5-diCl	CF3	CN	G4	H	CH	
2-38	3,5-diCl	CF3	CN	G5	H	CH	
2-39	3,5-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-40	3,5-diCl	CF3	CN	G7	H	CH	
2-41	3,5-diCl	CF3	CN	G8	H	CH	192-193
2-42	3,5-diCl	CF3	CN	G9	H	CH	
2-43	3,5-diCl	CF3	NO2	G6	H	CH	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p. def. (PC)
2-44	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-45	3,5-diCl	CF3	CH3	G6	H	CH	
2-46	3,5-diCl	CF3	MeS	G6	H	CH	
2-47	3,5-diCl	CF3	MeSO	G6	H	CH	
2-48	3,5-diCl	CF3	MeSO2	G6	H	CH	
2-49	3,5-diCl	CF3	CF3S	G6	H	CH	
2-50	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	G6	H	CH	
2-51	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	G6	H	CH	
2-52	3,5-diCl	CF3	OCH3	G6	H	CH	
2-53	3,5-diCl	CF3	OCF3	G6	H	CH	
2-54	3,5-diCl	CF3	OH	G6	H	CH	
2-55	3,5-diCl	CF3	SH	G6	H	CH	
2-56	3,5-diCl	CF3	NH2	G6	H	CH	
2-57	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	G6	H	CH	
2-58	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	G6	H	CH	
2-59	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	G6	H	CH	
2-60	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-NO2	CH	
2-61	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-CN	CH	
2-62	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-NO2	CH	
2-63	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-CN	CH	
2-64	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Cl	CH	
2-65	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Br	CH	
2-66	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CH3	CH	
2-67	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CF3	CH	
2-68	3-Cl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-69	3-Cl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-70	3-CF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-71	3-CF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-72	3,5-diCF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-73	3,5-diCF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-74	3-NO2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-75	3-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-76	3,4-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-77	3,4-diCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-78	3,5-diBr	CF3	CN	G6	H	CH	
2-79	3,5-diBr	CF3	CN	G8	H	CH	
2-80	3,5-diBr	CF3	Br	G6	H	CH	
2-81	3,5-diBr	CF3	Br	G8	H	CH	
2-82	3,4,5-triCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-83	3,4,5-triCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-84	3,4,5-triCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-85	3,4,5-triCl	CF3	Br	G8	H	CH	
2-86	3,5-diMe-4-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-87	3-CH3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-88	3-CH3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-89	3-CN	CF3	CN	G6	H	CH	
2-90	3-CF3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-91	3-CF3O	CF3	CN	G8	H	CH	
2-92	3-CH3S	CF3	CN	G6	H	CH	
2-93	3-CH3S	CF3	CN	G8	H	CH	
2-94	3-CH3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-95	3-CH3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-96	3-CF3S	CF3	CN	G6	H	CH	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p. de f.(°C.)
2-97	3-CF3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-98	3-CF3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-99	3-OH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-100	3-SH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-101	3,5-diCl	CH3	Br	G6	H	CH	
2-102	3,5-diCl	CH3	Br	G8	H	CH	
2-103	3,5-diCl	CF3	Br	G6	H	N	
2-104	3,5-diCl	CF3	Br	G8	H	N	
2-105	3,5-diCl	CF3	CN	G6	H	N	
2-106	3,5-diCl	CF3	CN	G8	H	N	
2-107	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G6	H	CH	
2-108	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G8	H	CH	
2-109	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G6	H	CH	
2-110	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G8	H	CH	
2-111	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G6	H	CH	
2-112	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G8	H	CH	

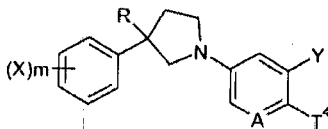
Tabla 3



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	I	p. de f.(°C)
3-1	3,5-dCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-2	3,5-dCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-3	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-4	3,5-dCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-5	3,5-dCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-6	3,5-dCl	CF3	Br	H	H	H	COi-Pr	CH	1	
3-7	3,5-dCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-piridil	CH	1	
3-8	3,5-dCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-9	3,5-dCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-10	3,5-dCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-11	3,5-dCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-12	3,5-dCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-13	3,5-dCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-14	3,5-dCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-15	3,5-dCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-16	3,5-dCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-17	3,5-dCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-18	3,5-dCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-19	3,5-dCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-20	3,5-dCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-21	3,5-dCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-22	3,5-dCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-23	3,5-dCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-24	3,5-dCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-25	3,5-dCl	CF3	NHCO2CH2COCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-26	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2piridil	CH	1	
3-27	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-28	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	CH	1	
3-29	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	vinil	COCH3	CH	1	
3-30	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	propargil	COCH3	CH	1	
3-31	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	CH	1	
3-32	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	CH	1	
3-33	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	CH	1	
3-34	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	CH	1	
3-35	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	CH	1	
3-36	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-37	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	CH	1	
3-38	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	CH	1	
3-39	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2- piridil	CH	1	
3-40	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-41	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-42	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	CH	1	
3-43	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-44	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	2-piridilCO	COCH3	CH	1	
3-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-48	3,5-dCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-52	3,5-dCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	N	1	
3-53	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-54	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-55	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-56	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-57	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-58	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-59	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-60	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-61	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-62	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	I	p. de f(°C)
3-63	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-64	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-65	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	CH	1	
3-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-67	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	CH	1	
3-68	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	CH	1	
3-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	CH	1	
3-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-73	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	CH	1	
3-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	CH	1	
3-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	CH	1	
3-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	CH	1	
3-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	CH	1	
3-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	CH	1	
3-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	CH	1	
3-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPYridi 1-2	CH	1	
3-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPYridi 1-3	CH	1	
3-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPYridi 1-4	CH	1	
3-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	CH	1	
3-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	CH	1	
3-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	CH	1	
3-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	CH	1	
3-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	CH	1	
3-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	CH	1	
3-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	CH	1	
3-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	CH	1	
3-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covini lo	CH	1	
3-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Copropargil	CH	1	
3-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	CH	1	
3-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	CH	1	
3-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	CH	1	
3-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	CH	1	
3-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	CH	1	
3-100	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	CH	1	
3-101	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-102	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-103	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-104	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-106	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-108	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-110	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-111	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-112	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	2	
3-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-115	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	CH	1	
3-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-118	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	CH	1	
3-119	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	

Tabla 4



	(X)m	R	Y	T ⁴	A	p. de (°C.)
4-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	CH	
4-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	CH	
4-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	CH	
4-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Et	CH	161-163
4-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	CH	
4-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	CH	
4-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	CH	
4-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	CH	
4-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	CH	
4-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	CH	
4-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	CH	
4-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	CH	
4-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	CH	
4-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	CH	
4-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	CH	184-186
4-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	CH	
4-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	CH	
4-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	CH	
4-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	CH	
4-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	146-148
4-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	142-144
4-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-31	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-32	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-33	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-34	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-35	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-36	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-37	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-38	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-39	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-40	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-41	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-42	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-43	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-44	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-45	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-46	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	N	
4-47	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-48	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-49	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	

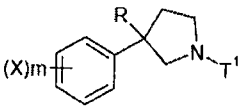
	(X)m	R	Y	T ⁺	A	p. de f. (°C)
4-50	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-52	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-54	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	CH	
4-55	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-56	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-57	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	CH	
4-58	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	CH	
4-59	3,5-diCl	CF3	H	CO2Bu-t	N	
4-60	3,5-diCl	CF3	H	CO2H	N	
4-61	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-62	3,5-diCl	CF3	CF3	F	CH	
4-63	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	CH	
4-64	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	CH	
4-65	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	CH	
4-66	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-67	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	CH	

5

10

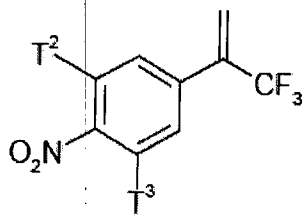
15

Tabla 5



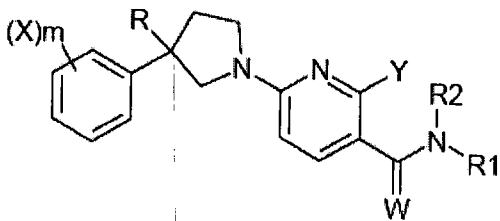
	(X)m	R	T ¹	p. de f. (°C)
5-1	2-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-2	2-Cl	CF ₃	H	
5-3	3-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-4	3-Cl	CF ₃	H	
5-5	4-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-6	4-Cl	CF ₃	H	
5-7	2,3-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-8	2,3-diCl	CF ₃	H	
5-9	3,4-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-10	3,4-diCl	CF ₃	H	
5-11	3,5-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-12	3,5-diCl	CF ₃	H	
5-13	3,5-diCl	CF ₃	H, HCl sal	
5-14	3,4,5-triCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-15	3,4,5-triCl	CF ₃	H	
5-16	3-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-17	3-CF ₃	CF ₃	H	
5-18	3,5-diCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	H	
5-20	3-Br	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-21	3-Br	CF ₃	H	
5-22	3,5-diBr	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-23	3,5-diBr	CF ₃	H	
5-24	3-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-25	3-NO ₂	CF ₃	H	
5-26	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	
5-28	3-CN	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-29	3-CN	CF ₃	H	
5-30	3-OCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-31	3-OCF ₃	CF ₃	H	
5-32	3-SCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-33	3-SCF ₃	CF ₃	H	
5-34	3-S(O)CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-35	3-S(O)CF ₃	CF ₃	H	
5-36	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-37	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	H	
5-38	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-39	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	H	

Tabla 6



	T^2	T^3	p.f. ($^{\circ}\text{C}$)
6-1	CH3	CH3	
6-2	CH3	CH2CH3	
6-3	CH2CH3	CH2CH3	
6-4	n-Pr	n-Pr	
6-5	iso-Pr	iso-Pr	
6-6	ciclo-Pr	ciclo-Pr	
6-7	n-Bu	n-Bu	
6-8	terc -Bu	terc -Bu	
6-9	n-Pen	n-Pen	

Tabla 7



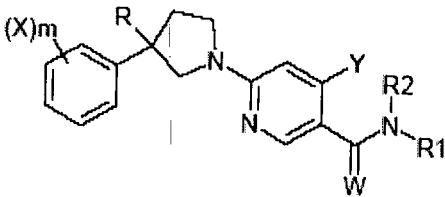
	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p. de f. °C
7-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-2	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
7-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
7-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-piridilCH2	H	O	
7-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
7-6	3,5-diCl	CF3	F	2-piridilCH2	H	O	
7-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
7-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-piridilCH2	H	O	
7-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
7-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-piridilCH2	H	O	
7-11	3,5-diCl	CF3	Br	Ciclo-Pr	H	O	
7-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
7-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
7-14	3,5-diCl	CF3	I	2-piridilCH2	H	O	
7-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-17	3-Cl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-19	3-Br	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-20	3-CF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-24	3-NO2	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-piridilCH2	H	O	
7-26	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	

	(X)m	R	Y		R1	R2	W	p. de f. □°C□
7-27	3,5-diCl	CF3	CH3O		2-piridilCH2	H	O	
7-28	3,5-diCl	CF3	CN		2-piridilCH2	H	O	
7-29	3,5-diCl	CF3	CF3O		2-piridilCH2	H	O	
7-30	3,5-diCl	CF3	CF3S		2-piridilCH2	H	O	
7-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)		2-piridilCH2	H	O	
7-32	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2		2-piridilCH2	H	O	
7-33	3,5-diCl	CF3	CF3S		2-piridilCH2	H	O	
7-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)		2-piridilCH2	H	O	
7-35	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2		2-piridilCH2	H	O	
7-36	3,5-diCl	CF3	OH		2-piridilCH2	H	O	
7-37	3,5-diCl	CF3	SH		2-piridilCH2	H	O	
7-38	3,5-diCl	CF3	NH2		2-piridilCH2	H	O	
7-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3		2-piridilCH2	H	O	
7-40	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3		2-piridilCH2	H	O	
7-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3		2-piridilCH2	H	O	
7-42	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3		2-piridilCH2	H	O	
7-43	3-CH3	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-44	3-CH3O	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-45	3-CN	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-46	3-CF3O	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-47	3-CH3S	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-48	3-CH3S(O)	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-49	3-CH3S(O)2	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-50	3-CF3S	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-51	3-CF3S(O)	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-52	3-CF3S(O)2	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-53	3-OH	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-54	3-SH	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-55	3,4-diCl	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-56	3,4-diCl	CF3	H		CF3CH2	H	O	
7-57	3,4,5-triCl	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-58	3,4,5-triCl	CF3	H		CF3CH2	H	O	
7-59	3,5-diBr	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
7-60	3,5-diBr	CF3	H		CF3CH2	H	O	
7-61	3,5-diMe-4-	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p. de f. □°C□
	NO2						
7-62	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-63	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	H	S	
7-64	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	O	
7-65	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	O	
7-66	3,5-diCl	CF3	NO2	Iso-Pr	H	O	
7-67	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	O	
7-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	O	
7-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	O	
7-70	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(ciclo)Pr	H	O	
7-71	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2Me	H	O	
7-72	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2CF3	H	O	
7-73	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	O	
7-74	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	O	
7-75	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	O	
7-76	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	O	
7-77	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	O	
7-78	3,5-diCl	CH3	H	2-piridilCH2	H	O	
7-79	3,5-diCl	CF3	H	2-piridilCH2	CH3	O	
7-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-piridilCH2	H	S	
7-82	2-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-piridilCH2	H	O	
7-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-piridilCH2	H	O	
7-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl- piridil)CH2	H	O	
7-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl- piridil)CH2	H	O	
7-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-piridinilCH2	H	O	
7-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-etilpirrolidin-2-il)CH2	H	O	
7-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
7-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6--Cl- piridil)CH2	H	O	
7-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p. de f. °C
7-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	O	
7-94	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	2-piridilCH2	H	O	
7-95	4-Cl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
7-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	O	
7-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
7-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-piridilCH2	H	O	
7-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	

Tabla 8



5

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p. de f. °C
8-1	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
8-2	3,5-diCl	CF3	CH3	2-piridilCH2	H	O	
8-3	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
8-4	3,5-diCl	CF3	F	2-piridilCH2	H	O	
8-5	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
8-6	3,5-diCl	CF3	Cl	2-piridilCH2	H	O	
8-7	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
8-8	3,5-diCl	CF3	Br	2-piridilCH2	H	O	
8-9	3,5-diCl	CF3	Br	Ciclo-Pr	H	O	
8-10	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
8-11	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
8-12	3,5-diCl	CF3	I	2-piridilCH2	H	O	

-130-

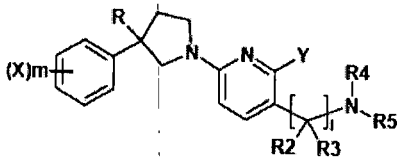
	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p. de f. □°C□
8-13	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-14	3,5-diCl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-15	3-Cl	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-16	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-17	3-Br	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-18	3-CF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-19	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-20	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-21	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-22	3-NO2	CF3	NO2	2-piridilCH2	H	O	
8-23	3,5-diCl	CF3	CF3	2-piridilCH2	H	O	
8-24	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
8-25	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
8-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-piridilCH2	H	O	
8-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-piridilCH2	H	O	
8-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-piridilCH2	H	O	
8-29	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-piridilCH2	H	O	
8-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-piridilCH2	H	O	
8-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-piridilCH2	H	O	
8-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-piridilCH2	H	O	
8-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-piridilCH2	H	O	
8-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-piridilCH2	H	O	
8-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-piridilCH2	H	O	
8-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-piridilCH2	H	O	
8-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-piridilCH2	H	O	
8-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-piridilCH2	H	O	
8-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-piridilCH2	H	O	
8-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-piridilCH2	H	O	
8-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-piridilCH2	H	O	
8-42	3-CH3	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
8-43	3-CH3O	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
8-44	3-CN	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
8-45	3-CF3O	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
8-46	3-CH3S	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	
8-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-piridilCH2	H	O	

	(X)m	R	Y		R1	R2	W	p. de f. □°C□
8-48	3-CH3S(O)2	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-49	3-CF3S	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-50	3-CF3S(O)	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-51	3-CF3S(O)2	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-52	3-OH	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-53	3-SH	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-54	3,4-diCl	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-55	3,4-diCl	CF3	H		CF3CH2	H	O	
8-56	3,4,5-triCl	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-57	3,4,5-triCl	CF3	H		CF3CH2	H	O	
8-58	3,5-diBr	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-59	3,5-diBr	CF3	H		CF3CH2	H	O	
8-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H		CF3CH2	H	O	
8-62	3,5-diCl	CF3	H		2-piridilCH2	H	S	
8-63	3,5-diCl	CF3	NO2		H	H	O	
8-64	3,5-diCl	CF3	NO2		Me	H	O	
8-65	3,5-diCl	CF3	NO2		Iso-Pr	H	O	
8-66	3,5-diCl	CF3	NO2		PhCH2	H	O	
8-67	3,5-diCl	CF3	NO2		CH2CO2CH3	H	O	
8-68	3,5-diCl	CF3	NO2		CH2CONMe	H	O	
8-69	3,5-diCl	CF3	NO2		CH2(ciclo)Pr	H	O	
8-70	3,5-diCl	CF3	NO2		SO2Me	H	O	
8-71	3,5-diCl	CF3	NO2		SO2CF3	H	O	
8-72	3,5-diCl	CF3	NO2		CH2=CHCH2	H	O	
8-73	3,5-diCl	CF3	NO2		HCCCH2	H	O	
8-74	3,5-diCl	CF3	NO2		CH2CN	H	O	
8-75	3,5-diCl	CF3	NO2		C(Me)2CH2SCH3	H	O	
8-76	3,5-diCl	CF3	NO2		2-F-Ph	H	O	
8-77	3,5-diCl	CH3	H		2-piridilCH2	H	O	
8-78	3,5-diCl	CF3	H		2-piridilCH2	CH3	O	
8-79	3-NO2	CF3	NO2		CF3CH2	H	O	
8-80	3,5-diCl	CF3	Cl		2-piridilCH2	H	S	

	(X)m	R	Y		R1	R2	W	p. de f. □°C□
8-81	2-diCl	CF3	NO2		2-piridilCH2	H	O	
8-82	2,3-diCl	CF3	NO2		2-piridilCH2	H	O	
8-83	3,5-diCl	CF3	NO2		3-piridilCH2	H	O	
8-84	3,5-diCl	CF3	NO2		4-piridilCH2	H	O	
8-85	3,5-diCl	CF3	NO2		2-(6-Cl- piridil)CH2	H	O	
8-86	3,5-diCl	CF3	NO2		3-(6-Cl- piridil)CH2	H	O	
8-87	3,5-diCl	CF3	NO2		2-pirinidinilCH ₂	H	O	
8-88	3,5-diCl	CF3	NO2		1-(1-etilpirrolidin-2-il)CH2	H	O	
8-89	3,5-diCl	CF3	CF3		CF3CH2	H	O	
8-90	3,5-diCl	CF3	CF3		2-(6--Cl- piridil)CH2	H	O	
8-91	3,5-diCl	CF3	NO2		Me2NCH=		O	
8-92	3,5-diCl	CF3	NO2		EtON=CH	H	O	
8-93	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3		2-piridilCH2	H	O	
8-94	4-Cl	CF3	NO2		2-piridilCH2	H	O	
8-95	4-Cl	CF3	NO2		CF3CH2	H	O	
8-96	3,5-diCl	CF3	CN		CF3CH2	H	O	
8-97	3,5-diCl	CF3	CF3		H	H	O	
8-98	3,5-diCF3	CF3	CF3		2-piridilCH2	H	O	
8-99	3,5-diCF3	CF3	CF3		CF3CH2	H	O	

5

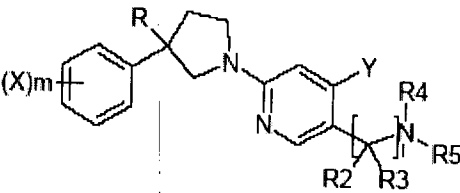
Tabla 9



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p. de f (CC.)
9-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	1	
9-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	1	
9-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
9-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
9-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2- piridilo	1	
9-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
9-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
9-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
9-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
9-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
9-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
9-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
9-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
9-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
9-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
9-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
9-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2- piridilo	1	
9-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
9-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinilo	COCH3	1	
9-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargilo	COCH3	1	
9-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
9-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
9-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
9-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	1	
9-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
9-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
9-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
9-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
9-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2- piridilo	1	
9-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
9-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
9-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
9-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-piridilCO	COCH3	1	
9-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5		p. de f (C.C.)
9-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-52	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-53	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-54	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-55	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-56	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-57	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-58	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-59	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-60	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-61	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-62	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-63	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-64	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
9-65	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
9-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
9-67	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	1	
9-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
9-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
9-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
9-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
9-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
9-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
9-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
9-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
9-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	1	
9-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
9-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
9-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPi ridi-1-2	1	
9-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPi ridi-1-3	1	
9-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPi ridi-1-4	1	
9-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPi ridi-1-4	1	
9-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
9-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
9-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
9-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
9-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
9-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
9-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
9-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
9-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Co vinilo	1	
9-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpropargilo	1	
9-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
9-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
9-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
9-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
9-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
9-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
9-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
9-100	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
9-101	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-102	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
9-103	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-104	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-106	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-108	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-110	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-111	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
9-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
9-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
9-118	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

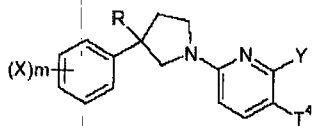
Tabla 10



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p. de f. (°C.)
10-1	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-2	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-3	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
10-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
10-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-piridilo	1	
10-6	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
10-7	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
10-8	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
10-9	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-10	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
10-11	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
10-12	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
10-13	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
10-14	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
10-15	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
10-16	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-17	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-18	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
10-19	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
10-20	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-21	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-22	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-23	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-24	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-piridilo	1	
10-25	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
10-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinilo	COCH3	1	
10-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargilo	COCH3	1	
10-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
10-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
10-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
10-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	1	
10-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
10-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
10-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
10-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
10-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-piridilo	1	
10-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
10-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
10-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
10-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-piridil CO	COCH3	1	
10-43	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-44	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-45	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-46	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-47	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-48	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-49	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

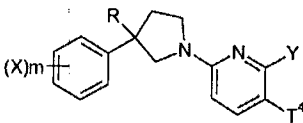
	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p...de f(C...)
10-50	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-51	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-52	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-53	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-54	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-55	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-56	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-57	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-58	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-59	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-60	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-61	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-62	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
10-63	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
10-64	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
10-65	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	1	
10-66	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
10-67	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
10-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
10-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
10-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
10-71	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
10-72	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
10-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
10-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	1	
10-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
10-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
10-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpriidj1-2	1	
10-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpriidj1-3	1	
10-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpriidj1CO-4	1	
10-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
10-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
10-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
10-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
10-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
10-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
10-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
10-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
10-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinilo	1	
10-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargilo	1	
10-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
10-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
10-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
10-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
10-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
10-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
10-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
10-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
10-98	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-99	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-100	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
10-101	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-102	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-103	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-104	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-105	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-106	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-107	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-108	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-109	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
10-110	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-111	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
10-113	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-114	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
10-116	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

Tabla 11



	(X)m	R	Y	T ⁴	p. de f(°C.)
11-1	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-2	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-3	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
11-4	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
11-5	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
11-6	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
11-7	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
11-8	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
11-9	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
11-10	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
11-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
11-12	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
11-13	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
11-14	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
11-15	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
11-16	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
11-17	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-18	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-20	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-21	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-22	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-23	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-24	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-25	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-26	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-28	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-29	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-30	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-31	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-32	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-33	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-34	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-35	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-36	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-37	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-38	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-39	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-40	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-41	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-42	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-43	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-44	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-45	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-46	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-47	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-48	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	
11-49	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-50	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-51	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ H	
11-52	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ Me	
11-53	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-54	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	F	
11-55	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NO ₂	
11-56	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NH ₂	
11-57	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Et	
11-58	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-59	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	

Tabla 12



	(X)m	R	Y	T ⁴	p. de f. (°C)
12-1	3,5-diCl	CF3	H	NO2	
12-2	3,5-diCl	CF3	H	CN	
12-3	3,5-diCl	CF3	H	NH2	
12-4	3,5-diCl	CF3	H	CO2Me	
12-5	3,5-diCl	CF3	H	CO2H	
12-6	3,5-diCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-7	3,5-diCl	CF3	NO2	CO2H	
12-8	3,5-diCl	CF3	NH2	CO2Me	
12-9	3,5-diCl	CF3	F	CO2Me	
12-10	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	
12-11	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Bu-t	
12-12	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2H	
12-13	3,5-diCl	CF3	Br	CO2Me	
12-14	3,5-diCl	CF3	I	CO2Me	
12-15	3,5-diCl	CF3	CH3	CO2Me	
12-16	3,5-diCl	CF3	Cl	CH3	
12-17	3,5-diCl	CF3	CN	F	
12-18	3,5-diCl	CF3	CH3	NO2	
12-19	3,5-diCl	CF3	CH3	NH2	
12-20	3,5-diCl	CF3	Br	NO2	
12-21	3,5-diCl	CF3	Br	NH2	
12-22	3-CF3	CF3	NO2	CO2Me	
12-23	3-CF3	CF3	NO2	CO2H	
12-24	3,5-diCF3	CF3	NO2	CO2Me	
12-25	3,5-diCF3	CF3	NO2	CO2H	
12-26	3,4-diCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-27	3,4-diCl	CF3	NO2	CO2H	
12-28	3-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-29	3-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-30	3,5-diBr	CF3	NO2	CO2Me	
12-31	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-32	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
12-33	3-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
12-34	3-CH3	CF3	NO2	CO2Me	
12-35	3-CH3O	CF3	NO2	CO2Me	
12-36	3-CN	CF3	NO2	CO2Me	
12-37	3-CF3O	CF3	NO2	CO2Me	
12-38	3-CH3S	CF3	NO2	CO2Me	
12-39	3-CH3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
12-40	3-CH3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	

	(X)m	R	Y	T ⁴	p. de f. (°C)
12-41	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	
12-42	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
12-43	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
12-44	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	
12-45	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	
12-46	3-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-47	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	
12-48	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-49	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-50	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-52	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	
12-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	
12-54	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-55	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-56	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	
12-57	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	
12-58	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	
12-59	3,5-diCl	CF3	CF3	F	
12-60	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	
12-61	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	
12-62	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	
12-63	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	
12-64	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	

-140-

Tabla 13

	1H-RMN
1-2	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,50-2,60 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,49-3,65 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,61 (2H, d), 7,21 (1H, dd), 7,29 (2H, d), 7,33-7,40 (3H, m), 7,68 (1H, td), 7,82 (2H, d), 8,57 (1H, d).
1-3	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,56 (4H, m), 2,83-2,87 (1H, m), 3,50-3,56 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,00-4,15 (3H, m), 6,03 (1H, s a), 6,38-6,41 (2H, m), 7,26-7,39 (4H, m).
1-4	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,49-2,55 (4H, m), 2,80-2,88 (1H, m), 3,50-3,56 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,08 (1H, d), 4,71 (2H, d), 6,39-6,41 (2H, m), 7,10-7,18 (2H, m), 7,32-7,43 (4H, m), 7,65-7,68 (1H, m), 8,51 (1H, d).
1-6	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,50-2,63 (1H, m), 2,86-2,90 (1H, m), 3,53-3,58 (2H, m), 3,78-3,81 (1H, m), 4,10-4,14 (1H, m), 4,78 (2H, d), 6,23-6,28 (1H, m), 6,43-6,46 (1H, m), 7,17-7,40 (5H, m), 7,67-7,77 (2H, m), 8,02-8,06 (1H, m), 8,57-8,59 (1H, m).
1-7	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,57 (1H, m), 2,87-2,88 (1H, m), 3,51-3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,08-4,19 (3H, m), 6,53-6,56 (2H, m), 6,87-6,91 (1H, m), 7,26-7,27 (1H, m), 7,39-7,42 (1H, m), 7,85-7,88 (1H, m).
1-8	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,86-2,90 (1H, m), 3,53-3,56 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,09 (1H, d), 4,80 (2H, d), 6,52-6,56 (2H, m), 7,20-7,27 (2H, m), 7,38-7,39 (2H, m), 7,70-7,73 (2H, m), 7,85 (1H, d), 8,56 (1H, d).
1-9	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,56-2,58 (1H, m), 2,85-2,93 (1H, m), 3,51-3,58 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,10-4,14 (3H, m), 6,56-6,61 (2H, m), 6,75-6,76 (1H, m), 7,26-7,29 (1H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,69 (1H, d).
1-10	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,85-2,90 (1H, m), 3,46-3,59 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,08 (1H, d), 4,77 (2H, d), 6,55-6,56 (1H, m), 6,75-6,78 (1H, m), 7,18-7,44 (5H, m), 7,65-7,70 (2H, m), 8,54-8,55 (1H, m).
1-11	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 0,62-0,65 (2H, m), 0,83-0,89 (2H, m), 2,54-2,61 (1H, m), 2,86-2,90 (2H, m), 3,47-3,57 (2H, m), 3,76 (1H, d), 4,06 (1H, d), 6,34 (1H, s a), 6,52-6,55 (1H, m), 6,71 (1H, d), 7,26-7,27 (2H, m), 7,39-7,40 (1H, m), 7,63 (1H, d).

-141-

1-12	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,60 (1H, m), 2,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 2,86-2,90 (1H, m), 3,50-3,57 (2H, m), 3,67-3,79 (3H, m), 4,08 (1H, d), 6,53-6,56 (1H, m), 6,74-6,81 (2H, m), 7,27-7,27 (1H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,63 (1H, dz).
1-15	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,56-2,66 (1H, m), 2,90-2,98 (1H, m), 3,52-3,68 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,04-4,16 (3H, m), 6,09 (1H, t), 6,75 (1H, dd), 7,10 (1H, d), 7,28 (2H, d), 7,40-7,43 (2H, m).
1-16	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,65 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,15-7,23 (2H, m), 7,28 (2H, s a), 7,37 (1H, d), 7,41 (1H, t), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).
1-17	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,57-2,67 (1H, m), 2,88-2,98 (1H, m), 3,49-3,67 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,74 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,14 (1H, t), 7,21 (1H, dd), 7,26-7,38 (5H, m), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).
1-18	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,58-2,68 (1H, m), 2,91-3,00 (1H, m), 3,50-3,68 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,04-4,17 (3H, m), 6,06 (1H, t), 6,75 (1H, d), 7,10 (1H, s), 7,26-7,42 (5H, m).
1-21	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,61-2,72 (1H, m), 2,98-3,06 (1H, m), 3,53-3,70 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,09 (2H, dt), 4,22 (1H, d), 6,08 (1H, t), 6,76 (1H, dd), 7,11 (1H, d), 7,42 (1H, d), 7,57-7,69 (4H, m).
1-22	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,62-2,73 (1H, m), 3,03-3,11 (1H, m), 3,57-3,73 (2H, m), 3,89 (1H, d), 4,27 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,79 (1H, dd), 7,12 (1H, d), 7,16-7,24 (2H, m), 7,37 (1H, d), 7,51 (1H, d), 7,70 (1H, td), 7,84 (2H, s a), 7,95 (1H, s a), 8,52 (1H, d).
1-23	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,63-2,73 (1H, m), 3,04-3,13 (1H, m), 3,58-3,74 (2H, m), 3,89 (1H, d), 4,10 (2H, td), 4,28 (1H, d), 6,07 (1H, t), 6,80 (1H, dd), 7,15 (1H, d), 7,43 (1H, d), 7,83 (2H, s a), 7,95 (1H, s a).
1-25	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,52-3,64 (2H, m), 3,81 (1H, d), 4,11 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,69-6,72 (1H, m), 6,82-6,83 (1H, m), 7,15-7,40 (5H, m), 7,50-7,53 (1H, m), 7,66-7,69 (1H, m), 8,50 (1H, d).
1-27	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,63 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,55-3,62 (2H, m), 3,81-3,87 (1H, m), 4,11-4,14 (1H, m), 4,78 (2H, d), 6,76-6,79 (1H, m), 6,87-6,88 (1H, m), 7,26-7,35 (5H, m), 7,57-7,60 (1H, m), 7,68-7,70 (1H, m), 7,79-7,82 (1H, m), 8,55-8,57 (1H, m).

-142-

1-31	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,45 (3H, s), 3,56-3,68 (2H, m), 3,82-3,86 (1H, m), 4,14-4,17 (1H, m), 4,74 (2H, d, J = 5,1 Hz), 6,72-6,75 (1H, m), 7,18-7,21 (1H, m), 7,28-7,29 (4H, m), 7,36-7,41 (2H, m), 7,53-7,55 (1H, m), 7,67-7,0 (1H, m), 8,50-8,52 (1H, m).
1-38	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,46-2,56 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,77 (1H, d), 4,06 (1H, d), 4,70 (2H, d), 5,79 (2H, d), 5,97-6,00 (1H, m), 7,18-7,41 (7H, m), 7,65-7,68 (1H, m), 8,56 (1H, d).
1-39	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,61 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,55-3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,36-6,39 (1H, m), 7,25-7,36 (4H, m), 7,64-7,70 (2H, m), 7,92-7,95 (2H, m), 8,57 (1H, d), 13,64 (1H, s).
1-54	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,64 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,49-3,66 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,74 (1H, dd), 7,07 (1H, d), 7,16-7,27 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,47-7,52 (3H, m), 7,70 (1H, td), 8,51 (1H, d).
1-56	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,62 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,52-3,67 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,21 (2H, t), 7,36 (1H, d), 7,42 (2H, s), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,51 (1H, d).
1-57	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,66 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,03-4,15 (3H, m), 6,08 (1H, s a), 6,75 (1H, dd), 7,10 (1H, s), 7,40-7,42 (3H, m).
1-60	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,36 (6H, s), 2,56-2,66 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,74 (2H, d, J = 4,9 Hz), 6,75 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,15-7,23 (4H, m), 7,37 (1H, d), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,51 (1H, d).
1-61	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,37 (6H, s), 2,57-2,68 (1H, m), 2,92-3,00 (1H, m), 3,52-3,68 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,03-4,18 (3H, m), 6,09 (1H, t), 6,75 (1H, dd), 7,11 (1H, d), 7,15 (2H, s), 7,41 (1H, d).
1-63	¹ H-RMN (acetona-d ₆) δ: 2,72-2,85 (1H, m), 3,03-3,07 (1H, m), 3,63-3,71 (2H, m), 4,04 (1H), 4,38 (1H, d), 6,58 (1H, s a), 6,85-6,88 (1H, m), 7,02 (1H, d), 7,23 (1H, s a), 7,53-7,59 (4H, m).
1-73	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,09 (1H, s), 2,58-2,62 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,57-3,61 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H), 4,22 (2H, c), 6,04 (1H, s a), 6,73-6,75 (1H, m), 7,07 (1H, d), 7,27-7,28 (2H, m), 7,41-7,43 (2H, m).

-143-

1-74	¹ H-RMN (acetona-d ₆) δ: 2,77-2,85 (1H, m), 3,08-3,10 (1H, m), 3,66-3,68 (2H, m), 4,09 (1H, d), 4,33-4,46 (3H, m), 6,94-6,97 (1H, m), 7,14 (1H, d), 7,55-7,63 (3H, m), 8,20-8,23 (1H, m).
1-75	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,50 (6H, s), 2,17 (3H, s), 2,57-2,62 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,02 (2H, s), 3,56-3,59 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,11 (1H, d), 5,82 (1H, s a), 6,71-6,73 (1H, m), 7,05 (1H, d), 7,27-7,28 (2H, m), 7,41-7,42 (2H, m).
1-78	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,64 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,79 (2H, d), 6,95 (1H, dd), 7,17-7,21 (1H, m), 7,28 (2H, s), 7,35 (1H, d), 7,41 (1H, t), 7,65 (1H, td), 7,96 (1H, d), 8,10 (1H, d), 8,66-8,58 (2H, m).
1-80	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,64-2,75 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,54-3,73 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,04-4,15 (2H, m), 4,25 (1H, d), 6,04 (1H, t), 6,78 (1H, dd), 7,13 (1H, d), 7,43 (1H, d), 7,65 (1H, t), 7,76 (1H, d), 8,27-8,31 (2H, m).
1-81	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,61 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,45-3,61 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,08 (1H, d), 5,08 (2H, d), 6,49-6,54 (2H, m), 7,22-7,28 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,72 (1H, td), 7,79 (1H, d), 8,54 (1H, d), 9,27 (1H, s a).
1-82	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,65-2,77 (1H, m), 3,18-3,26 (1H, m), 3,59 (2H, d), 3,99 (1H, d), 4,48 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,76 (1H, dd), 7,08-7,51 (9H, m), 7,70 (1H, td), 8,53 (1H, d).
1-83	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,65-2,76 (1H, m), 3,18-3,25 (1H, m), 3,59 (2H, d), 3,99 (1H, d), 4,49 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,76 (1H, dd), 7,07-7,38 (6H, m), 7,53 (2H, dt), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).
1-84	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,61-2,64 (1H, m), 2,89-2,93 (1H, m), 3,57-3,60 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,62 (2H, d), 6,42 (1H, s a), 6,71-6,74 (1H, m), 7,06 (1H, d), 7,27-7,42 (5H, m), 7,79 (1H, d), 8,51-8,54 (2H, m).
1-85	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,57-2,63 (1H, m), 2,88-2,94 (1H, m), 3,54-3,63 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,59 (2H, d), 6,64-6,74 (2H, m), 7,05 (1H, d), 7,28 (4H, d), 7,41-7,43 (2H, m), 8,51-8,53 (2H, m).
1-86	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,56-3,68 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,14 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,74-6,79 (2H, m), 7,09-7,10 (1H, m), 7,25-7,50 (5H, m), 7,68 (1H, t).

-144-

1-87	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,57-2,65 (1H, m), 2,90-2,95 (1H, m), 3,50-3,62 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,53 (2H, d), 6,66-6,70 (2H, m), 7,02 (1H, d), 7,25-7,41 (5H, m), 7,72-7,74 (1H, m), 8,26 (1H, d).
1-88	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,58-2,63 (1H, m), 2,91-2,95 (1H, m), 3,53-3,68 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,14 (1H, d), 4,88 (2H, d), 6,75-6,78 (1H, m), 7,08 (1H, d), 7,20-7,29 (4H, m), 7,41-7,41 (1H, m), 7,55 (1H, d), 8,72 (2H, d).
1-90	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,56-2,61 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,65 (2H, m), 3,81 (1H, d), 3,99-4,13 (3H, m), 6,20-6,22 (1H, m), 6,68-6,71 (1H, m), 6,81 (1H, d), 7,27-7,28 (2H, m), 7,40-7,41 (1H, m), 7,45 (1H, d).
1-91	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,60 (1H, m), 2,88-2,92 (1H, m), 3,52-3,65 (2H, m), 3,81 (1H, d), 4,11 (1H, d), 4,67 (2H, d), 6,74-6,82 (3H, m), 7,23-7,28 (4H, m), 7,38-7,39 (1H, m), 7,50 (1H, d), 7,64 (1H, t).
1-92	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,12 (6H, d), 3,53-3,63 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,62-6,67 (2H, m), 7,25-7,28 (1H, m), 7,40 (1H, d), 8,04 (1H, d), 8,54 (1H, s).
1-93	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,28 (3H, t), 2,59-2,64 (1H, m), 2,93-2,97 (1H, m), 3,58-3,67 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,10-4,18 (3H, m), 6,75-6,78 (1H, m), 7,09-7,50 (4H, m), 7,70-7,72 (1H, m), 8,47-8,50 (1H, m).
1-95	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,88-2,97 (1H, m), 3,47-3,65 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,14 (1H, d), 4,73 (2H, d), 6,73 (1H, dd), 7,06 (1H, d), 7,23-7,15 (2H, m), 7,31-7,41 (5H, m), 7,48 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,51 (1H, d).
1-96	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,56-2,67 (1H, m), 2,90-2,99 (1H, m), 3,48-3,67 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,03-4,16 (3H, m), 6,06 (1H, s a), 6,73 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,33 (2H, d), 7,38-7,42 (3H, m).
1-97	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,58-2,63 (1H, m), 2,91-2,96 (1H, m), 3,55-3,67 (2H, m), 3,81-3,84 (1H, m), 4,07-4,18 (3H, m), 6,70-6,80 (3H, m), 7,27-7,42 (3H, m), 7,75-7,78 (1H, m).
1-98	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,89-2,92 (1H, m), 3,21-3,35 (1H, m), 3,59-3,78 (3H, m), 4,10-4,13 (1H, m), 5,94-5,97 (2H, m), 6,73-6,85 (2H, m), 7,23-7,56 (4H, m).

1-99	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,63-2,68 (1H, m), 3,02-3,07 (1H, m), 3,55-3,71 (2H, m), 3,86-3,90 (1H, m), 4,23-4,26 (1H, m), 4,74 (2H, d), 6,74-6,77 (1H, m), 6,86-6,86 (1H, m), 7,07-7,10 (1H, m), 7,20-7,22 (1H, m), 7,31-7,34 (1H, m), 7,53-7,56 (1H, m), 7,68-7,70 (1H, m), 7,85-7,94 (3H, m), 8,51-8,53 (1H, m).
1-100	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,65-2,67 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,59-3,66 (2H, m), 3,86-3,90 (1H, m), 4,11-4,20 (3H, m), 5,99-6,02 (1H, m), 6,76-6,85 (2H, m), 7,50-7,53 (1H, m), 7,84-7,95 (3H, m).
1-101	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,64 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,54-3,70 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,04-4,18 (3H, m), 6,94 (1H, dd), 7,29 (2H, s), 7,41 (1H, t), 7,92 (1H, d), 8,14-8,06 (2H, m).
1-102	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,46-2,61 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,50-3,60 (2H, m), 3,77-3,81 (1H, m), 4,07-4,10 (1H, m), 4,70 (2H, d, J = 4,9 Hz), 6,67-6,70 (1H, m), 6,80-6,81 (1H, m), 7,15-7,17 (2H, m), 7,30-7,32 (1H, m), 7,40-7,43 (2H, m), 7,48-7,51 (1H, m), 7,65-7,67 (1H, m), 8,47-8,49 (1H, m).
2-8	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,65 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,50-3,68 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,71 (2H, d), 7,30 (2H, d), 7,41 (1H, t), 7,54 (2H, d), 8,85 (1H, s).
2-29	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,14 (3H, s), 2,54-2,64 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,49-3,65 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,51-6,54 (2H, m), 7,17 (1H, d), 7,30 (2H, d), 7,41 (1H, t), 8,68 (1H, s).
2-31	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,59-2,69 (1H, m), 2,92-3,01 (1H, m), 3,57-3,73 (2H, m), 3,88 (1H, d), 4,18 (1H, d), 6,83 (1H, dd), 6,94 (1H, d), 7,44-7,30 (4H, m), 8,73 (1H, s).
2-40	1H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,62-2,73 (1H, m), 2,95-3,03 (1H, m), 3,49-3,55 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,31 (1H, d), 7,09 (1H, dd), 7,29 (1H, d), 7,61 (1H, d), 7,68 (2H, d), 7,71 (1H, t), 8,26 (1H, s), 8,98 (1H, s).
3-3	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,99 (3H, s), 2,50-2,58 (1H, m), 2,82-2,87 (1H, m), 3,45-3,51 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H, d), 4,41 (2H, d), 6,43-6,46 (1H, m), 6,58 (1H, d), 7,26-7,38 (4H, m).
3-4	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,98-2,02 (3H, m), 2,53-2,61 (1H, m), 2,81-2,89 (1H, m), 3,46-3,52 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H), 4,42-4,44 (2H, m), 5,78-5,81 (1H, m), 6,49-6,51 (1H, m), 6,77 (1H, d), 7,27-7,29 (4H, m).

3-11	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,13-2,18 (3H, m), 2,51-2,53 (1H, m), 2,81-2,83 (1H, m), 3,45-3,56 (2H, m), 3,75-3,78 (1H, m), 4,01-4,04 (1H, m), 4,25 (1H, s), 4,57 (1H, s), 6,40-6,44 (2H, m), 6,93-6,96 (1H, m), 7,30-7,38 (3H, m).
3-102	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,03 (3H, s), 2,53-2,60 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,51-3,59 (2H, m), 3,78-3,82 (1H, m), 4,07-4,13 (1H, m), 4,50-4,55 (2H, m), 5,72-5,76 (1H, m), 6,70-6,78 (2H, m), 7,27-7,53 (4H, m).
3-113	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,99 (3H, s), 2,58-2,68 (1H, m), 2,99-3,03 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,83-3,86 (1H, m), 4,18-4,21 (1H, m), 4,50 (2H, d), 5,73-5,76 (1H, m), 6,74-6,81 (2H, m), 7,47-7,50 (1H, m), 7,85-7,93 (3H, m).
4-1	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,56-2,64 (1H, m), 2,89-2,98 (1H, m), 3,63-3,67 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,19 (1H, d), 6,57 (2H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,18 (2H, d).
4-2	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,56-3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,59 (2H, d), 7,26 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 7,52 (2H, d).
4-3	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,45-2,54 (1H, m), 2,74-2,82 (1H, m), 3,34-3,47 (4H, m), 3,73 (1H, d), 3,93 (1H, d), 6,49-6,51 (2H, m), 6,67-6,71 (2H, m), 7,30 (2H, s a), 7,36 (1H, t).
4-5	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,72 (1H, m), 2,88-3,01 (1H, m), 3,41-3,53 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,26 (1H, d), 6,71 (2H, d), 7,65-7,72 (3H, m), 7,78 (2H, d), 12,25 (1H, s a).
4-6	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,67 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,50-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,26 (3H, s), 7,42 (1H, t), 7,81 (1H, d).
4-7	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,72 (1H, m), 2,91-3,04 (1H, m), 3,47-3,57 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,32 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,65 (2H, d), 7,71 (1H, t), 7,78 (1H, d).
4-8	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,46-2,56 (1H, m), 2,79-2,85 (1H, m), 3,52-3,57 (2H, m), 3,76-3,86 (4H, m), 4,01-4,12 (1H, m), 5,68-5,76 (2H, m), 5,87-5,99 (1H, m), 6,26-6,32 (2H, m), 7,38-7,41 (1H, m), 7,75-7,76 (1H, m), 7,83-7,86 (1H, m).

4-10	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,58 (1H, m), 2,86-2,92 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,80 (1H, d), 3,87 (3H, s), 4,11 (1H, d), 6,45-6,48 (1H, m), 6,61 (1H, d), 7,26-7,27 (2H, m), 7,40-7,41 (1H, m), 7,88 (1H, d).
4-11	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,59 (9H, s), 2,54-2,56 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,53-3,56 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,09 (1H, d), 6,43-6,46 (1H, m), 6,58 (1H, d), 7,24-7,26 (2H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,80 (1H, d).
4-12	¹ H-RMN (acetona-d ₆) δ: 2,74-2,84 (1H, m), 3,05-3,10 (1H, m), 3,64-3,69 (2H, m), 4,04 (1H, d), 4,40 (1H, d), 6,70-6,77 (2H, m), 7,55-7,65 (3H, m), 7,91 (1H, d).
4-13	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,84-2,93 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,80-3,87 (4H, m), 4,11 (1H, d), 6,49-6,52 (1H, m), 6,84 (1H, d), 7,26-7,27 (2H, m), 7,40-7,41 (1H, m), 7,87 (1H, d).
4-14	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,56 (1H, m), 2,85-2,86 (1H, m), 3,51-3,57 (2H, m), 3,74-3,87 (4H, m), 4,09 (1H, d), 6,54-6,56 (1H, m), 7,17-7,18 (1H, m), 7,27-7,31 (2H, m), 7,38-7,39 (1H, m), 7,85 (1H, d).
4-15	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (4H, m), 2,84-2,85 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,79-3,84 (4H, m), 4,11 (1H, d), 6,39-6,44 (2H, m), 7,26-7,29 (2H, m), 7,39-7,39 (1H, m), 7,91-7,94 (1H, m).
4-16	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,27 (3H, s), 2,49-2,54 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,38-3,54 (2H, m), 3,74 (1H, d, J = 10,4 Hz), 3,99 (1H, d, J = 10,4 Hz), 6,40-6,43 (1H, m), 6,60-6,62 (1H, m), 7,05-7,08 (1H, m), 7,21-7,33 (2H, m), 7,37-7,44 (1H, m).
4-18	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,64 (1H, m), 2,67 (3H, s), 2,87-2,95 (1H, m), 3,51-3,71 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,17 (1H, d), 6,37 (1H, d), 6,45 (1H, dd), 7,28 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 8,14 (1H, d).
4-19	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,19 (3H, s), 2,41-2,58 (1H, m), 2,73-2,81 (1H, m), 3,15-3,51 (4H, m), 3,73 (1H, d), 3,92 (1H, d), 6,34-6,44 (2H, m), 6,66 (1H, d), 7,31-7,41 (3H, m).
4-20	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,66 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,16 (1H, d), 6,53 (1H, dd), 6,84 (1H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,07 (1H, d).

4-21	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,44-2,54 (1H, m), 2,75-2,83 (1H, m), 3,32-3,50 (2H, m), 3,56-3,76 (3H, m), 3,92 (1H, d), 6,46 (1H, dd), 6,70-6,78 (2H, m), 7,29 (2H, s a), 7,37 (1H, t).
4-23	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,63-2,75 (1H, m), 2,96-3,12 (1H, m), 3,49-3,59 (2H, m), 3,91 (1H, d), 4,41 (1H, d), 6,88 (1H, dd), 7,06 (1H, d), 7,67-7,90 (5H, m), 13,00 (1H, s a).
4-24	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,61-2,73 (1H, m), 3,03-3,13 (1H, m), 3,58-3,75 (2H, m), 3,85 (3H, s), 3,89 (1H, d), 4,29 (1H, d), 6,73 (1H, dd), 6,79 (1H, d), 7,80-7,85 (3H, m), 7,95 (1H, s a).
4-25	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,66-2,80 (1H, m), 3,11-3,22 (1H, m), 3,51-3,61 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,51 (1H, d), 6,90 (1H, d), 7,06 (1H, s a), 7,81 (1H, t), 8,22 (3H, s a), 13,03 (1H, s a).
4-26	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,64 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,50-3,69 (2H, m), 3,84 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,68 (1H, dd), 6,74 (1H, d), 7,22 (1H, dd), 7,47-7,52 (2H, m), 7,81 (1H, d).
4-27	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,59-2,74 (1H, m), 2,90-3,00 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,30 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,03 (1H, d), 7,55 (1H, d), 7,73-7,86 (3H, m), 12,98 (1H, s a).
4-29	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,59-2,71 (1H, m), 2,90-3,01 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,89 (1H, d), 4,31 (1H, d), 6,87 (1H, dd), 7,05 (1H, d), 7,50 (3H, s a), 7,64 (1H, s a), 7,78 (1H, d), 13,00 (1H, s a).
4-32	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,36 (6H, s), 2,56-2,66 (1H, m), 2,92-3,00 (1H, m), 3,52-3,69 (2H, m), 3,93-3,84 (4H, m), 4,17 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,14 (2H, s), 7,81 (1H, d).
4-33	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,63-2,73 (1H, m), 3,01-3,09 (1H, m), 3,55-3,73 (2H, m), 3,85 (3H, s), 3,92 (1H, d), 4,26 (1H, d), 6,71 (1H, dd), 6,77 (1H, d), 7,62-7,83 (3H, m), 8,27-8,31 (2H, m).
4-47	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,66-2,77 (1H, m), 3,01-3,10 (1H, m), 3,50-3,62 (2H, m), 3,95 (1H, d), 4,43 (1H, d), 6,89 (1H, d), 7,08 (1H, s), 7,75-7,81 (2H, m), 8,03 (1H, d), 8,28-8,35 (2H, m), 13,02 (1H, s a).

-149-

4-48	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,60-2,72 (1H, m), 2,94-3,05 (1H, m), 3,50-3,57 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,32 (1H, d), 6,87 (1H, d), 7,03 (1H, s), 7,79 (1H, d, J = 9,0 Hz), 7,88 (2H, s), 13,03 (1H, s).
4-49	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,64-2,75 (1H, m), 3,18-3,25 (1H, m), 3,55-3,63 (2H, m), 3,84 (3H, s), 3,98 (1H, d), 4,50 (1H, d), 6,67-6,74 (2H, m), 7,32-7,48 (4H, m), 7,82 (1H, d).
4-50	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,67-2,78 (1H, m), 3,23-3,37 (1H, m), 3,46-3,64 (2H, m), 3,91 (1H, d), 4,57 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,43-7,56 (3H, m), 7,64-7,68 (1H, m), 7,80 (1H, d), 13,01 (1H, s a).
4-51	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,89-2,98 (1H, m), 3,49-3,67 (2H, m), 3,84 (3H, s), 3,86 (1H, d), 4,14 (1H, t), 6,66 (1H, dd), 6,73 (1H, d), 7,32 (2H, d), 7,40 (2H, d), 7,80 (1H, d).
4-52	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,68 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,45-3,60 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,28 (1H, d), 6,85 (1H, dd), 7,03 (1H, d), 7,52 (2H, d), 7,57 (2H, d), 7,78 (1H, d), 13,02 (1H, s a).
4-53	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,56-2,61 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,58-3,66 (2H, m), 3,82-3,85 (1H, m), 4,12-4,16 (1H, m), 4,35 (2H, c), 6,67-6,70 (1H, m), 6,88-6,89 (1H, m), 7,25-7,28 (2H, m), 7,41-7,41 (1H, m), 7,86-7,89 (1H, m).
4-56	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,97 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,82 (2H, d), 3,85 (3H, s), 4,14 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,41 (2H, s), 7,81 (1H, d).
4-57	¹ H-RMN (DMSO-d ₆) δ: 2,64-2,67 (1H, m), 2,93-3,00 (1H, m), 3,49-3,52 (2H, m), 3,88-3,90 (1H, m), 4,31-4,35 (1H, m), 6,92-6,95 (1H, m), 7,18-7,21 (1H, m), 7,67-7,69 (3H, m), 7,89-7,92 (1H, m).
4-58	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,57-2,63 (1H, m), 2,91-2,96 (1H, m), 3,52-3,69 (2H, m), 3,82-3,86 (1H, m), 3,94 (3H, s), 4,11-4,18 (1H, m), 6,73-6,76 (1H, m), 6,89-6,90 (1H, m), 7,27-7,42 (3H, m), 8,01-8,03 (1H, m).
4-59	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,63 (9H, s), 2,53-2,63 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,41 (1H, t), 7,95 (1H, d), 8,10 (1H, d).

4-60	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,58-2,69 (1H, m), 2,93-3,02 (1H, m), 3,63-3,73 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,27 (1H, d), 7,18 (1H, d), 7,26 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,41 (1H, s), 8,13 (1H, d), 8,20 (1H, s), 9,92 (1H, s).
4-61	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,60-2,71 (1H, m), 3,01-3,09 (1H, m), 3,60-3,71 (2H, m), 3,88-3,90 (1H, m), 4,28-4,36 (3H, m), 6,71-6,74 (1H, m), 6,91-6,91 (1H, m), 7,84-7,97 (4H, m).
4-62	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,51-2,61 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,43-3,58 (2H, m), 3,77 (1H, d), 4,03 (1H, d), 6,71-6,66 (2H, m), 7,10 (1H, t), 7,29 (2H, s), 7,39 (1H, s).
4-63	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,57-2,68 (1H, m), 2,93-3,01 (1H, m), 3,75-3,59 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,20 (1H, d), 6,70 (1H, dd), 6,88 (1H, d), 7,28 (2H, d), 7,43 (1H, t), 8,08 (1H, d).
4-65	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,53-2,58 (1H, m), 2,85-2,93 (1H, m), 3,53-3,62 (2H, m), 3,78-3,81 (1H, m), 4,08-4,16 (1H, m), 4,34 (2H, c), 6,25-6,36 (2H, m), 7,28-7,33 (3H, m), 7,84-7,87 (1H, m).
4-66	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,36 (3H, t), 2,55-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,57-3,63 (2H, m), 3,80-3,84 (1H, m), 4,12-4,15 (1H, m), 4,33 (2H, c), 6,67-6,70 (1H, m), 6,87-6,88 (1H, m), 7,41-7,45 (2H, m), 7,84-7,87 (1H, m).
5-1	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,50-2,68 (2H, m), 2,74-2,82 (1H, m), 2,90-2,98 (1H, m), 3,16-3,20 (1H, m), 3,61-3,75 (3H, m), 7,20-7,41 (9H, m).
5-2	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,45-2,55 (1H, m), 2,76-2,85 (1H, m), 3,00-3,09 (1H, m), 3,22-3,35 (2H, m), 4,10 (1H, d), 7,23-7,44 (4H, m).
5-3	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,33-2,42 (1H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,74-2,78 (2H, m), 3,09 (1H, d), 3,18 (1H, d), 3,67 (2H, s), 7,26-7,38 (9H, m).
5-4	1H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,28-2,38 (1H, m), 2,49-2,59 (1H, m), 2,97-3,06 (1H, m), 3,19-3,30 (2H, m), 3,75 (1H, d), 7,28-7,33 (4H, m).

5-5	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,31-2,41 (1H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,70-2,81 (2H, m), 3,08 (1H, d), 3,18 (1H, d), 3,66 (2H, s), 7,24-7,33 (9H, m).
5-6	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,27-2,36 (1H, m), 2,49-2,59 (1H, m), 2,96-3,05 (1H, m), 3,20-3,29 (2H, m), 3,76 (1H, d), 7,28-7,36 (4H, m).
5-7	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,50-2,66 (2H, m), 2,76-2,84 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,16 (1H, dd), 3,61-3,75 (3H, m), 7,17 (1H, t), 7,25-7,35 (6H, m), 7,46 (1H, dd).
5-8	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,41-2,53 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,00-3,09 (1H, m), 3,23-3,32 (2H, m), 4,11 (1H, d), 7,18-7,30 (2H, m), 7,48 (1H, dd).
5-9	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,28-2,37 (1H, m), 2,54-2,62 (1H, m), 2,70-2,82 (2H, m), 3,06 (1H, d), 3,13 (1H, d), 3,66 (2H, s), 7,21-7,33 (6H, m), 7,41 (1H, d), 7,49 (1H, d).
5-10	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,25-2,34 (1H, m), 2,50-2,59 (1H, m), 2,97-3,08 (1H, m), 3,20-3,28 (2H, m), 3,75 (1H, d), 7,20 (1H, d), 7,44 (2H, d).
5-11	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,27-2,36 (1H, m), 2,53-2,62 (1H, m), 2,69-2,83 (2H, m), 3,08 (2H, dd), 3,67 (2H, s), 7,25-7,36 (8H, m).
5-12	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,24-2,33 (1H, m), 2,51-2,56 (1H, m), 2,97-3,07 (1H, m), 3,19-3,26 (2H, m), 3,74 (1H, d), 7,25 (2H, d), 7,35 (1H, t).
5-14	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,24-2,34 (1H, m), 2,53-2,61 (1H, m), 2,67-2,87 (2H, m), 3,06 (2H, dd), 3,67 (2H, dd), 7,24-7,43 (7H, m).
5-15	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,22-2,32 (1H, m), 2,49-2,58 (1H, m), 2,98-3,08 (1H, m), 3,20-3,29 (2H, m), 3,73 (1H, d), 7,39 (2H, s).

5-16	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,35-2,44 (1H, m), 2,60-2,68 (1H, m), 2,72-2,85 (2H, m), 3,16 (2H, dd), 3,68 (2H, dd), 7,28-7,34 (5H, m), 7,46 (1H, t), 7,55-7,60 (2H, m), 7,66 (1H, s).
5-17	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,32-2,41 (1H, m), 2,55-2,65 (1H, m), 2,98-3,07 (1H, m), 3,21-3,33 (2H, m), 3,82 (1H, d), 7,47-7,62 (4H, m).
5-18	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,29-2,40 (1H, m), 2,63-2,77 (2H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,09 (1H, d), 3,16 (1H, d), 3,62 (1H, d), 3,76 (1H, d, J = 13,0 Hz), 7,28-7,34 (5H, m), 7,83 (1H, s), 7,89 (2H, s).
5-19	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,30-2,39 (1H, m), 2,61-2,70 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,24-3,33 (2H, m), 3,86 (1H, d), 7,81 (2H, s), 7,87 (1H, s).
5-24	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,35-2,44 (1H, m), 2,63-2,90 (3H, m), 3,17 (2H, s), 3,69 (2H, dd), 7,26-7,34 (5H, m), 7,53 (1H, t), 7,74 (1H, d), 8,18 (1H, dc), 8,34 (1H, s).
5-25	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,34-2,43 (1H, m), 2,59-2,69 (1H, m), 3,01-3,10 (1H, m), 3,24-3,35 (2H, m), 3,85 (1H, d), 7,57 (1H, t), 7,72 (1H, d), 8,20-8,27 (2H, m).
5-26	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,31-2,42 (7H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,75-2,80 (2H, m), 3,11 (2H, dd), 3,67 (2H, s), 7,14-7,34 (7H, m).
5-27	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,29-2,38 (7H, m), 2,51-2,60 (1H, m), 2,97-3,07 (1H, m), 3,21-3,31 (2H, m), 3,77 (1H, d), 7,12 (2H, s).
6-1	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,34 (6H, s), 5,78-5,80 (1H, m), 6,03-6,04 (1H, m), 7,20 (2H, s).
7-1	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,52-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,60-3,77 (2H, m), 4,00 (1H, d), 4,18-4,07 (2H, m), 4,48 (1H, d), 6,16 (1H, t), 6,43 (1H, d), 7,30 (2H, d), 7,39 (1H, t), 7,95 (1H, dd), 8,62 (1H, d).

7-2	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,52-2,62 (1H, m), 2,87-2,96 (1H, m), 3,59-3,75 (2H, m), 4,01 (1H, d), 4,48 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,43 (1H, d), 7,25-7,20 (1H, m), 7,31 (2H, d), 7,39 (1H, t), 7,47 (1H, s), 7,69 (1H, td), 8,00-8,04 (1H, m), 8,56 (1H, d), 8,73 (1H, d).
7-3	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,49-2,57 (1H, m), 2,60 (3H, s), 2,84-2,92 (1H, m), 3,59-3,70 (2H, m), 3,95-4,15 (3H, m), 4,45 (1H, d), 5,94 (1H, s a), 6,23 (1H, d), 7,26-7,39 (4H, m), 7,58 (1H, d).
7-7	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,65-3,68 (2H, m), 3,94-3,98 (1H, m), 4,10-4,16 (2H, m), 4,45-4,48 (1H, m), 6,37-6,40 (1H, m), 7,23-7,38 (4H, m), 8,12-8,15 (1H, m).
7-25	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,88-2,92 (1H, m), 3,64-3,70 (2H, m), 3,98 (1H, d), 4,44 (1H, d), 4,73 (2H, d), 6,54 (1H, d), 7,14-7,40 (6H, m), 7,69-7,74 (2H, m), 8,52 (1H, d).
7-26	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,68-3,71 (2H, m), 4,05-4,16 (3H, m), 4,45 (1H, d), 6,03 (1H, s a), 6,55 (1H, d), 7,24-7,37 (4H, m), 7,72 (1H, d).
8-23	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,92-2,97 (1H, m), 3,69-3,77 (2H, m), 3,97-4,01 (1H, m), 4,47-4,51 (1H, m), 4,75 (2H, d), 6,62 (1H, s), 7,24-7,36 (6H, m), 7,68-7,70 (1H, m), 8,51-8,52 (2H, m).
8-24	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,58-2,63 (1H, m), 2,93-2,97 (1H, m), 3,71-3,74 (2H, m), 3,96-4,09 (3H, m), 4,47-4,51 (1H, m), 6,42-6,44 (1H, m), 6,61 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,40 (1H, s), 8,41 (1H, s).
8-25	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,91-2,97 (1H, m), 3,68-3,73 (2H, m), 3,97-4,01 (1H, m), 4,48-4,52 (1H, m), 5,74-5,77 (2H, m), 6,62 (1H, s), 7,20-7,37 (3H, m), 8,52 (1H, s).
11-47	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t, J = 7,1 Hz), 2,55-2,66 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,73-3,75 (2H, m), 4,00-4,04 (1H, m), 4,36 (2H, c, J = 7,1 Hz), 4,49-4,54 (1H, m), 6,65 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,40 (1H, s), 8,84 (1H, s).
12-4	¹ H-RMN (CDCl ₃) δ: 2,52-2,62 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,61-3,75 (2H, m), 3,88 (3H, s), 4,01 (1H, d), 4,50 (1H, d), 6,39 (1H, d), 7,31 (2H, s), 7,39 (1H, s), 8,06 (1H, dd), 8,84 (1H, d).

12-5	1H-RMN (DMSO-d6) δ: 2,61-2,72 (1H, m), 2,90-3,01 (1H, m), 3,57-3,66 (2H, m), 3,96 (1H, d), 4,49 (1H, d), 6,67 (1H, d), 7,65 (2H, s), 7,70 (1H, t), 7,97 (1H, dd), 8,66 (1H, d), 12,46 (1H, s a).
12-10	1H-RMN (CDCl3) δ: 2,54-2,59 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,66-3,68 (2H, m), 3,88-3,97 (4H, m), 4,45-4,48 (1H, m), 6,30 (1H, d), 7,28-7,30 (2H, m), 7,39 (1H, s), 8,05-8,08 (1H, m).

Ejemplo de ensayo biológico 1: ensayo para larvas de Spodoptera litura

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida, Emulsionante: 1 parte en
5 peso de polioxietilen alquil fenil éter.

Para preparar un compuesto activo adecuado, 1 parte en peso del compuesto
activo se mezcla con la cantidad anterior del disolvente que contiene la
cantidad anterior del emulsionante, y la mezcla se diluye con agua hasta la
10 concentración prescrita.

Se sumergen las hojas de batata en la solución de muestra diluida con agua
hasta una concentración prescrita y, después de que la solución que se
deposita sobre las hojas se seque al aire, las hojas resultantes se depositan en
15 una placa de laboratorio de 9 cm de diámetro, en la que se sueltan 10 larvas
en la tercera fase de larva de Spodoptera litura, y después la placa se coloca
en una habitación de temperatura controlada a 25°C, seguido de la adición de
las hojas de batata a la placa el segundo día y cuarto día e investigación del
número de insectos muertos después de 7 días para calcular la relación
20 insecticida.

Los resultados son los promedios de dos placas de laboratorio por grupo en este ensayo.

Los compuestos números 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-63, 1-73, 1-75, 1-81, 1-83, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91, 1-93, 2-8, 2-23, 2-29, 2-40, 2-41, 3-3 y 3-4 mostraron un 100% de tasa de muerte a una concentración de 100 ppm del compuesto activo.

10 **Ejemplo de ensayo biológico 2: Ensayo para *Tetranychus urticae* (ensayo de pulverización)**

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo se mezcla con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada del emulsionante, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con agua.

50 a 100 ácaros adultos de *Tetranychus urticae* se inoculan a las hojas de alubia en forma de riñón en la fase de dos hojas plantadas en un tiesto de 6 cm de diámetro. Un día después, se pulveriza una abundante cantidad de la solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo con una pistola de pulverización. Después de la pulverización, el tiesto se mantiene en un invernadero durante 7 días, y la tasa acaricida se calcula usando el siguiente criterio de evaluación:

Tasa acaricida	
100	Todos los ácaros inoculados mueren
98	1 a 4 ácaros sobreviven / se propagan
90	5 a 20 ácaros sobreviven / se propagan
60	Muchos ácaros sobreviven / se propagan, pero menos que el control no tratado, se observan algunos cuerpos muertos
0	No se observó diferencia con respecto al control no tratado

Los compuestos números 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-20, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-75, 1-81, 1-84, 1-86, 1-87, 1-90, 2-29, 3-3 y 3-4 mostraron una tasa acaricida de más del 98% a una concentración de 500 ppm de compuesto activo.

Ejemplo de ensayo biológico 3: Ensayo para Aulacophora femoralis (ensayo de pulverización)

Disolvente: Dimetilformamida 3 partes en peso

Emulsionante: Polioxietilen alquil fenil éter 1 parte en peso

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada del emulsionante, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con agua.

Se empapan hojas de pepinos en una solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo preparada de la misma manera que en los ensayos anteriores, se secan al aire, y se colocaron en una copa de plástico que contenía suelo negro esterilizado. En esta copa, se soltaron
5 después 5 larvas de *Aulacophora femoralis* en la segunda fase instar. Después de 7 días, se cuenta el número de larvas muertas para calcular la tasa de mortalidad.

Los compuestos números 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-
10 16, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-60, 1-61, 1-80, 1-81, 1-85, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91, 2-29, 3-3 y 3-4 mostraron un 100% de tasa de mortalidad a una concentración de 100 ppm del compuesto activo.

15 **Ejemplo de ensayo biológico 4: Ensayo contra *Myzus persicas* resistente a agente de fósforo orgánico y a agente de carbamato**

Disolvente: Dimetilformamida 3 partes en peso

Emulsionante: Polioxietilen alquil fenil éter 1 parte en peso

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, 1 parte en
20 peso del compuesto activo se mezcla con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contenía la cantidad anteriormente mencionada del emulsionante, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con agua.

25 Aproximadamente 30 a 50 adultos de *Myzus persicae* resistente a agente de

fósforo orgánico y a agente de carbamato por plántula se inoculan en las hojas de berenjenas en la fase de dos hojas cultivadas en un tiesto de 6 cm de diámetro. Un día después de la inoculación, una cantidad abundante de la solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo preparada de la misma manera que en los ensayos anteriormente mencionados se pulveriza con una pistola de pulverización. Después de la pulverización, el tiesto se mantiene en un invernadero a 28°C durante 7 días, se calcula la tasa de mortalidad. Se duplica el ensayo.

Los compuestos números 1-7, 1-10, 1-14 y 1-16 mostraron un 98% de tasa de mortalidad a una concentración de 500 ppm del compuesto activo.

Ejemplo de ensayo biológico 5: Ensayo para Ctenocephalides felis.

Disolvente: Dimetilformamida

Con el fin de preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, 10 mg del compuesto activo se disuelven en 0,5 ml del disolvente anteriormente mencionado, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con la sangre de animales domésticos.

Aproximadamente 10 a 15 adultos de Ctenocephalides felis se mantuvieron en un recipiente específico para pulgas. Otro recipiente que contenía la solución de sangre que contenía el compuesto preparado como se ha descrito anteriormente se cubre con una película de laboratorio [PARAFILM (Trademark)]. Al recipiente que contenía la sangre se hizo girar quedando boca abajo y se colocó en el recipiente específico para pulgas. El sistema permite que Ctenocephalides felis chupe la sangre en el recipiente. La solución de

sangre se mantiene a 37 °C y el recipiente específico para pulgas se mantiene a temperatura ambiente. Después de un cierto período de tiempo, se calcula la tasa de mortalidad de *Ctenocephalides felis*. Para este ensayo, la tasa de mortalidad de 100% significa la muerte de todos los *Ctenocephalides felis*,
5 mientras que la tasa de muerte de 0% significa que todas las pulgas sobreviven.

En este ensayo biológico, el compuesto 1-16 mostró más de un 80% de tasa de mortalidad a una concentración de 100 ppm del ingrediente activo.

10

Ejemplo de ensayo biológico 6: Ensayo para *Boophilus microplus*

Disolvente: Dimetilformamida

Con el fin de preparar una formulación adecuada de un compuesto activo, 10
15 mg del compuesto activo se disuelven en 0,5 ml del disolvente anteriormente mencionado, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con agua.

Un solución del compuesto formulado como antes se inyecta en el abdomen de
5 hembras adultas alimentadas completamente de *Boophilus microplus*. Estas
20 *Boophilus microplus* se transfirieron a una placa de replica y se mantuvieron en una vitrina de incubación durante un cierto período de tiempo.

Después de un cierto período de tiempo, se calcula la tasa de mortalidad de *Boophilus microplus*. En este ensayo, la tasa de mortalidad de un 100%
25 significa la muerte de todos los *Boophilus microplus*, mientras que una tasa de

mortalidad de un 0% significa que todos los ácaros sobreviven.

En el ensayo biológico anterior, el compuesto 1-16 mostró más de un 80% de tasa de mortalidad a una dosis de 20 µg/animal del ingrediente activo.

5

Ejemplo de ensayo biológico 7: Ensayo para *Lucillia cuprina*.

Disolvente: Dimetilformamida

Con el fin de preparar una formulación adecuada de un compuesto activo, 10 mg del compuesto activo se disuelven en 0,5 ml del disolvente anteriormente
10 mencionado, y la mezcla se diluye hasta una concentración prescrita con agua.

Aproximadamente 20 a 30 larvas de *Lucillia cuprina* se colocan en un tubo de ensayo que contiene 1 cm³ de carne de caballo troceada y 0,5 ml de una solución acuosa de un compuesto preparado como antes.

15

Después de un cierto período de tiempo, se calcula la tasa de mortalidad de *Lucillia cuprina*. Para este ensayo, la tasa de mortalidad de 100% significa la muerte de todas las *Lucillia cuprina*, mientras que la tasa de mortalidad de 0% significa que todas las moscas sobreviven.

20

En este ensayo biológico, el compuesto 1-16 mostró más de un 80% de tasa de mortalidad a una concentración de 100 ppm del ingrediente activo.

Ejemplo de formulación 1 (gránulos)

25 A una mezcla que contiene 10 partes de un compuesto de acuerdo con la

invención, en concreto el compuesto nº.1-3, 30 partes de bentonita (montmorillonita), 58 partes de talco y 2 partes de sal del ácido ligninsulfónico se añaden a 25 partes de agua, y la mezcla se amasa bien y se granula con 10 a 40 mallas mediante un granulador de extrusión y se seca a de 40 a 50°C para obtener gránulos.

Ejemplo de formulación 2 (gránulos)

95 partes de gránulos de mineral de arcilla que tienen una distribución de diámetro de partícula dentro de un intervalo de 0,2 a 2 mm, que se coloca en un mezclador rotatorio, se humedecen de manera uniforme mediante pulverización de 5 partes del compuesto de acuerdo con la invención, en concreto el compuesto nº 1-3 conjuntamente con un diluyente líquido bajo condiciones de rotación y se seca de 40 a 50°C para obtener gránulos.

Ejemplo de formulación 3 (emulsiones)

30 partes del compuesto de acuerdo con la invención, en concreto el compuesto nº 1-3, 55 partes de xileno, 8 partes de polioxietilen alquilfenil éter y 7 partes de alquilbencenosulfonato de calcio se mezclan conjuntamente para obtener la emulsión.

Ejemplo de formulación 4 (agente humectable)

15 artes del compuesto de acuerdo con la invención, en concreto el compuesto nº 1-3, 80 partes de una mezcla de un carbón blanco (polvo fino de óxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1 : 5), 2 partes de

alquilbencenosulfonato de sodio y 3 partes de condensado de alquilnaftalensulfonato de sodio - formalina se mezclan conjuntamente y la mezcla se tritura para obtener polvo dispersable en agua.

5 Ejemplo de formulación 5 (gránulos humectables)

20 partes del compuesto activo de acuerdo con la invención, en concreto el compuesto nº 1-3, 30 partes de ligninsulfonato de sodio, 15 partes de bentonita y 35 partes de polvo de tierra de diatomeas calcinada se mezclan bien, y después de la adición de agua, que después se extrude con un tamiz de 0,3 mm y se seca para obtener gránulos dispersables en agua.

Disponibilidad industrial

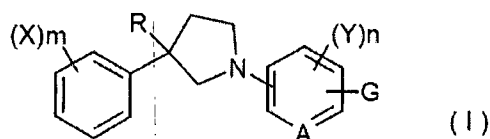
Las aril pirrolidinas novedosas de la invención tienen una excelente acción insecticida como insecticidas como se muestra en los ejemplos anteriores.

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

Reivindicaciones:

1. Aril pirrolidinas representadas por la fórmula (I)

5



en la que

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcoxi-carbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

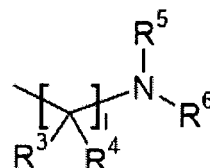
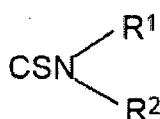
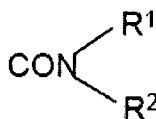
Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcoxycarbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

R representa alquilo o haloalquilo;

m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n representa 1, 2, 3 ó 4;

G se selecciona entre el grupo constituido por



5 en los que

R^1 y R^2 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo o alquilsulfonilo opcionalmente sustituidos; haloalquilsulfonilo o $\text{CH}_2\text{-R}^7$; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

10

R^3 y R^4 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; ciano; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

15 I representa 1, 2 ó 3;

R^5 representa hidrógeno; alquilo; cicloalquilo opcionalmente sustituidos; haloalquilo; ciano; alquenilo; alquinilo; alquilcarbonilo o $\text{CH}_2\text{-R}^7$;

20

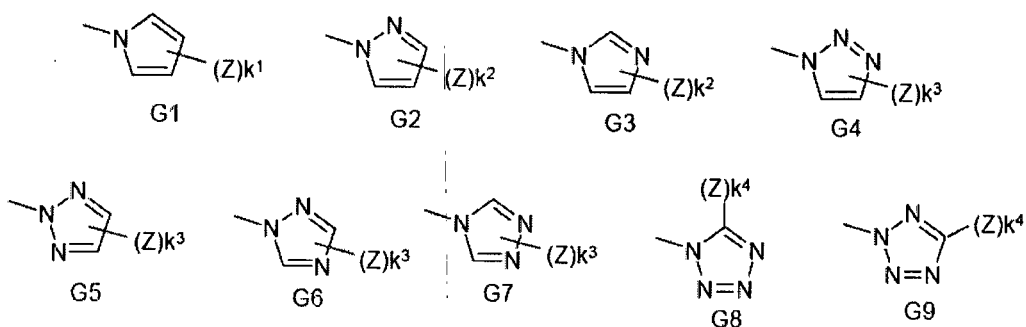
R^6 representa formilo, ciano, alquilcarbonilo, alquiltiocarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalquiltiocarbonilo, alquilaminocarbonilo,

alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, alcoxiaminocarbonilo, alcoxiaminotiocarbonilo, alcoxycarbonilo, alcoxitiocarbonilo, tioalcoxycarbonilo, tioalcoxitiocarbonilo, CO-R^7 , CS-R^7 , alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo; o como alternativa

5

R^5 y R^6 cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

10 o se selecciona entre el grupo constituido por los heterociclos G1 a G9:



en los que

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxí, ciano, haloalcoxí, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo o mercapto;

k^1 representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

20 k^2 representa 0, 1, 2 ó 3;

k^3 representa 0, 1 ó 2;

k^4 representa 0 ó 1;

5

R^7 representa fenilo o anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos;
y

A representa C o N.

10

2. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1

en la que

X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C_{1-6} ,
nitro, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , ciano, haloalcoxi C_{1-6} , alquiltio C_{1-6} , alquilsulfinilo

15 C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquiltio C_{1-6} , haloalquilsulfinilo C_{1-6} ,
haloalquilsulfonilo C_{1-6} , hidroxilo, mercapto, amino, alquil C_{1-6} carbonilamino,
haloalquil C_{1-6} carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C_{1-6} carbonilamino,
haloalcoxi C_{1-6} - carbonilamino, alquil C_{1-6} sulfonilamino o haloalquil C_{1-6}
sulfonilamino;

20

Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C_{1-6} ,
nitro, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , ciano, haloalcoxi C_{1-6} , alquiltio C_{1-6} , alquilsulfinilo
 C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquiltio C_{1-6} , haloalquilsulfinilo C_{1-6} ,
haloalquilsulfonilo C_{1-6} , hidroxilo, mercapto, amino, alquil C_{1-6} carbonilamino,

25 haloalquil C_{1-6} carbonilamino, benzoilamino, alcoxi C_{1-6} - carbonilamino,

-167-

haloalcoxi C₁₋₆ - carbonilamino, alquil C₁₋₆ sulfonilamino o haloalquil C₁₋₆ sulfonilamino;

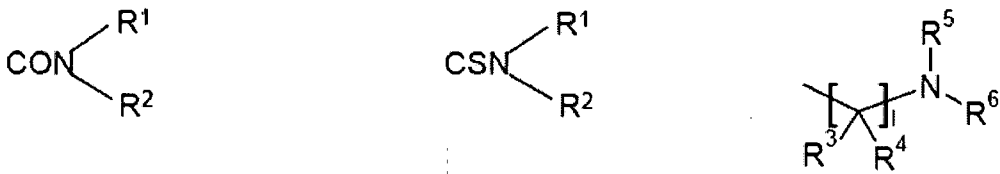
R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

5

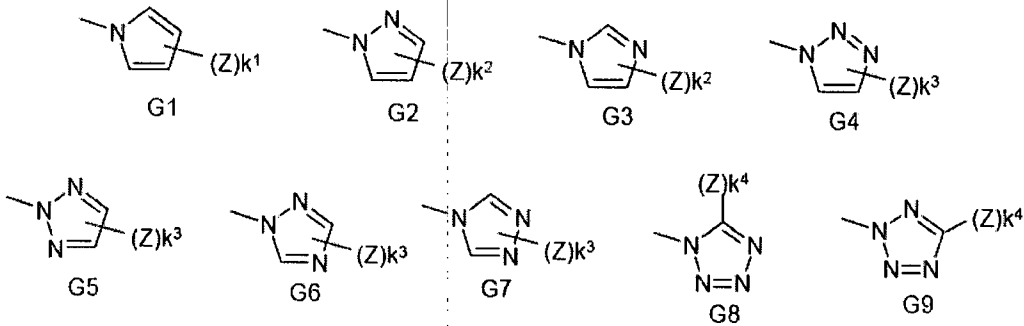
m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n representa 0, 1, 2, ó 4;

10 G se selecciona entre el grupo constituido por



o el grupo constituido por los heterociclos G1 a G9:



en los que

15 R¹ y R² cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno; alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente sustituidos;

alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquilsulfonilo C_{1-6} o CH_2-R^7 ; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

- R^3 y R^4 cada uno de ellos independientemente representa hidrógeno, ciano;
- 5 alquilo C_{1-6} , alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-7} opcionalmente sustituidos; o alcoxi C_{1-6} carbonilo; o cuando se toman conjuntamente representan alquilenos C_{2-6} ;

I representa 1 ó 2 ó 3;

10

R^5 representa hidrógeno; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-7} opcionalmente sustituido; haloalquilo C_{1-6} ; ciano; alqueno C_{2-6} ; alquino C_{2-6} ; alquil C_{1-6} carbonilo; o CH_2-R^7 ;

- 15 R^6 representa formilo, ciano, alquil C_{1-6} carbonilo, alquil C_{1-6} tiocarbonilo, haloalquil C_{1-6} - carbonilo, haloalquil C_{1-6} tiocarbonilo, alquil C_{1-6} aminocarbonilo, alquil C_{1-6} aminotiocarbonilo, dialquilamino-carbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, dialquilaminotio-carbonilo que tiene entre 2 y 8 átomos de carbono, alcoxi C_{1-6} aminocarbonilo, alcoxi C_{1-6} aminotiocarbonilo, alcoxi C_{1-6}
- 20 carbonilo, alcoxi C_{1-6} tiocarbonilo, tioalcoxi C_{1-6} carbonilo, tioalcoxi C_{1-6} tiocarbonilo, $CO-R^7$, $CS-R^7$, alquilsulfonilo C_{1-6} o haloalquilsulfonilo C_{1-6} ; o

- R^5 y R^6 cuando se toman conjuntamente con el nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 3 - 6 miembros que contiene al menos un átomo de N,
- 25 opcionalmente al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que

el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆,
5 haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo o mercapto;

k¹ representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k² representa 0, 1, 2 ó 3;

10

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

15 R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, yodo y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

20

3. La composición insecticida que comprende al menos un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2.

4. El procedimiento para controlar insectos y / o ácaros, que comprende la
25 etapa de tratar los insectos y / o ácaros no deseados y / o su hábitat con la

composición de acuerdo con la reivindicación 3.

5. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para controlar los insectos y / o ácaros no deseados.

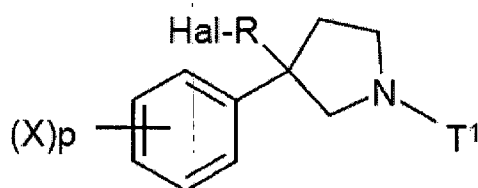
5

6. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para tratar semilla.

7. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para tratar plantas transgénicas.

10

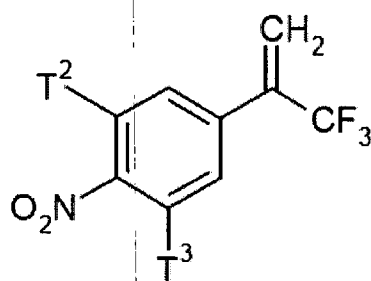
8. Los compuestos representados por la fórmula (IIa)



en la que X se define como en la reivindicación 1 ó 2 , y T¹ representa

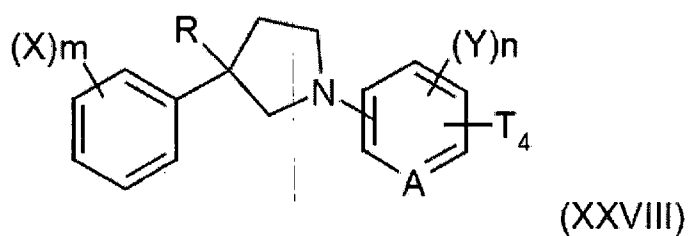
15 . hidrógeno o bencilo, Hal-R representa haloalquilo y p representa 1, 2, 3, 4 ó 5.

9. Los compuestos representados por la fórmula (XVI-a)



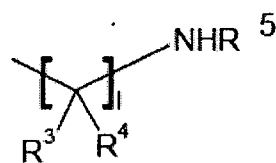
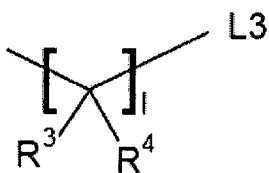
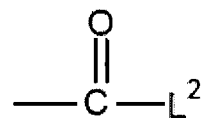
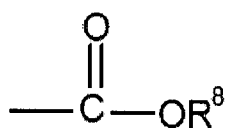
en la que T^2 y T^3 independientemente representan alquilo.

10. Los compuestos representados por la fórmula (XXVIII)



5

en la que X, Y, R, A, m y n se definen como en la reivindicación 1 ó 2 y T^4 representa ciano, amino o nitro o un grupo



10

en los que

I, R^3 , R^4 , R^5 y R^6 se definen como en la reivindicación 1 ó 2;

-172-

R^8 representa hidrógeno o alquilo C_{1-4} ;

L^2 representa cloro, bromo, alquil C_{1-4} carbonilo, alcoxi C_{1-4} carbonilo o azolilo; y

5

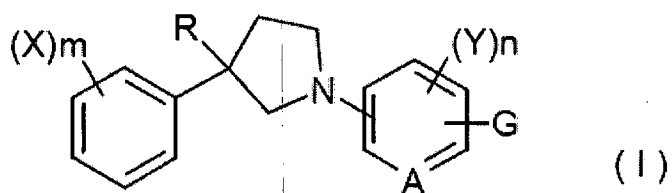
L^3 representa cloro, bromo, yoduro, alquil C_{1-4} sulfonilo, haloalquil C_{1-4} sulfonilo, arilsulfonilo o azolilo.

Aril pirrolidinas insecticidas

Resumen

La presente invención proporciona aril pirrolidinas novedosas que tienen una excelente acción insecticida como insecticidas.

- 5 Aril pirrolidinas representadas por la fórmula:



y su uso como insecticidas.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

PATENTE DE INVENCION X PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional:

(71) Solicitante(s) **BAYER CROPSCIENCE AG**(72) Inventor(es): **MIHARA, Jun; MURATA, Tetsuya; YAMAZAKI, Daiei; YONETA, Yasushi; SHIBUYA, Katsuhiko; SHIMOJO, Eiichi; GÖRGENS, Ulrich.**(74) Apoderado: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**

(30) Prioridad

(31)

No. Prioridad

32)

Fecha

(33)

País**2007-112855****23/04/07****JP**(85) Fecha límite inicio fase nacional: **23-11-09**

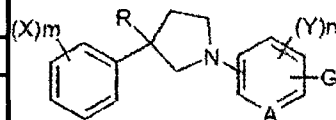
(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

Fecha de presentación de la solicitud: **14 - 04 - 08**

No. de solicitud

PCT/ EP2008/ 003105

(87) Publicación internacional:

Fecha: **30 - 10 - 08**No. Publicación: **WO/2008/128711 A1**

(1)

(54) Título: **ARIL PIRROLIDINAS INSECTICIDAS**

(57) Resumen: La presente invención se refiere a aril pirrolidinas novedosas que tienen una excelente acción insecticida como insecticidas. Aril pirrolidinas representadas por la fórmula (I) y su uso como insecticidas.

CONTINUA AL RESPALDO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

PATENTE DE INVENCION X PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional :

(71) Solicitante (s) **BAYER CROPSCIENCE AG**

(72) Inventor(es): **MIHARA, Jun; MURATA, Tetsuya; YAMAZAKI, Daiei; YONETA, Yasushi; SHIBUYA, Katsuhiko; SHIMOJO, Eiichi; GÖRGENS, Ulrich.**

(74) Apoderado: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**

(30) Prioridad	(31)	No. Prioridad	(32)	Fecha	(33)	País
		2007-112855		23/04/07		JP

(85) Fecha inicio fase nacional: **23-11-09**

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud: **14 - 04 - 08**

No. de solicitud **PCT/ EP2008/ 003105**

(87) Publicación internacional

Fecha: **30 - 10 - 08 (dd/mm/aa)**

N° publicación: **WO/2008/ 128711 A1**

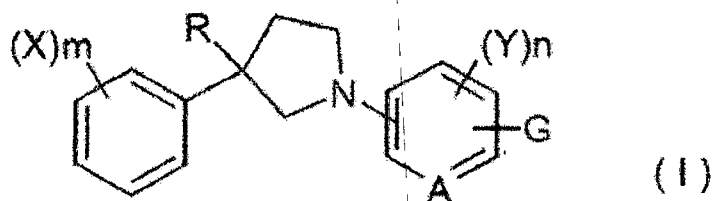
(54) Título: **ARIL PIRROLIDINAS INSECTICIDAS**

 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:		(51) Int Cl:			
(22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG			
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País	(72) Inventor(es)	
	2007-112855	23/04/07	JP	MIHARA, Jun; MURATA, Tetsuya; YAMAZAKI, Daiei; YONETA, Yasushi; SHIBUYA, Katsuhiko; SHIMOJO, Eiichi; GÖRGENS, Ulrich	
				(74) Apoderado: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 23-11-09				(87) Publicación Internacional	
Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 14 - 04 -08 No. de solicitud PCT/ EP2008/ 003105				Fecha: 30 -10-08 Fecha (dd/mm/aa) N° publicación: WO/08/128711 A1	
(54) Titulo: ARIL PIRROLIDINAS INSECTICIDAS					

Resumen:

La presente invención se refiere a aril pirrolidinas novedosas que tienen una excelente acción insecticida como insecticidas.

Aril pirrolidinas representadas por la fórmula:



y su uso como insecticidas.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 73,675
FECHA : SEPTIEMBRE 30 DE 2009

*Este recibo debe ser utilizado
Únicamente para tramites de
Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.*
Marca: Pat. Anil pinudinas
Expediente: Insecticidas

***** CONSIGNACION *****

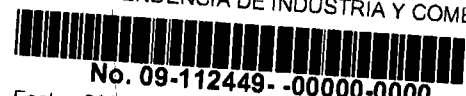
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MARIO DELGADO ECHEVERRY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	6817370	30/09/2009	13,316,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-112449-00000-0000

Fecha: 2009-10-09 15:58:04 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 296

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



No. 09-112449-00000-0000

Fecha: 2009-10-09 15:58:04 Dep. 2020 NUECREACION
 Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASENACIONAL
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 296

ercio

SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN 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 ☐

Felipe Navarro

Firma Responsable

Fecha

09/10-2009

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7y10'

Conmutador: 3 82 0840

Fax: 3505220

E-mail: info@sic.gov.cowww.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.	9 112449
	Solicitud internacional	PCT/EP2008/003105
	Fecha inicio fase nacional	23/11/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	14340

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 ESPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 11 DE DICIEMBRE 2009
adpall