

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 599 779**

51 Int. Cl.:

C07D 251/42 (2006.01)

C07D 251/48 (2006.01)

A01N 43/66 (2006.01)

A01N 43/68 (2006.01)

C07C 279/18 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **22.10.2013 PCT/EP2013/072055**

87 Fecha y número de publicación internacional: **01.05.2014 WO14064094**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.10.2013 E 13779857 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.07.2016 EP 2912024**

54 Título: **Herbicidas de azina**

30 Prioridad:

24.10.2012 EP 12189762

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

03.02.2017

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**NEWTON, TREVOR WILLIAM;
VOGT, FLORIAN;
MAJOR, JULIA;
HANZLIK, KRISTIN;
PARRA RAPADO, LILIANA;
KORDES, MARKUS;
SEITZ, THOMAS;
WITSCHER, MATTHIAS;
KREUZ, KLAUS;
HUTZLER, JOHANNES;
EVANS, RICHARD ROGER y
LERCHL, JENS**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 599 779 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Herbicidas de azina

5 La presente invención se relaciona con azinas de la fórmula general (I) definida adelante y con su uso como herbicidas. Más aún, la invención se relaciona con composiciones agroquímicas para protección de cultivos y con un método para controlar vegetación no deseada.

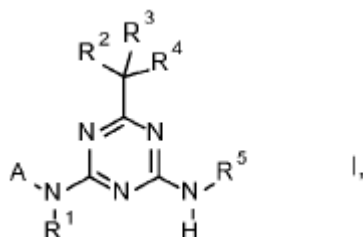
El documento US 3,816,419 describe compuestos estructuralmente similares para los cuales se indica una acción herbicida, que difiere de acuerdo con la presente invención.

Sin embargo, las propiedades herbicidas de estos compuestos conocidos con respecto a las plantas perjudiciales no siempre son completamente satisfactorias.

10 Por lo tanto, un objeto de la presente invención es proporcionar azinas de la fórmula (I) que tengan una acción herbicida mejorada. En particular, se proporcionarán azinas de la fórmula (I) que tienen una alta actividad herbicida, en particular, incluso con bajas tasas de aplicación, y que son suficientemente compatibles con plantas de cultivo para utilización comercial.

15 Este y otros objetos se logran mediante azinas de la fórmula (I), definidas adelante, y mediante sus sales agrícolas adecuadas.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención proporciona azinas de la fórmula (I)



en la que

20 A es fenilo, que se sustituye por dos a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

25 R¹ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

R² H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

R³ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

30 R⁴ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

R³ y R⁴ juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de carbonilo, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros, en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, o heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

35 R⁵ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

Preferiblemente la presente invención proporciona azinas de la fórmula (I), en la que

5 A es 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

10 R¹ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

R² H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

R³ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

R⁴ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

15 R³ y R⁴ juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de carbonilo, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros, en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ o y heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

20 R⁵ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

La presente invención también proporciona composiciones agroquímicas que comprenden por lo menos unas azinas de la fórmula (I) y auxiliares habituales para formular agentes para protección de cultivos.

25 La presente invención también proporciona el uso de azinas de la fórmula (I) como herbicidas, es decir para controlar plantas perjudiciales.

30 La presente invención proporciona adicionalmente un método para controlar la vegetación no deseada, en donde una cantidad efectiva como herbicida de por lo menos una azina de la fórmula (I) se deja actuar sobre plantas, sus semillas y/o su hábitat. La aplicación se puede realizar antes, durante y/o después, preferiblemente, durante y/o después de la emergencia de plantas no deseables.

Más aún, la invención se relaciona con procesos e intermediarios para preparar azinas de la fórmula (I).

35 Realizaciones adicionales de la presente invención son evidentes a partir de las reivindicaciones, descripción y ejemplos. Se debe entender que las características mencionadas anteriormente y que se van a ilustrar a continuación de la materia objeto de la invención se pueden aplicar no solo en la combinación indicada en cada caso particular, sino también en otras combinaciones, sin apartarse del alcance de la invención.

Como se utiliza aquí, los términos "controlar" y "combatir" son sinónimos. Como se utiliza aquí, los términos "vegetación no deseable" y "plantas perjudiciales" son sinónimos.

40 Si las azinas de la fórmula (I) como se describe aquí son capaces de formar isómeros geométricos, por ejemplo, isómeros E/Z, es posible utilizar ambos, los isómeros puros y mezclas de los mismos, en las composiciones de acuerdo con la invención.

Si las azinas de la fórmula (I) que se describen aquí tienen uno o más centros de quiralidad y, como consecuencia, están presentes como enantiómeros o diastereómeros, es posible utilizar ambos, los diastereómeros y enantiómeros puros y mezclas de los mismos, en las composiciones de acuerdo con la invención.

45 Si las azinas de la fórmula (I) como se describe aquí tienen grupos funcionales ionizables, también se pueden emplear en la forma de sus sales agrícolamente aceptables. En general, son adecuadas las sales de aquellos

cationes y las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efecto adverso sobre la actividad de los compuestos activos.

5 Los cationes preferidos son los iones de los metales alcalinos, preferiblemente, de litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente, de calcio y magnesio, y de los metales de transición, preferiblemente, de manganeso, cobre, zinc y hierro, además de amonio y amonio sustituido, en el que se reemplazan de 1 a 4 átomos de hidrógeno por alquilo C₁-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, hidroxialcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo o bencilo, preferiblemente amonio, metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, heptilamonio, dodecilamonio, tetradecilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio (sal de olamina), 2-(2-hidroxietil-1-oxi)etil-1-amonio (sal de diglicolamina), di(2-hidroxietil-1-oxi)amonio (sal de diolamina), tris(2-hidroxietil)amonio (sal de trolamina), tris(2-hidroxipropil)amonio, benciltrimetilamonio, benciltrietilamonio, N,N,N-trimetiletanolamonio (sal de colina), además de iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferiblemente, tri(alquilo C₁-C₄)sulfonio, tal como trimetilsulfonio, e iones de sulfoxonio, preferiblemente, tri(alquilo C₁-C₄)sulfoxonio, y finalmente, las sales de aminas polibásicas, tales como N,N-bis-(3-aminopropil)metilamina y dietilentriamina.

15 Los aniones de sales de adición de ácido útiles son, principalmente, cloruro, bromuro, fluoruro, yoduro, hidrógeno sulfato, metilsulfato, sulfato, dihidrógeno fosfato, hidrógeno fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y también los aniones de ácidos alcanóicos C₁-C₄, preferiblemente, formiato, acetato, propionato y butirato.

20 Otras realizaciones de la presente invención son evidentes a partir de las reivindicaciones, descripción y ejemplos. Se debe entender que las características mencionadas anteriormente y que se van a ilustrar a continuación de la materia objeto de la invención se pueden aplicar no solo en la combinación indicada en cada caso particular, sino también en otras combinaciones, sin apartarse del alcance de la invención.

25 Las unidades estructurales orgánicas mencionadas en la definición de las variables, por ejemplo R¹ a R⁵ son - como el término halógeno - términos colectivos para enumeraciones individuales de cada uno de los miembros del grupo. El término "halógeno" indica, en cada caso, flúor, cloro, bromo o yodo. Todas las cadenas de hidrocarburo, es decir, todas las cadenas de alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, (alquil)amino, di(alquil)amino pueden ser cadenas rectas o ramificadas; el prefijo C_n-C_m indica, en cada caso, la cantidad posible de átomos de carbono en el grupo.

Ejemplos de dichos significados son:

30 - alquilo C₁-C₄: por ejemplo CH₃, C₂H₅, n-propilo, CH(CH₃)₂, n-butilo, CH(CH₃)-C₂H₅, CH₂-CH(CH₃)₂ y C(CH₃)₃;

- alquilo C₁-C₆ y también las unidades estructurales de alquilo C₁-C₆ de (alquilo C₁-C₆)carbonilo, alquilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆: alquilo C₁-C₄ como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo o 1-etil-2-metilpropilo, preferiblemente metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, n-butilo, 1,1-dimetiletilo, n-pentilo o n-hexilo;

40 - haloalquilo C₁-C₄: un radical alquilo C₁-C₄ como se mencionó anteriormente que es parcial o completamente sustituido por flúor, cloro, bromo y/o yodo, por ejemplo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, bromometilo, yodometilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2-bromoetilo, 2-yodoetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 2,3-difluoropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-tricloropropilo, 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, heptafluoropropilo, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo, 1-(clorometil)-2-cloroetilo, 1-(bromometil)-2-bromoetilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-bromobutilo, nonafluorobutilo, 1,1,2,2,-tetrafluoroetilo y 1-trifluorometil-1,2,2,2-tetrafluoroetilo;

45 - haloalquilo C₁-C₆: haloalquilo C₁-C₄ como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, 5-fluoropentilo, 5-cloropentilo, 5-bromopentilo, 5-yodopentilo, undecafluoropentilo, 6-fluorohexilo, 6-clorohexilo, 6-bromohexilo, 6-yodohexilo y dodecafluorohexilo;

50 - cicloalquilo C₃-C₆: hidrocarburos saturados monocíclicos que tienen 3 a 6 miembros en el anillo, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

- alqueno C₂-C₆: por ejemplo etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-

- butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2- dimetil-1-propenilo, 1,2- dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1- metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1- metil-2-pentenilo, 2-metil-2- pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil- 3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4- metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2- butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2- butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1- butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil- 3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2- butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3- dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil- 3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2- etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1- etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2- metil-2-propenilo;
- cicloalqueno C_3-C_6 : 1-ciclopropenilo, 2-ciclopropenilo, 1-ciclobutenilo, 2-ciclobutenilo, 1-ciclopentenilo, 2- ciclopentenilo, 1,3-ciclopentadienilo, 1,4-ciclopentadienilo, 2,4-ciclopentadienilo, 1-ciclohexenilo, 2-ciclohexenilo, 3- ciclohexenilo, 1,3-ciclohexadienilo, 1,4-ciclohexadienilo, 2,5-ciclohexadienilo;
- alquino C_3-C_6 : por ejemplo 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1- dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1- metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3- metil-4-pentinilo, 4- metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2- dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3- butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3- butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;
- alcoxi C_1-C_4 : por ejemplo metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi y 1,1-dimetiletoxi;
- alcoxi C_1-C_6 y también las unidades estructurales alcoxi C_1-C_6 de (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 : alcoxi C_1-C_4 como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3- metoxilbutoxi, 1,1- dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metil pentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2- dimetilbutoxi, 2,3- dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1- metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi.
- alquiltio C_1-C_4 : por ejemplo metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2- metilpropiltio y 1,1- dimetileiltio;
- alquiltio C_1-C_6 : alquiltio C_1-C_4 como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2- metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2- dimetilpropiltio, 1- metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2- trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1- etil-2-metilpropiltio;
- alquilsulfino C_1-C_6 (alquilo $C_1-C_6-S(=O)-$): z.B. metilsulfino, etilsulfino, propil-sulfino, 1-metiletilsulfino, butilsulfino, 1-metilpropilsulfino, 2-metilpropilsulfino, 1,1-dimetiletilsulfino, pentilsulfino, 1-metilbutilsulfino, 2- metilbutilsulfino, 3-metilbutilsulfino, 2,2-dimetilpropilsulfino, 1-etilpropilsulfino, 1,1-dimetilpropilsulfino, 1,2- dimetilpropilsulfino, hexilsulfino, 1-metilpentilsulfino, 2-metilpentilsulfino, 3-metilpentilsulfino, 4-metilpentil- sulfino, 1,1-dimetilbutil-sulfino, 1,2-dimetilbutilsulfino, 1,3-dimetilbutil-sulfino, 2,2- dimetilbutilsulfino, 2,3- dimetilbutilsulfino, 3,3-dimetilbutil-sulfino, 1-etilbutilsulfino, 2-etilbutilsulfino, 1,1,2-trimetilpropilsulfino, 1,2,2- trimetilpropilsulfino, 1-etil-1-metilpropilsulfino y 1-etil-2-metilpropilsulfino;
- alquilsulfonilo C_1-C_6 (alquilo $C_1-C_6-S(O)_2-$): por ejemplo metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1- metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimetiletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1- metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2- dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3- metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2- trimetil-propilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo;
- (alquilo C_1-C_4)amino: por ejemplo metilamino, etilamino, propilamino, 1-metiletilamino, butilamino, 1- metilpropilamino, 2-metilpropilamino o 1,1-dimetiletilamino;
- (alquilo C_1-C_6)amino: (alquilamino C_1-C_4) como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, pentilamino, 1- metilbutilamino, 2-metilbutilamino, 3-metilbutilamino, 2,2-dimetilpropilamino, 1-etilpropilamino, hexilamino, 1,1- dimetilpropilamino, 1,2-dimetilpropilamino, 1-metilpentilamino, 2-metilpentilamino, 3-metilpentilamino, 4- metilpentilamino, 1,1-dimetilbutilamino, 1,2-dimetilbutilamino, 1,3-dimetilbutilamino, 2,2-dimetilbutilamino, 2,3-

dimetilbutil-amino 3,3-dimetilbutilamino, 1-etilbutilamino, 2-etilbutilamino, 1,1,2-trimetilpropilamino, 1,2,2-trimetilpropilamino, 1-etil-1-metilpropilamino o 1-etil-2-metilpropilamino;

5 - di(alquilo C₁-C₄)amino: por ejemplo N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino, N,N-di(1-metiletil)amino, N,N-dipropilamino, N,N-dibutilamino, N,N-di(1-metilpropil)-amino, N,N-di(2-metilpropil)amino, N,N-di(1,1-dimeteletil) amino, N-etil-N-metilamino, N-metil-N-propilamino, N-metil-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-metilamino, N-metil-N-(1-metilpropil)amino, N-metil-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimeteletil)-N-metilamino, N-etil-N-propilamino, N-etil-N-(1-metiletil)amino, N-(1-metiletil)-N-propilamino, N-butil-N-propilamino, N-(1-metilpropil)-N-propilamino, N-(2-metilpropil)-N-propilamino, N-(1,1-dimeteletil)- N-propilamino, N-butil-N-(1-metiletil)amino, N-(1-metiletil)-N-(1-metilpropil)amino, N-(1-metiletil)- N-(2-metilpropil)-amino, N-(1,1-dimeteletil)-N-(1-metiletil)amino, N-butil-N-(1-metilpropil)amino, N-butil-N-(2-metilpropil)amino, N-butil-N-(1,1-dimeteletil)amino, N-(1-metilpropil)-N-(2-metilpropil)amino, N-(1,1-dimeteletil)-N-(1-metilpropil)amino o N-(1,1-dimeteletil)-N-(2-metilpropil)amino;

15 - di(alquilo C₁-C₆)amino: di(alquilo C₁-C₄)amino como se mencionó anteriormente, y también, por ejemplo, N-metil-N-pentilamino, N-metil-N-(1-metilbutil)amino, N-metil-N-(2-metilbutil)amino, N-metil-N-(3-metilbutil)amino, N-metil-N-(2,2-dimetilpropil)amino, N-metil-N-(1-etilpropil)amino, N-metil-N-hexilamino, N-metil-N-(1,1-dimetilpropil) amino, N-metil-N-(1,2-dimetilpropil)amino, N-metil-N-(1-metilpentil)amino, N-metil-N-(2-metilpentil) amino, N-metil-N-(3-metilpentil)amino, N-metil-N-(4-metilpentil)amino, N-metil-N-(1,1-dimetilbutil) amino, N-metil-N-(1,2-dimetilbutil)amino, N-metil-N-(1,3-dimetilbutil)amino, N-metil-N-(2,2-dimetilbutil) amino, N-metil-N-(2,3-dimetilbutil)amino, N-metil-N-(3,3-dimetilbutil)amino, N-metil-N-(1-etilbutil) amino, N-metil-N-(2-etilbutil)amino, N-metil-N-(1,1,2-trimetilpropil)amino, N-metil-N-(1,2,2-trimetilpropil) amino, N-metil-N-(1-etil-1-metilpropil)amino, N-metil-N-(1-etil-2-metilpropil)amino, N-etil-N-pentilamino, N-etil-N-(1-metilbutil)amino, N-etil-N-(2-metilbutil)amino, N-etil-N-(3-metilbutil)amino, N-etil-N-(2,2-dimetilpropil)amino, N-etil-N-(1-etilpropil)amino, N-etil-N-hexilamino, N-etil-N-(1,1-dimetilpropil) amino, N-etil-N-(1,2-dimetilpropil)amino, N-etil-N-(1-metilpentil)amino, N-etil-N-(2-metilpentil)amino, N-etil-N-(3-metilpentil)amino, N-etil-N-(4-metilpentil)-amino, N-etil-N-(1,1-dimetilbutil) amino, N-etil-N-(1,2-dimetilbutil)amino, N-etil-N-(1,3-dimetilbutil)amino, N-etil-N-(2,2-dimetilbutil) amino, N-etil-N-(2,3-dimetilbutil)amino, N-etil-N-(3,3-dimetilbutil)amino, N-etil-N-(1-etilbutil)-amino, N-etil-N-(2-etilbutil)amino, N-etil-N-(1,1,2-trimetilpropil)amino, N-etil-N-(1,2,2-trimetilpropil)amino, N-etil-N-(1-etil-1-metilpropil)amino, N-etil-N-(1-etil-2-metilpropil)amino, N-propil-N-pentilamino, N-butil-N-pentilamino, N,N-dipentilamino, N-propil-N-hexilamino, N-butil-N-hexilamino, N-pentil-N-hexilamino o N,N-dihexilamino;

30 - heterociclilo de tres a seis miembros: hidrocarburo monocíclico saturado o parcialmente insaturado que tiene tres a seis miembros en el anillo como se mencionó anteriormente que, adicionalmente a los átomos de carbono, contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de O, S y N;

por ejemplo 2-oxiranilo, 2-oxetanilo, 3-oxetanilo, 2-aziridinilo, 3-tietanilo, 1-azetidínilo, 2-azetidínilo,

35 por ejemplo 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo;

40 por ejemplo 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 4,5-dihidropirrol-2-ilo, 4,5-dihidropirrol-3-ilo, 2,5-dihidropirrol- 2-ilo, 2,5-dihidropirrol-3-ilo, 4,5-dihidroisoxazol-3-ilo, 2,5-dihidroisoxazol-3-ilo, 2,3-dihidroisoxazol-3-ilo, 4,5-dihidroisoxazol- 4-ilo, 2,5-dihidroisoxazol-4-ilo, 2,3-dihidroisoxazol-4-ilo, 4,5-dihidroisoxazol-5-ilo, 2,5-dihidroisoxazol-5-ilo, 2,3-dihidroisoxazol-5-ilo, 4,5-dihidroisotiazol-3-ilo, 2,5-dihidroisotiazol-3-ilo, 2,3-dihidroisotiazol-3-ilo, 4,5-dihidroisotiazol- 4-ilo, 2,5-dihidroisotiazol-4-ilo, 2,3-dihidroisotiazol-4-ilo, 4,5-dihidroisotiazol-5-ilo, 2,5-dihidroisotiazol-5-ilo, 2,3-dihidroisotiazol-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol- 4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidroimidazol-2-ilo, 2,3-dihidroimidazol-3-ilo, 2,3-dihidroimidazol-4-ilo, 2,3-dihidroimidazol-5-ilo, 4,5-dihidroimidazol-2-ilo, 4,5-dihidroimidazol-4-ilo, 4,5-dihidroimidazol-5-ilo, 2,5-dihidroimidazol-2-ilo, 2,5-dihidroimidazol-4-ilo, 2,5-dihidroimidazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol- 5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 2,3-dihidrotiazol-3-ilo, 2,3-dihidrotiazol- 4-ilo, 2,3-dihidrotiazol-5-ilo, 3,4-dihidrotiazol-3-ilo, 3,4-dihidrotiazol-4-ilo, 3,4-dihidrotiazol-5-ilo, 3,4-dihidrotiazol- 2-ilo, 3,4-dihidrotiazol-3-ilo, 3,4-dihidrotiazol-4-ilo;

55 por ejemplo 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-2-ilo, 1,3-dioxan-4-ilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, 1,3-ditian-2-ilo, 1,3-ditian-4-ilo, 1,4-ditian-2-ilo, 1,3-ditian-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 3-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotiopianilo, 3-tetrahidrotiopianilo, 4-tetrahidro-tiopianilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, tetrahidro-1,3- oxazin-2-ilo, tetrahidro-1,3-oxazin-6-ilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo;

por ejemplo 2H-piran-2-ilo, 2H-piran-3-ilo, 2H-piran-4-ilo, 2H-piran-5-ilo, 2H-piran-6-ilo, 3,6-dihidro-2H-piran-2-ilo, 3,6-dihidro-2H-piran-3-ilo, 3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo, 3,6-dihidro-2H-piran-5-ilo, 3,6-dihidro-2H-piran-6-ilo, 3,4-dihidro-2H-piran-3-ilo, 3,4-dihidro-2H-piran-4-ilo, 3,4-dihidro-2H-piran-6-ilo, 2H-tiopiran-2-ilo, 2H-tiopiran-3-ilo, 2H-tiopiran-4-ilo, 2H-tiopiran-5-ilo, 2H-tiopiran-6-ilo, 5,6-dihidro-4H-1,3-oxazin-2-ilo;

- 5 Las realizaciones preferidas de la invención mencionadas aquí adelante tienen que ser entendidas como que se prefieren ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra.

De acuerdo con una realización preferida de la invención también se da preferencia a aquellas azinas de la fórmula (I), en la que las variables, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra, tienen los siguientes significados:

- 10 Se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es fenilo, que se sustituye por dos a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

- 15 con particular preferencia fenilo, que se sustituye por dos a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

- 20 con especial preferencia fenilo, que se sustituye por dos a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

- 25 también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

con más preferencia fenilo, que se sustituye por dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

- 30 con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

- 35 también con más preferencia fenilo, que se sustituye por tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

también con más preferencia fenilo, que se sustituye por cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

5

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

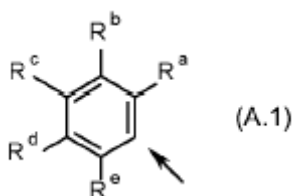
con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN.

10 También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es



en la que

15 R^a y R^e independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo; y

R^b, R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

20 con particular preferencia R^a y R^e independientemente uno del otro son halógeno, CN,

alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; y

R^b, R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia R^a y R^e independientemente uno del otro son halógeno o CN; y

25 R^b, R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con más preferencia R^a y R^e son halógeno; y

R^b, R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno o CN;

aún con más preferencia R^a y R^e son halógeno; y

R^b, R^c y R^d son hidrógeno;

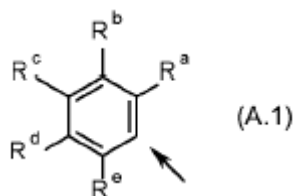
30 también aún con más preferencia R^a, R^b, R^d y R^e son halógeno; y

R^c hidrógeno;

también aún con más preferencia R^a, R^b, R^c, R^d y R^e son halógeno.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es



en la que

5 R^a es halógeno o CN;

R^b y R^d son H, halógeno o CN;

R^c es H o halógeno;

R^e es halógeno, CN o alquilo C₁-C₆;

con particular preferencia R^a es halógeno;

10 R^b , R^c y R^d son H o halógeno; y

R^e es halógeno o CN;

con especial preferencia R^a , R^b , R^d y R^e son halógeno; y

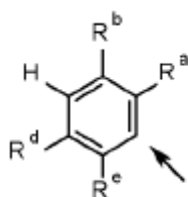
R^c es H o halógeno;

con más preferencia R^a , R^b , R^d y R^e son F; y

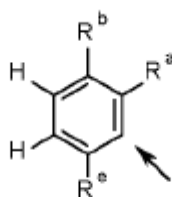
15 R^c es H o F.

Especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que A se selecciona del grupo que consiste de (A.1.1), (A.1.2) y (A.1.3);

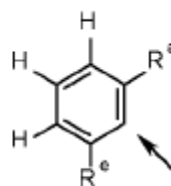
con más preferencia se selecciona del grupo que consiste de (A.1.2) y (A.1.3);



(A.1.1)



(A.1.2)



(A.1.3)

20 en el que

R^a y R^e independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo; y

25 R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia R^a y R^e independientemente uno del otro son halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ; y R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ;

con especial preferencia R^a y R^e independientemente entre sí son halógeno o CN; y R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ;

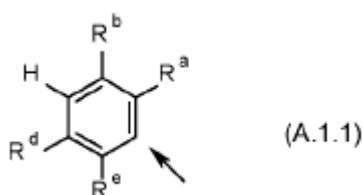
5 con más preferencia R^a y R^e son halógeno; y

R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno o CN;

aún con más preferencia R^a , R^b , R^d y R^e son halógeno.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

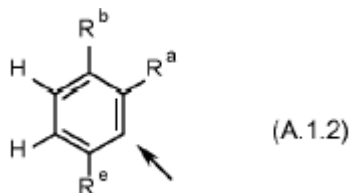
A es



10 en la que R^a , R^b , R^d y R^e tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

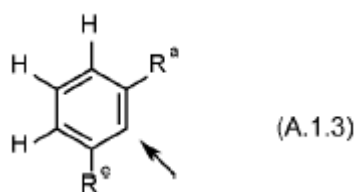
A es



15 en la que R^a , R^b y R^e tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es



20 en la que R^a y R^e tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

25 A es 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , OH, alcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , (alquilo C_1-C_6)sulfinilo, (alquilo

C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

5 con particular preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

10 con especial preferencia 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

15 con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

con más preferencia 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por un sustituyente seleccionando del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

20 con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

25 también con más preferencia 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

30 también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;

35 también con más preferencia 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

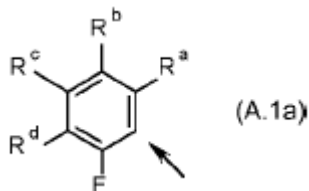
con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;

con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es



5 en la que

R^a es halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, OH, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfinilo, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfonilo, amino, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)-amino, di(alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)amino, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)carbonilo, (alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$)carbonilo; y

10 R^b , R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, OH, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfinilo, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)sulfonilo, amino, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)amino, di(alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)amino, (alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$)carbonilo, (alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$)carbonilo;

con particular preferencia R^a es halógeno, CN, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$; y

R^b , R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$;

15 con especial preferencia R^a es halógeno o CN; y

R^b , R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno, CN, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$;

con más preferencia R^a es halógeno; y

R^b , R^c y R^d independientemente uno del otro son hidrógeno, halógeno o CN;

aún con más preferencia R^a es halógeno; y

20 R^b , R^c y R^d son hidrógeno;

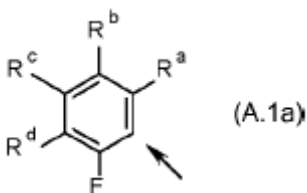
también aún con más preferencia R^a , R^b y R^d son halógeno; y

R^c es hidrógeno;

también aún con más preferencia R^a , R^b , R^c y R^d son halógeno.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

25 A es



en la que

R^a es halógeno, CN o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$;

R^b y R^d son H, halógeno o CN; y

R^c es H o halógeno;

con particular preferencia R^a es halógeno o CN; y

R^b, R^c y R^d son H o halógeno;

5 con especial preferencia R^a, R^b y R^d son halógeno; y

R^c es H o halógeno;

también con especial preferencia R^a, R^b y R^d son halógeno; y

R^c es H, F, Br o I;

con más preferencia R^a, R^b y R^d son F; y

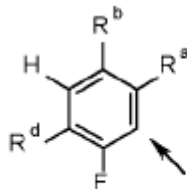
10 R^c es F, Br o I;

también con más preferencia R^a, R^b y R^d son F; y

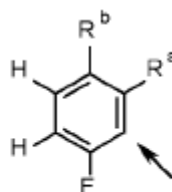
R^c es H o F.

Especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que A se selecciona del grupo que consiste de (A.1a.1), (A.1a.2) y (A.1a.3);

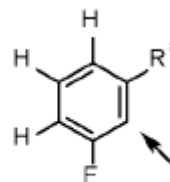
15 con más preferencia se selecciona del grupo que consiste de (A.1.2) y (A.1.3);



(A.1a.1)



(A.1a.2)



(A.1a.3)

en el que

20 R^a es halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfino, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)-amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo; y

R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfino, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

con particular preferencia R^a es halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; y

25 R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia R^a es halógeno o CN; y

R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

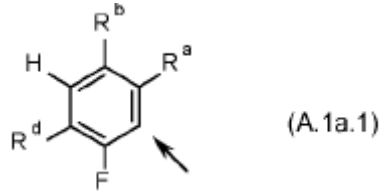
con más preferencia R^a es halógeno; y

R^b y R^d independientemente uno del otro son halógeno o CN;

aún con más preferencia R^a , R^b y R^d son halógeno.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es

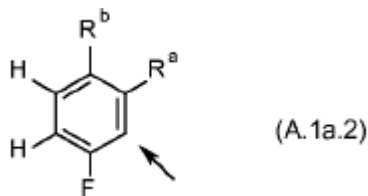


5 en la que

R^a , R^b y R^d tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es

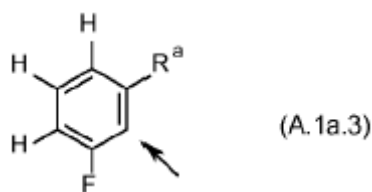


10 en la que

R^a y R^b tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También especialmente se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

A es



15 en la que

R^a tiene los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

R^1 es H, CN, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (alquilo C_1-C_6)carbonilo o (alquilo C_1-C_6)sulfonilo;

20 con particular preferencia H, CN, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (alquilo C_1-C_6)carbonilo o (alquilo C_1-C_6)sulfonilo;

con especial preferencia H, CN, CH_3 , CH_2OCH_3 , OCH_3 , $COCH_3$ o SO_2CH_3 ;

con más preferencia hidrógeno.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

R^2 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ;

con particular preferencia halógeno, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ; también con particular preferencia H, F, Cl, CH_3 o CF_3 .

5 También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

R^3 y R^4 son

independientemente entre sí H, halógeno, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ; o juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 y heterociclilo de tres a seis miembros,

10 en el que el cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 o el heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ;

independientemente entre sí con particular preferencia H, halógeno, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ; o juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de cicloalquilo C_3-C_6 y cicloalqueno C_3-C_6 ,

15 en el que el cicloalquilo C_3-C_6 o cicloalqueno C_3-C_6 es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ;

independientemente entre sí con especial preferencia H, halógeno, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ;

independientemente entre sí con más preferencia H, halógeno o alquilo C_1-C_6 .

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

20 R^2 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 ; y

R^3 y R^4 son independientemente entre sí H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , o juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman a cicloalquilo C_3-C_6 ;

con particular preferencia R^2 es H, halógeno o alquilo C_1-C_6 ; R^3 es alquilo C_1-C_6 ; R^4 es H, halógeno o alquilo C_1-C_6 ; R^3 y R^4 juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman a cicloalquilo C_3-C_6 ;

25 con especial preferencia R^2 es halógeno o alquilo C_1-C_6 ; R^3 es alquilo C_1-C_6 ; R^4 es H o alquilo C_1-C_6 ;

con más preferencia R^2 es halógeno; y R^3 y R^4 son alquilo C_1-C_6 .

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

R^5 es H, CN, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (alquilo C_1-C_6)carbonilo o (alquilo C_1-C_6)sulfonilo;

30 con particular preferencia H, CN, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , (alquilo C_1-C_6)carbonilo o (alquilo C_1-C_6)sulfonilo;

con especial preferencia H, CN, CH_3 , CH_2OCH_3 , OCH_3 , $COCH_3$ o SO_2CH_3 ; con más preferencia hidrógeno.

También se prefieren las azinas de la fórmula (I), en la que

35 A es fenilo, que se sustituye por dos a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ;

con particular preferencia seleccionado de halógeno y CN;

también con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH_3 ;

- con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;
- con particular preferencia fenilo, que se sustituye por dos a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;
- 5 con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;
- con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;
- también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;
- con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;
- 10 con especial preferencia fenilo, que se sustituye por dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;
- con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;
- con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;
- 15 también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;
- con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;
- también con especial preferencia fenilo, que se sustituye por tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;
- 20 con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;
- con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;
- también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;
- con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;
- 25 también con especial preferencia fenilo, que se sustituye por cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;
- con particular preferencia seleccionado del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;
- 30 con especial preferencia seleccionado de halógeno y CN;
- también con especial preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl, CN y CH₃;
- con más preferencia seleccionado del grupo que consiste de F, Cl y CN;
- R¹ es H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo;
- 35 con particular preferencia H, CN, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo;
- con especial preferencia H, CN, CH₃, CH₂OCH₃, OCH₃, COCH₃ o SO₂CH₃;
- con más preferencia hidrógeno. R² es H, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

con particular preferencia halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

también con particular preferencia H, F, CH₃ o CF₃;

R³ y R⁴ son independientemente entre sí H, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

5 juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros,

en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ o el heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

independientemente entre sí con particular preferencia H, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

10 juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de cicloalquilo C₃-C₆ y cicloalquenilo C₃-C₆,

en el que el cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalquenilo C₃-C₆ es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

independientemente entre sí con especial preferencia H, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

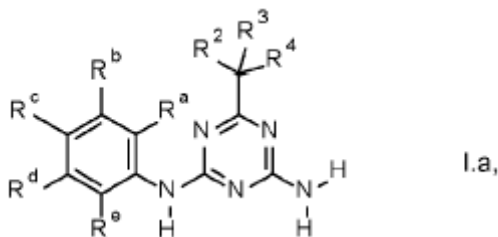
independientemente entre sí con más preferencia H, halógeno o alquilo C₁-C₆;

15 y R⁵ es H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo;

con particular preferencia H, CN, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo;

con especial preferencia H, CN, CH₃, CH₂OCH₃, OCH₃, COCH₃ o SO₂CH₃; con más preferencia hidrógeno.

20 Se da particular preferencia a las azinas de la fórmula (I.a), que corresponden a las azinas de la fórmula (I) en la que A es (A.1) y R¹ y R⁵ son H:



25 en la que las variables R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R³ y R⁴ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las azinas de las fórmulas (I.a.1) a (I.a.1406) de la Tabla A, donde las definiciones de las variables R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R³ y R⁴ son de particular importancia para los compuestos de acuerdo con la invención no solo en combinación una con la otra sino en cada caso también por su cuenta:

Tabla A

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1	F	H	H	H	F	CH ₃	H	H
I.a.2	Cl	H	H	H	F	CH ₃	H	H
I.a.3	Br	H	H	H	F	CH ₃	H	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.4	CN	H	H	H	F	CH ₃	H	H
l.a.5	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	H	H
l.a.6	F	H	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.7	Cl	H	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.8	F	H	H	Cl	F	CH ₃	H	H
l.a.9	Cl	H	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.10	CN	H	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.11	F	H	H	CN	F	CH ₃	H	H
l.a.12	CN	H	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.13	F	H	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.14	Cl	H	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.15	CN	H	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.16	F	F	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.17	Cl	F	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.18	F	Cl	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.19	Cl	F	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.20	CN	F	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.21	F	CN	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.22	CN	F	F	H	F	CH ₃	H	H
l.a.23	F	F	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.24	Cl	F	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.25	F	Cl	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.26	CN	F	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.27	F	CN	H	F	F	CH ₃	H	H
l.a.28	F	F	F	F	F	CH ₃	H	H
l.a.29	Cl	F	F	F	F	CH ₃	H	H
l.a.30	F	Cl	F	F	F	CH ₃	H	H
l.a.31	CN	F	F	F	F	CH ₃	H	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.32	F	CN	F	F	F	CH ₃	H	H
l.a.33	H	F	F	F	F	CH ₃	H	H
l.a.34	F	F	Br	F	F	CH ₃	H	H
l.a.35	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	H	H
l.a.36	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	H	H
l.a.37	F	F	I	F	F	CH ₃	H	H
l.a.38	F	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.39	Cl	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.40	Br	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.41	CN	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.42	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.43	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.44	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.45	F	H	H	Cl	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.46	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.47	CN	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.48	F	H	H	CN	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.49	CN	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.50	F	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.51	Cl	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.52	CN	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.53	F	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.54	Cl	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.55	F	Cl	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.56	Cl	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.57	CN	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.58	F	CN	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.59	CN	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.60	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.61	Cl	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.62	F	Cl	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.63	CN	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.64	F	CN	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.65	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.66	Cl	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.67	F	Cl	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.68	CN	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.69	F	CN	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.70	H	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.71	F	F	Br	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.72	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.73	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.74	F	F	I	F	F	CH ₃	CH ₃	H
l.a.75	F	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.76	Cl	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.77	Br	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.78	CN	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.79	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.80	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.81	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.82	F	H	H	Cl	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.83	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.84	CN	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.85	F	H	H	CN	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.86	CN	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
l.a.87	F	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.88	Cl	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.89	CN	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.90	F	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.91	Cl	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.92	F	Cl	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.93	Cl	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.94	CN	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.95	F	CN	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.96	CN	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.97	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.98	Cl	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.99	F	Cl	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.100	CN	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.101	F	CN	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.102	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.103	Cl	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.104	F	Cl	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.105	CN	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.106	F	CN	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.107	H	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.108	F	F	Br	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.109	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.110	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.111	F	F	I	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.112	F	H	H	H	F	F	F	F
I.a.113	Cl	H	H	H	F	F	F	F
I.a.114	Br	H	H	H	F	F	F	F
I.a.115	CN	H	H	H	F	F	F	F

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.116	CH ₃	H	H	H	F	F	F	F
I.a.117	F	H	H	F	F	F	F	F
I.a.118	Cl	H	H	F	F	F	F	F
I.a.119	F	H	H	Cl	F	F	F	F
I.a.120	Cl	H	H	F	F	F	F	F
I.a.121	CN	H	H	F	F	F	F	F
I.a.122	F	H	H	CN	F	F	F	F
I.a.123	CN	H	H	F	F	F	F	F
I.a.124	F	H	F	H	F	F	F	F
I.a.125	Cl	H	F	H	F	F	F	F
I.a.126	CN	H	F	H	F	F	F	F
I.a.127	F	F	F	H	F	F	F	F
I.a.128	Cl	F	F	H	F	F	F	F
I.a.129	F	Cl	F	H	F	F	F	F
I.a.130	Cl	F	F	H	F	F	F	F
I.a.131	CN	F	F	H	F	F	F	F
I.a.132	F	CN	F	H	F	F	F	F
I.a.133	CN	F	F	H	F	F	F	F
I.a.134	F	F	H	F	F	F	F	F
I.a.135	Cl	F	H	F	F	F	F	F
I.a.136	F	Cl	H	F	F	F	F	F
I.a.137	CN	F	H	F	F	F	F	F
I.a.138	F	CN	H	F	F	F	F	F
I.a.139	F	F	F	F	F	F	F	F
I.a.140	Cl	F	F	F	F	F	F	F
I.a.141	F	Cl	F	F	F	F	F	F
I.a.142	CN	F	F	F	F	F	F	F

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.143	F	CN	F	F	F	F	F	F
I.a.144	H	F	F	F	F	F	F	F
I.a.145	F	F	Br	F	F	F	F	F
I.a.146	F	F	C≡CH	F	F	F	F	F
I.a.147	CF ₃	Cl	H	H	F	F	F	F
I.a.148	F	F	I	F	F	F	F	F
I.a.149	F	H	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.150	Cl	H	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.151	Br	H	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.152	CN	H	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.153	CH ₃	H	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.154	F	H	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.155	Cl	H	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.156	F	H	H	Cl	F	F	CF ₃	F
I.a.157	Cl	H	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.158	CN	H	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.159	F	H	H	CN	F	F	CF ₃	F
I.a.160	CN	H	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.161	F	H	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.162	Cl	H	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.163	CN	H	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.164	F	F	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.165	Cl	F	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.166	F	Cl	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.167	Cl	F	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.168	CN	F	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.169	F	CN	F	H	F	F	CF ₃	F
I.a.170	CN	F	F	H	F	F	CF ₃	F

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.171	F	F	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.172	Cl	F	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.173	F	Cl	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.174	CN	F	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.175	F	CN	H	F	F	F	CF ₃	F
I.a.176	F	F	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.177	Cl	F	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.178	F	Cl	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.179	CN	F	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.180	F	CN	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.181	H	F	F	F	F	F	CF ₃	F
I.a.182	F	F	Br	F	F	F	CF ₃	F
I.a.183	F	F	C=CH	F	F	F	CF ₃	F
I.a.184	CF ₃	Cl	H	H	F	F	CF ₃	F
I.a.185	F	F	I	F	F	F	CF ₃	F
I.a.186	F	H	H	H	F	F	CH ₃	F
I.a.187	Cl	H	H	H	F	F	CH ₃	F
I.a.188	Br	H	H	H	F	F	CH ₃	F
I.a.189	CN	H	H	H	F	F	CH ₃	F
I.a.190	CH ₃	H	H	H	F	F	CH ₃	F
I.a.191	F	H	H	F	F	F	CH ₃	F
I.a.192	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	F
I.a.193	F	H	H	Cl	F	F	CH ₃	F
I.a.194	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	F
I.a.195	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	F
I.a.196	F	H	H	CN	F	F	CH ₃	F
I.a.197	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	F
I.a.198	F	H	F	H	F	F	CH ₃	F

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.199	Cl	H	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.200	CN	H	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.201	F	F	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.202	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.203	F	Cl	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.204	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.205	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.206	F	CN	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.207	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	F
l.a.208	F	F	H	F	F	F	CH ₃	F
l.a.209	Cl	F	H	F	F	F	CH ₃	F
l.a.210	F	Cl	H	F	F	F	CH ₃	F
l.a.211	CN	F	H	F	F	F	CH ₃	F
l.a.212	F	CN	H	F	F	F	CH ₃	F
l.a.213	F	F	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.214	Cl	F	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.215	F	Cl	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.216	CN	F	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.217	F	CN	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.218	H	F	F	F	F	F	CH ₃	F
l.a.219	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	F
l.a.220	F	F	C≡CH	F	F	F	CH ₃	F
l.a.221	CF ₃	Cl	H	H	F	F	CH ₃	F
l.a.222	F	F	I	F	F	F	CH ₃	F
l.a.223	F	H	H	H	F	F	CH ₃	H
l.a.224	Cl	H	H	H	F	F	CH ₃	H
l.a.225	Br	H	H	H	F	F	CH ₃	H
l.a.226	CN	H	H	H	F	F	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.227	CH ₃	H	H	H	F	F	CH ₃	H
l.a.228	F	H	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.229	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.230	F	H	H	Cl	F	F	CH ₃	H
l.a.231	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.232	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.233	F	H	H	CN	F	F	CH ₃	H
l.a.234	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.235	F	H	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.236	Cl	H	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.237	CN	H	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.238	F	F	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.239	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.240	F	Cl	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.241	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.242	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.243	F	CN	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.244	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	H
l.a.245	F	F	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.246	Cl	F	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.247	F	Cl	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.248	CN	F	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.249	F	CN	H	F	F	F	CH ₃	H
l.a.250	F	F	F	F	F	F	CH ₃	H
l.a.251	Cl	F	F	F	F	F	CH ₃	H
l.a.252	F	Cl	F	F	F	F	CH ₃	H
l.a.253	CN	F	F	F	F	F	CH ₃	H
l.a.254	F	CN	F	F	F	F	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.255	H	F	F	F	F	F	CH ₃	H
l.a.256	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	H
l.a.257	F	F	C=CH	F	F	F	CH ₃	H
l.a.258	CF ₃	Cl	H	H	F	F	CH ₃	H
l.a.259	F	F	I	F	F	F	CH ₃	H
l.a.260	F	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.261	Cl	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.262	Br	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.263	CN	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.264	CH ₃	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.265	F	H	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.266	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.267	F	H	H	Cl	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.268	Cl	H	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.269	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.270	F	H	H	CN	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.271	CN	H	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.272	F	H	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.273	Cl	H	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.274	CN	H	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.275	F	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.276	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.277	F	Cl	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.278	Cl	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.279	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.280	F	CN	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.281	CN	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.282	F	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.283	Cl	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.284	F	Cl	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.285	CN	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.286	F	CN	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.287	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.288	Cl	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.289	F	Cl	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.290	CN	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.291	F	CN	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.292	H	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.293	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.294	F	F	C≡CH	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.295	CF ₃	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.296	F	F	I	F	F	F	CH ₃	CH ₃
l.a.297	F	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.298	Cl	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.299	Br	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.300	CN	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.301	CH ₃	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.302	F	H	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.303	Cl	H	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.304	F	H	H	Cl	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.305	Cl	H	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.306	CN	H	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.307	F	H	H	CN	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.308	CN	H	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.309	F	H	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
l.a.310	Cl	H	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.311	CN	H	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.312	F	F	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.313	Cl	F	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.314	F	Cl	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.315	Cl	F	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.316	CN	F	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.317	F	CN	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.318	CN	F	F	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.319	F	F	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.320	Cl	F	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.321	F	Cl	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.322	CN	F	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.323	F	CN	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.324	F	F	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.325	Cl	F	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.326	F	Cl	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.327	CN	F	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.328	F	CN	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.329	H	F	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.330	F	F	Br	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.331	F	F	C=CH	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.332	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.333	F	F	I	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
I.a.334	F	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.335	Cl	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.336	Br	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.337	CN	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.338	CH ₃	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.339	F	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.340	Cl	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.341	F	H	H	Cl	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.342	Cl	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.343	CN	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.344	F	H	H	CN	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.345	CN	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.346	F	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.347	Cl	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.348	CN	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.349	F	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.350	Cl	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.351	F	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.352	Cl	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.353	CN	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.354	F	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.355	CN	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.356	F	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.357	Cl	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.358	F	Cl	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.359	CN	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.360	F	CN	H	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.361	F	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.362	Cl	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.363	F	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.364	CN	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.365	F	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.366	H	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.367	F	F	Br	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.368	F	F	C≡CH	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.369	CF ₃	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.370	F	F	I	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃
l.a.371	F	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.372	Cl	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.373	Br	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.374	CN	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.375	CH ₃	H	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.376	F	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.377	Cl	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.378	F	H	H	Cl	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.379	Cl	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.380	CN	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.381	F	H	H	CN	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.382	CN	H	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.383	F	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.384	Cl	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.385	CN	H	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.386	F	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.387	Cl	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.388	F	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.389	Cl	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.390	CN	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.391	F	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.392	CN	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.393	F	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.394	Cl	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.395	F	Cl	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.396	CN	F	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.397	F	CN	H	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.398	F	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.399	Cl	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.400	F	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.401	CN	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.402	F	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.403	H	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.404	F	F	Br	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.405	F	F	C=CH	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.406	CF ₃	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.407	F	F	I	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
l.a.408	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.409	Cl	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.410	Br	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.411	CN	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.412	CH ₃	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.413	F	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.414	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.415	F	H	H	Cl	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.416	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.417	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.418	F	H	H	CN	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.419	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.420	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.421	Cl	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.422	CN	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.423	F	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.424	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.425	F	Cl	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.426	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.427	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.428	F	CN	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.429	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.430	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.431	Cl	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.432	F	Cl	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.433	CN	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.434	F	CN	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.435	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.436	Cl	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.437	F	Cl	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.438	CN	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.439	F	CN	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.440	H	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.441	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.442	F	F	C=CH	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.443	CF ₃	Cl	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.444	F	F	I	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.445	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.446	Cl	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.447	Br	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.448	CN	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.449	CH ₃	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.450	F	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.451	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.452	F	H	H	Cl	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.453	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.454	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.455	F	H	H	CN	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.456	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.457	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.458	Cl	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.459	CN	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.460	F	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.461	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.462	F	Cl	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.463	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.464	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.465	F	CN	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.466	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.467	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.468	Cl	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.469	F	Cl	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.470	CN	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.471	F	CN	H	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.472	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.473	Cl	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.474	F	Cl	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.475	CN	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.476	F	CN	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.477	H	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.478	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.479	F	F	C=CH	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.480	CF ₃	Cl	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.481	F	F	I	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.482	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.483	Cl	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.484	Br	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.485	CN	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.486	CH ₃	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.487	F	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.488	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.489	F	H	H	Cl	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.490	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.491	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.492	F	H	H	CN	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.493	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.494	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.495	Cl	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.496	CN	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.497	F	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.498	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.499	F	Cl	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.500	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.501	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.502	F	CN	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.503	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.504	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.505	Cl	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.506	F	Cl	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.507	CN	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.508	F	CN	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.509	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.510	Cl	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.511	F	Cl	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.512	CN	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.513	F	CN	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.514	H	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.515	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.516	F	F	C=CH	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.517	CF ₃	Cl	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.518	F	F	I	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.519	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.520	Cl	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.521	Br	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.522	CN	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.523	CH ₃	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.524	F	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.525	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.526	F	H	H	Cl	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.527	Cl	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.528	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.529	F	H	H	CN	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.530	CN	H	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.531	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.532	Cl	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.533	CN	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.534	F	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.535	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.536	F	Cl	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.537	Cl	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.538	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.539	F	CN	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.540	CN	F	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.541	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.542	Cl	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.543	F	Cl	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.544	CN	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.545	F	CN	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.546	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.547	Cl	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.548	F	Cl	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.549	CN	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.550	F	CN	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.551	H	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.552	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.553	F	F	C=CH	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.554	CF ₃	Cl	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.555	F	F	I	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.556	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.557	Cl	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.558	Br	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.559	CN	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.560	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.561	F	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.562	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.563	F	H	H	Cl	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.564	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.565	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.566	F	H	H	CN	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.567	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.568	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.569	Cl	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.570	CN	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.571	F	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.572	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.573	F	Cl	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.574	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.575	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.576	F	CN	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.577	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.578	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.579	Cl	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.580	F	Cl	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.581	CN	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.582	F	CN	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.583	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.584	Cl	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.585	F	Cl	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.586	CN	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.587	F	CN	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.588	H	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.589	F	F	Br	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.590	F	F	C≡CH	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.591	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.592	F	F	I	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.593	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.594	Cl	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.595	Br	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.596	CN	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.597	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.598	F	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.599	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.600	F	H	H	Cl	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.601	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.602	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.603	F	H	H	CN	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.604	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.605	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.606	Cl	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.607	CN	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.608	F	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.609	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.610	F	Cl	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.611	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.612	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.613	F	CN	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.614	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.615	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.616	Cl	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.617	F	Cl	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.618	CN	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.619	F	CN	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.620	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.621	Cl	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.622	F	Cl	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.623	CN	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.624	F	CN	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.625	H	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.626	F	F	Br	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.627	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.628	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.629	F	F	I	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.630	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.631	Cl	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.632	Br	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.633	CN	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.634	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.635	F	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.636	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.637	F	H	H	Cl	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.638	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.639	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.640	F	H	H	CN	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.641	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.642	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.643	Cl	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.644	CN	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.645	F	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.646	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.647	F	Cl	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.648	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.649	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.650	F	CN	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.651	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.652	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.653	Cl	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.654	F	Cl	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.655	CN	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.656	F	CN	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.657	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.658	Cl	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.659	F	Cl	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.660	CN	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.661	F	CN	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.662	H	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.663	F	F	Br	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.664	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.665	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.666	F	F	I	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.667	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.668	Cl	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.669	Br	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.670	CN	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.671	CH ₃	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.672	F	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.673	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.674	F	H	H	Cl	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.675	Cl	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.676	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.677	F	H	H	CN	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.678	CN	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.679	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.680	Cl	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.681	CN	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.682	F	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.683	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.684	F	Cl	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.685	Cl	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.686	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.687	F	CN	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.688	CN	F	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.689	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.690	Cl	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.691	F	Cl	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.692	CN	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.693	F	CN	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.694	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.695	Cl	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.696	F	Cl	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.697	CN	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.698	F	CN	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.699	H	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.700	F	F	Br	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.701	F	F	C=CH	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.702	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.703	F	F	I	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.704	F	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.705	Cl	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.706	Br	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.707	CN	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.708	CH ₃	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.709	F	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.710	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.711	F	H	H	Cl	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.712	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.713	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.714	F	H	H	CN	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.715	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.716	F	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.717	Cl	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.718	CN	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.719	F	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.720	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.721	F	Cl	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.722	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.723	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.724	F	CN	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.725	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.726	F	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.727	Cl	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.728	F	Cl	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.729	CN	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.730	F	CN	H	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.731	F	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.732	Cl	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.733	F	Cl	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.734	CN	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.735	F	CN	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.736	H	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.737	F	F	Br	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.738	F	F	C=CH	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.739	CF ₃	Cl	H	H	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.740	F	F	I	F	F	F	-(CH ₂) ₂ -	
l.a.741	F	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.742	Cl	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.743	Br	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.744	CN	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.745	CH ₃	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.746	F	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.747	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.748	F	H	H	Cl	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.749	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.750	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.751	F	H	H	CN	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.752	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.753	F	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.754	Cl	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.755	CN	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.756	F	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.757	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.758	F	Cl	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.759	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.760	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.761	F	CN	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.762	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.763	F	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.764	Cl	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.765	F	Cl	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.766	CN	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.767	F	CN	H	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.768	F	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.769	Cl	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.770	F	Cl	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.771	CN	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.772	F	CN	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.773	H	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.774	F	F	Br	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.775	F	F	C=CH	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.776	CF ₃	Cl	H	H	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.777	F	F	I	F	F	F	-(CH ₂) ₃ -	
l.a.778	F	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.779	Cl	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.780	Br	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.781	CN	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.782	CH ₃	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.783	F	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.784	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.785	F	H	H	Cl	F	F	-(CH ₂) ₄ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.786	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.787	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.788	F	H	H	CN	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.789	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.790	F	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.791	Cl	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.792	CN	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.793	F	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.794	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.795	F	Cl	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.796	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.797	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.798	F	CN	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.799	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.800	F	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.801	Cl	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.802	F	Cl	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.803	CN	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.804	F	CN	H	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.805	F	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.806	Cl	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.807	F	Cl	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.808	CN	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.809	F	CN	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.810	H	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.811	F	F	Br	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.812	F	F	C=CH	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.813	CF ₃	Cl	H	H	F	F	-(CH ₂) ₄ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.814	F	F	I	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.815	F	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.816	Cl	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.817	Br	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.818	CN	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.819	CH ₃	H	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.820	F	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.821	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.822	F	H	H	Cl	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.823	Cl	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.824	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.825	F	H	H	CN	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.826	CN	H	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.827	F	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.828	Cl	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.829	CN	H	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.830	F	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.831	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.832	F	Cl	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.833	Cl	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.834	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.835	F	CN	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.836	CN	F	F	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.837	F	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.838	Cl	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.839	F	Cl	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.840	CN	F	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.841	F	CN	H	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.842	F	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.843	Cl	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.844	F	Cl	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.845	CN	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.846	F	CN	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.847	H	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.848	F	F	Br	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.849	F	F	C=CH	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.850	CF ₃	Cl	H	H	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.851	F	F	I	F	F	F	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.852	F	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.853	Cl	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.854	Br	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.855	CN	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.856	CH ₃	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.857	F	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.858	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.859	F	H	H	Cl	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.860	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.861	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.862	F	H	H	CN	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.863	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.864	F	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.865	Cl	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.866	CN	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.867	F	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.868	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.869	F	Cl	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.870	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.871	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.872	F	CN	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.873	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.874	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.875	Cl	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.876	F	Cl	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.877	CN	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.878	F	CN	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.879	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.880	Cl	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.881	F	Cl	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.882	CN	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.883	F	CN	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.884	H	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.885	F	F	Br	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.886	F	F	C=CH	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.887	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.888	F	F	I	F	F	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
I.a.889	F	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.890	Cl	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.891	Br	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.892	CN	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.893	CH ₃	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.894	F	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.895	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.896	F	H	H	Cl	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.897	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.898	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.899	F	H	H	CN	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.900	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.901	F	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.902	Cl	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.903	CN	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.904	F	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.905	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.906	F	Cl	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.907	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.908	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.909	F	CN	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.910	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.911	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.912	Cl	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.913	F	Cl	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.914	CN	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.915	F	CN	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.916	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.917	Cl	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.918	F	Cl	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.919	CN	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.920	F	CN	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.921	H	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.922	F	F	Br	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.923	F	F	C=CH	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.924	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.925	F	F	I	F	F	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
I.a.926	F	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.927	Cl	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.928	Br	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.929	CN	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.930	CH ₃	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.931	F	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.932	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.933	F	H	H	Cl	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.934	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.935	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.936	F	H	H	CN	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.937	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.938	F	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.939	Cl	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.940	CN	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.941	F	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.942	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.943	F	Cl	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.944	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.945	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.946	F	CN	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.947	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.948	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.949	Cl	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.950	F	Cl	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
I.a.951	CN	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
l.a.952	F	CN	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.953	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.954	Cl	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.955	F	Cl	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.956	CN	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.957	F	CN	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.958	H	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.959	F	F	Br	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.960	F	F	C=CH	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.961	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.962	F	F	I	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
l.a.963	F	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.964	Cl	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.965	Br	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.966	CN	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.967	CH ₃	H	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.968	F	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.969	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.970	F	H	H	Cl	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.971	Cl	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.972	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.973	F	H	H	CN	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.974	CN	H	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.975	F	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.976	Cl	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.977	CN	H	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.978	F	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
l.a.979	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.980	F	Cl	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.981	Cl	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.982	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.983	F	CN	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.984	CN	F	F	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.985	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.986	Cl	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.987	F	Cl	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.988	CN	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.989	F	CN	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.990	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.991	Cl	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.992	F	Cl	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.993	CN	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.994	F	CN	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.995	H	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.996	F	F	Br	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.997	F	F	C=CH	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.998	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.999	F	F	I	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
I.a.1000	F	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1001	Cl	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1002	Br	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1003	CN	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1004	CH ₃	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1005	F	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1006	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1007	F	H	H	Cl	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1008	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1009	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1010	F	H	H	CN	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1011	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1012	F	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1013	Cl	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1014	CN	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1015	F	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1016	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1017	F	Cl	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1018	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1019	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1020	F	CN	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1021	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1022	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1023	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1024	F	Cl	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1025	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1026	F	CN	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1027	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1028	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1029	F	Cl	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1030	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1031	F	CN	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1032	H	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1033	F	F	Br	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1034	F	F	C≡CH	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1035	CF ₃	Cl	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1036	F	F	I	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H
I.a.1037	F	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1038	Cl	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1039	Br	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1040	CN	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1041	CH ₃	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1042	F	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1043	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1044	F	H	H	Cl	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1045	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1046	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1047	F	H	H	CN	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1048	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1049	F	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1050	Cl	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1051	CN	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1052	F	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1053	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1054	F	Cl	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1055	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1056	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1057	F	CN	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1058	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1059	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1060	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1061	F	Cl	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1062	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1063	F	CN	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1064	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1065	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1066	F	Cl	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1067	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1068	F	CN	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1069	H	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1070	F	F	Br	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1071	F	F	C=CH	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1072	CF ₃	Cl	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1073	F	F	I	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
I.a.1074	F	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1075	Cl	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1076	Br	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1077	CN	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1078	CH ₃	H	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1079	F	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1080	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1081	F	H	H	Cl	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1082	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1083	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1084	F	H	H	CN	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1085	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1086	F	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1087	Cl	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1088	CN	H	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1089	F	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1090	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1091	F	Cl	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1092	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1093	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1094	F	CN	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1095	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1096	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1097	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1098	F	Cl	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1099	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1100	F	CN	H	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1101	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1102	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1103	F	Cl	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1104	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1105	F	CN	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1106	H	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1107	F	F	Br	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1108	F	F	C≡CH	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1109	CF ₃	Cl	H	H	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1110	F	F	I	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
I.a.1111	F	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1112	Cl	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1113	Br	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1114	CN	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1115	CH ₃	H	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1116	F	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1117	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1118	F	H	H	Cl	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1119	Cl	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1120	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1121	F	H	H	CN	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1122	CN	H	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1123	F	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1124	Cl	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1125	CN	H	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1126	F	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1127	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1128	F	Cl	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1129	Cl	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1130	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1131	F	CN	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1132	CN	F	F	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1133	F	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1134	Cl	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1135	F	Cl	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1136	CN	F	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1137	F	CN	H	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1138	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1139	Cl	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1140	F	Cl	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1141	CN	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1142	F	CN	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1143	H	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1144	F	F	Br	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1145	F	F	C≡CH	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1146	CF ₃	Cl	H	H	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
I.a.1147	F	F	I	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1148	F	H	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1149	Cl	H	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1150	Br	H	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1151	CN	H	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1152	CH ₃	H	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1153	F	H	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1154	Cl	H	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1155	F	H	H	Cl	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1156	Cl	H	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1157	CN	H	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1158	F	H	H	CN	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1159	CN	H	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1160	F	H	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1161	Cl	H	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1162	CN	H	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1163	F	F	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1164	Cl	F	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1165	F	Cl	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1166	Cl	F	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1167	CN	F	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1168	F	CN	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1169	CN	F	F	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1170	F	F	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1171	Cl	F	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1172	F	Cl	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1173	CN	F	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1174	F	CN	H	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1175	F	F	F	F	F	Cl	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1176	Cl	F	F	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1177	F	Cl	F	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1178	CN	F	F	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1179	F	CN	F	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1180	H	F	F	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1181	F	F	Br	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1182	F	F	C≡CH	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1183	CF ₃	Cl	H	H	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1184	F	F	I	F	F	Cl	CH ₃	H
I.a.1185	F	H	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1186	Cl	H	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1187	Br	H	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1188	CN	H	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1189	CH ₃	H	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1190	F	H	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1191	Cl	H	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1192	F	H	H	Cl	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1193	Cl	H	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1194	CN	H	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1195	F	H	H	CN	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1196	CN	H	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1197	F	H	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1198	Cl	H	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1199	CN	H	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1200	F	F	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1201	Cl	F	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1202	F	Cl	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1203	Cl	F	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1204	CN	F	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1205	F	CN	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1206	CN	F	F	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1207	F	F	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1208	Cl	F	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1209	F	Cl	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1210	CN	F	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1211	F	CN	H	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1212	F	F	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1213	Cl	F	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1214	F	Cl	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1215	CN	F	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1216	F	CN	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1217	H	F	F	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1218	F	F	Br	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1219	F	F	C=CH	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1220	CF ₃	Cl	H	H	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1221	F	F	I	F	F	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
I.a.1222	F	H	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1223	Cl	H	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1224	Br	H	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1225	CN	H	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1226	CH ₃	H	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1227	F	H	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1228	Cl	H	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1229	F	H	H	Cl	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1230	Cl	H	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1231	CN	H	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1232	F	H	H	CN	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1233	CN	H	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1234	F	H	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1235	Cl	H	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1236	CN	H	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1237	F	F	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1238	Cl	F	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1239	F	Cl	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1240	Cl	F	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1241	CN	F	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1242	F	CN	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1243	CN	F	F	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1244	F	F	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1245	Cl	F	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1246	F	Cl	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1247	CN	F	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1248	F	CN	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1249	F	F	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1250	Cl	F	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1251	F	Cl	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1252	CN	F	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1253	F	CN	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1254	H	F	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1255	F	F	Br	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1256	F	F	C≡CH	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1257	CF ₃	Cl	H	H	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1258	F	F	I	F	F	CN	CH ₃	CH ₃
I.a.1259	F	H	H	H	F	OCH ₃	H	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1260	Cl	H	H	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1261	Br	H	H	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1262	CN	H	H	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1263	CH ₃	H	H	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1264	F	H	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1265	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1266	F	H	H	Cl	F	OCH ₃	H	H
I.a.1267	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1268	CN	H	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1269	F	H	H	CN	F	OCH ₃	H	H
I.a.1270	CN	H	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1271	F	H	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1272	Cl	H	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1273	CN	H	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1274	F	F	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1275	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1276	F	Cl	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1277	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1278	CN	F	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1279	F	CN	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1280	CN	F	F	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1281	F	F	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1282	Cl	F	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1283	F	Cl	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1284	CN	F	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1285	F	CN	H	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1286	F	F	F	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1287	Cl	F	F	F	F	OCH ₃	H	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1288	F	Cl	F	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1289	CN	F	F	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1290	F	CN	F	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1291	H	F	F	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1292	F	F	Br	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1293	F	F	C=CH	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1294	CF ₃	Cl	H	H	F	OCH ₃	H	H
I.a.1295	F	F	I	F	F	OCH ₃	H	H
I.a.1296	F	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1297	Cl	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1298	Br	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1299	CN	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1300	CH ₃	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1301	F	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1302	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1303	F	H	H	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1304	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1305	CN	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1306	F	H	H	CN	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1307	CN	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1308	F	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1309	Cl	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1310	CN	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1311	F	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1312	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1313	F	Cl	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1314	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1315	CN	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1316	F	CN	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1317	CN	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1318	F	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1319	Cl	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1320	F	Cl	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1321	CN	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1322	F	CN	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1323	F	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1324	Cl	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1325	F	Cl	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1326	CN	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1327	F	CN	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1328	H	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1329	F	F	Br	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1330	F	F	C=CH	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1331	CF ₃	Cl	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1332	F	F	I	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
I.a.1333	F	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1334	Cl	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1335	Br	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1336	CN	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1337	CH ₃	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1338	F	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1339	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1340	F	H	H	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1341	Cl	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1342	CN	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1343	F	H	H	CN	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1344	CN	H	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1345	F	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1346	Cl	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1347	CN	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1348	F	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1349	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1350	F	Cl	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1351	Cl	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1352	CN	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1353	F	CN	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1354	CN	F	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1355	F	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1356	Cl	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1357	F	Cl	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1358	CN	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1359	F	CN	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1360	F	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1361	Cl	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1362	F	Cl	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1363	CN	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1364	F	CN	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1365	H	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1366	F	F	Br	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1367	F	F	C=CH	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1368	CF ₃	Cl	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
I.a.1369	F	F	I	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃

ES 2 599 779 T3

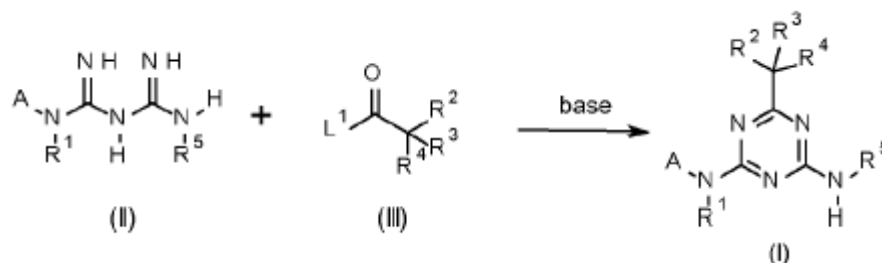
No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1370	F	H	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1371	Cl	H	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1372	Br	H	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1373	CN	H	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1374	CH ₃	H	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1375	F	H	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1376	Cl	H	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1377	F	H	H	Cl	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1378	Cl	H	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1379	CN	H	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1380	F	H	H	CN	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1381	CN	H	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1382	F	H	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1383	Cl	H	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1384	CN	H	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1385	F	F	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1386	Cl	F	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1387	F	Cl	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1388	Cl	F	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1389	CN	F	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1390	F	CN	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1391	CN	F	F	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1392	F	F	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1393	Cl	F	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1394	F	Cl	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1395	CN	F	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1396	F	CN	H	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1397	F	F	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
I.a.1398	Cl	F	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1399	F	Cl	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1400	CN	F	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1401	F	CN	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1402	H	F	F	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1403	F	F	Br	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1404	F	F	C=CH	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1405	CF ₃	Cl	H	H	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	
I.a.1406	F	F	I	F	F	H	-O(CH ₂) ₃ -	

Las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden preparar mediante procesos estándar de química orgánica, por ejemplo mediante los siguientes procesos:

Proceso A)

- 5 Las azinas de la fórmula (I), en la que R¹ y R⁵ son independientemente entre sí H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆- alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆ se pueden preparar al hacer reaccionar biguanidinas de la fórmula (II) con compuestos de carbonilo de la fórmula (III) en la presencia de una base:



- 10 Las variables A, R², R³ y R⁴ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como en la fórmula (I) mencionada anteriormente, y

L¹ es un grupo saliente nucleófilo desplazable tal como halógeno, CN, alcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆ o alcoxycarbonilo C₁-C₆;

preferiblemente halógeno o alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia Cl o alcoxi C₁-C₆,

- 15 también con particular preferencia halógeno;

con especial preferencia Cl;

R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

con más preferencia hidrógeno; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

5 con más preferencia hidrógeno.

La reacción de biguanidinas de la fórmula (II) con compuestos de carbonilo de la fórmula (III) usualmente se lleva a cabo a temperaturas des 50°C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente desde 50°C hasta 200°C (por ejemplo R. Sathunuru et al., J. Heterocycl. Chem. 2008, 45, 1673-1678).

10 La reacción se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

En una realización del proceso de acuerdo con la invención, las biguanidinas de la fórmula (II) y los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) se utilizan en cantidades equimolares.

En otra realización del proceso de acuerdo con la invención, los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) se utilizan en exceso con respecto a las biguanidinas de la fórmula (II).

15 Preferiblemente la relación molar de los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) con las biguanidinas de la fórmula (II) está en el rango desde 1.5:1 a 1:1, preferiblemente 1.2:1 a 1:1, con especial preferencia 1.2:1, también con especial preferencia 1:1.

20 La reacción de las biguanidinas de la fórmula (II) con los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) se lleva a cabo en un solvente orgánico. En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver las biguanidinas de la fórmula (II) y los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción.

25 Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano, nitrometano y mezclas de alcanos C₅-C₈; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, clorobenceno, tolueno, cresoles, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno, éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter (TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF), nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, así como también solventes apróticos dipolares tales como sulfolano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida (DMAC), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), N,N'-dimetilpropileno urea (DMPU), sulfóxido de dimetilo (DMSO) y 1-metil-2 pirrolidinona (NMP).

30 Los solventes preferidos son éteres y solventes apróticos dipolares como se definió anteriormente.

Con más preferencia los solventes son éteres como se definió anteriormente.

El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

La reacción de las biguanidinas de la fórmula (II) con los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) se lleva a cabo en la presencia de una base.

35 Ejemplos de bases adecuadas incluyen bases que contienen metal y bases que contienen nitrógeno. Ejemplos de bases que contienen metal adecuadas son compuestos inorgánicos tales como óxido de metal alcalino o metal alcalinotérreo, y otros óxidos de metal, tales como óxido de litio, óxido de sodio, óxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio y óxido de magnesio, óxido de hierro, óxido de plata; hidruros de metal alcalino y metal alcalinotérreo tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y hidruro de calcio, amidas de metal alcalino tales como amida de litio, amida de sodio y amida de potasio, carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de magnesio, y carbonato de calcio, así como también hidrógeno carbonatos de metales alcalinos (bicarbonatos) tales como hidrógeno carbonato de litio, hidrógeno carbonato de sodio, hidrógeno carbonato de potasio; fosfatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como fosfato de sodio, fosfato de potasio y fosfato de calcio; y
40 adicionalmente bases orgánicas, tales como aminas terciarias tales como tri-alquilaminas C₁-C₆, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, N-etildisopropilamina, y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas tales como
45

colidina, lutidina, N-metilmorfolina y 4-dimetilaminopiridina (DMAP), y también aminas bicíclicas tales como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU) o 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN).

Las bases preferidas son tri-alquilaminas C₁-C₆ como se definió anteriormente.

5 El término base como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más, preferiblemente dos de los compuestos anteriores. Se da particular preferencia al uso de una base.

Las bases en general se emplean en exceso; sin embargo también se pueden emplear en cantidades equimolares, o, si es apropiado, se pueden utilizar como solvente.

Preferiblemente desde 1 hasta 5 equivalentes de base, con particular preferencia se utilizan 3 equivalentes de base, con base en las biguanidinas de la fórmula (II).

10 El experto puede determinar fácilmente el fin de la reacción por medio de métodos de rutina.

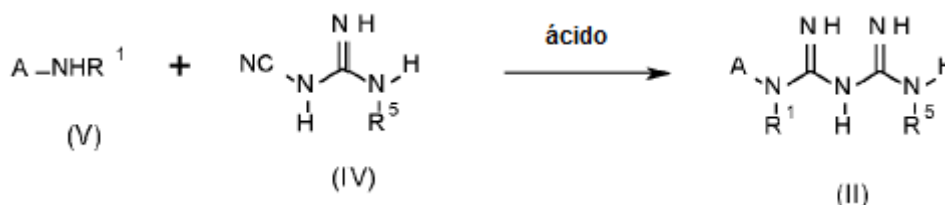
Las mezclas de reacción se tratan finalmente en una forma habitual, por ejemplo al mezclar con agua, separación de las fases y, si es apropiado, purificación cromatográfica del producto crudo.

Algunos de los intermedios y productos finales se obtienen en la forma de aceites viscosos, que se pueden purificar o liberar de componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura moderadamente elevada.

15 Si los intermedios y los productos finales se obtienen como sólido, la purificación también se puede llevar a cabo mediante recristalización o digestión.

Los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) requeridos para la preparación de azinas de la fórmula (I) se conocen en la técnica o se pueden preparar de acuerdo con y/o están disponibles comercialmente.

20 Las biguanidinas de la fórmula (II) requeridas para la preparación de azinas de la fórmula (I), en la que R¹ y R⁵ son independientemente entre sí H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, se pueden preparar al hacer reaccionar guanidinas de la fórmula (IV) con aminas de la fórmula (V) en la presencia de un ácido:



La variable A tiene los significados, en particular los significados preferidos, como en la fórmula (I) mencionada anteriormente;

25 R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

con más preferencia hidrógeno; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

30 con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

con más preferencia hidrógeno.

La reacción de guanidinas de la fórmula (IV) con aminas de la fórmula (V) usualmente se lleva a cabo desde 50°C hasta 150° C, preferiblemente desde 80°C hasta 130°C.

Se utiliza tecnología de Microondas cuando sea aplicable (por ejemplo C.O. Kappe, A. Stadler, *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry*, Weinheim 2012).

La reacción se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

- 5 En una realización del proceso de acuerdo con la invención, las guanidinas de la fórmula (IV) y las aminas de la fórmula (V) se utilizan en cantidades equimolares.

En otra realización del proceso de acuerdo con la invención, las aminas de la fórmula (V) se utilizan en exceso con respecto a las guanidinas de la fórmula (IV).

- 10 Preferiblemente la relación molar de las aminas de la fórmula (V) con las guanidinas de la fórmula (IV) está en el rango desde 2:1 a 1:1, preferiblemente 1.5:1 a 1:1, con especial preferencia 1:1.

La reacción de las guanidinas de la fórmula (IV) con las aminas de la fórmula (V) se lleva a cabo en un solvente orgánico. En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver las guanidinas de la fórmula (IV) y las aminas de la fórmula (V) por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción.

- 15 Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano, nitrometano y mezclas de alcanos C₅-C₈, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, clorobenceno, tolueno, cresoles, o-, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno, éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter (TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF), ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, así como también solventes apróticos dipolares tales como sulfolano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida (DMAC), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), N,N'-dimetilpropileno urea (DMPU), sulfóxido de dimetilo (DMSO) y 1-metil-2-pirrolidinona (NMP).

Los solventes preferidos son éteres, nitrilos y solventes apróticos dipolares como se definió anteriormente.

Con más preferencia los solventes son nitrilos como se definió anteriormente.

- 25 El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

La reacción de las guanidinas de la fórmula (IV) con las aminas de la fórmula (V) se lleva a cabo en la presencia de un ácido.

- 30 Como ácidos y catalizadores de ácido se pueden utilizar ácidos inorgánicos como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido yodhídrico, ácido fosfórico, ácido sulfúrico; ácidos minerales, tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácidos de Lewis, tales como trifluoruro de boro, cloruro de aluminio, cloruro férrico III, cloruro de estaño IV, cloruro de titanio IV y cloruro de zinc II, así como ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido metilbencensulfónico, ácido bencensulfónico, ácido canforsulfónico, ácido cítrico y ácido trifluoroacético.

Los ácidos en general se emplean en exceso o, si es apropiado, se pueden utilizar como solvente.

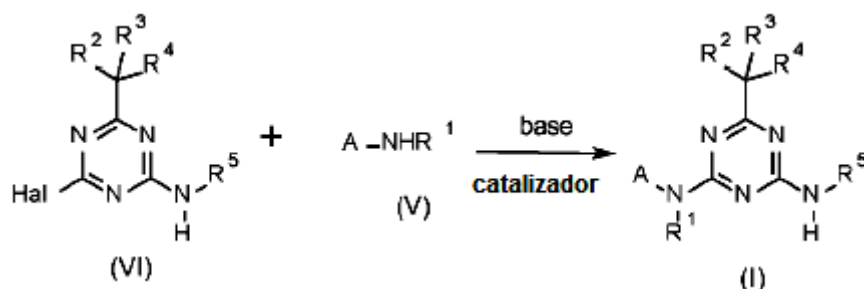
- 35 El tratamiento final se puede llevar a cabo en una forma conocida.

Las guanidinas de la fórmula (IV) requeridas para la preparación de biguanidinas de la fórmula (II) están disponibles comercialmente o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos de la literatura (por ejemplo J.L. LaMattina et al., *J. Med. Chem.* 1990, 33, 543 - 552; A. Perez-Medrano et al., *J. Med. Chem.* 2009, 52, 3366 - 3376).

- 40 Las aminas de la fórmula (V) requeridas para la preparación de biguanidinas de la fórmula (II) están disponibles comercialmente.

Proceso B)

Las azinas de la fórmula (I), en la que R¹ y R⁵ son independientemente entre sí H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆- alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, también se pueden preparar al hacer reaccionar halotriazinas de la fórmula (VI) con aminas de la fórmula (V) en la presencia de una base y un catalizador:



Las variables A, R², R³ y R⁴ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como en la fórmula (I) mencionada anteriormente;

Hal es halógeno;

5 preferiblemente Cl o Br;

con particular preferencia Cl;

R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

10 con más preferencia hidrógeno; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

con más preferencia hidrógeno.

15 La reacción de las halotriazinas de la fórmula (VI) con las aminas de la fórmula (V) usualmente se lleva a cabo desde 50°C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente desde 50°C hasta 150°C, particularmente preferiblemente desde 60°C hasta 100°C, en un solvente orgánico inerte (por ejemplo P. Dao et al., Tetrahedron 2012, 68, 3856 - 3860).

20 La reacción se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado, bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

En una realización del proceso de acuerdo con la invención, las halotriazinas de la fórmula (VI) y las aminas de la fórmula (V) se utilizan en cantidades equimolares.

En otra realización del proceso de acuerdo con la invención, las aminas de la fórmula (V) se utilizan en exceso con respecto a las halotriazinas de la fórmula (VI).

25 Preferiblemente la relación molar de las aminas de la fórmula (V) con las halotriazinas de la fórmula (VI) está en el rango desde 2:1 a 1:1, preferiblemente 1.5:1 a 1:1, con especial preferencia 1.2:1.

30 La reacción de las halotriazinas de la fórmula (VI) con las aminas de la fórmula (V) se lleva a cabo en un solvente orgánico. En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver las halotriazinas de la fórmula (VI) y las aminas de la fórmula (V) por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción.

Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano, nitrometano y mezclas de alcanos C₅-C₈, ahidrocarburos aromáticos tales como benceno, clorobenceno, tolueno, cresoles, o-, m- y p-xileno, hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno, éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter

(TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF), ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, así como también solventes apróticos dipolares tales como sulfolano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida (DMAC), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), N,N'-dimetilpropileno urea (DMPU), sulfóxido de dimetilo (DMSO) y 1-metil-2-pirrolidinona (NMP).

5 Los solventes preferidos son éteres como se definió anteriormente.

El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

La reacción de las halotriazinas de la fórmula (VI) con las aminas de la fórmula (V) se lleva a cabo en la presencia de una base.

10 Ejemplos de bases adecuadas incluyen bases que contienen metal y bases que contienen nitrógeno. Ejemplos de bases que contienen metal adecuadas son compuestos inorgánicos tales como hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, y otros hidróxidos de metal, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de magnesio, hidróxido de calcio y hidróxido de aluminio; óxido de metal alcalino o metal alcalinotérreo, y otros óxidos de metal, tales como óxido de litio, óxido de sodio, óxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio y óxido de magnesio, óxido de hierro, óxido de plata; hidruros de metal alcalino y metal alcalinotérreo tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y hidruro de calcio, formatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, acetatos y otras sales de metal de ácidos carboxílicos, tales como formato de sodio, benzoato de sodio, acetato de litio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de magnesio, y acetato de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de magnesio, y carbonato de calcio, así como también hidrógeno carbonatos de metales alcalinos (bicarbonatos) tales como hidrógeno carbonato de litio, hidrógeno carbonato de sodio, hidrógeno carbonato de potasio; fosfatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como fosfato de sodio, fosfato de potasio y fosfato de calcio; alcóxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, etóxido de potasio, tert-butóxido de potasio, tert-pentóxido de potasio y dimetoximagnesio; y adicionalmente bases orgánicas, tales como aminas terciarias tales como tri-alkilaminas C₁-C₆, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, N-etildiisopropilamina, y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas tales como colidina, lutidina, N-metilmorfolina y también aminas bicíclicas tales como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU) o 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN).

Las bases preferidas son alcóxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos como se definió anteriormente.

30 El término base como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más, preferiblemente dos de los compuestos anteriores. Se da particular preferencia al uso de una base.

Las bases se pueden utilizar en exceso, preferiblemente desde 1 hasta 10, con especial preferencia desde 2 hasta 4 equivalentes de base con base en las halotriazinas de la fórmula (VI), y también se pueden utilizar como el solvente.

La reacción de las halotriazinas de la fórmula (VI) con las aminas de la fórmula (V) se lleva a cabo en la presencia de un catalizador.

35 Ejemplos de catalizadores adecuados incluyen por ejemplo,

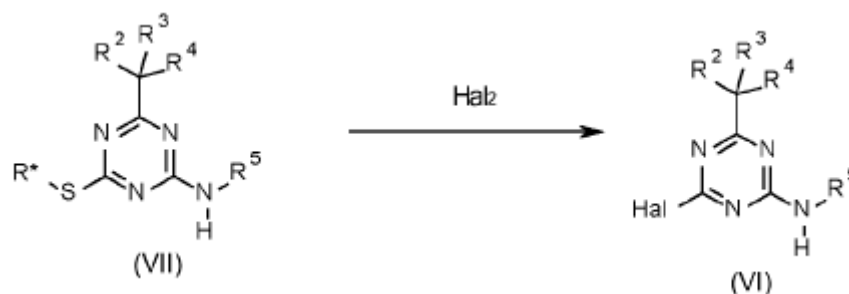
catalizadores con base en paladio como, por ejemplo, acetato de paladio (II), tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) o (1,1,-bis(difenilfosfino)ferrocen)-dicloropaladio (II), y, opcionalmente, aditivos adecuados, por ejemplo, fosfinas, tales como P(o-tolil)₃ trifenilfosfina o BINAP (2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'- binaftilo).

40 La cantidad de catalizador es usualmente 10 a 20% mol (0.1 a 0.2 equivalentes) con base en las halotriazinas de la fórmula (VI).

El experto puede determinar fácilmente el fin de la reacción por medio de métodos de rutina. Las mezclas de reacción se tratan finalmente en una forma habitual, por ejemplo al mezclar con agua, separación de las fases y, si es apropiado, purificación cromatográfica del producto crudo.

45 Las aminas de la fórmula (V) requeridas para la preparación de azinas de la fórmula (I), en la que R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, están disponibles comercialmente y/o se pueden preparar mediante analogía a la literatura conocida.

50 Las halotriazinas de la fórmula (VI) requeridas para la preparación de azinas de la fórmula (I), en la que R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, se conocen de la literatura, están disponibles comercialmente y/o se pueden preparar mediante analogía (por ejemplo J. K.Chakrabarti et al., Tetrahedron 1975, 31, 1879 - 1882) al hacer reaccionar tiotriazinas de la fórmula (VII) con un halógeno:



Las variables R^2 , R^3 , y R^4 tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se define en la fórmula (I) mencionada anteriormente;

Hal es halógeno;

5 preferiblemente Cl o Br;

con particular preferencia Cl;

R^* es alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_2-C_6 o fenilo; preferiblemente alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_2-C_6 ;

con particular preferencia alquilo C_1-C_6 ;

con especial preferencia CH_3 ; y

10 R^5 es H, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 ;

con particular preferencia H, alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ;

con especial preferencia H, CH_2OCH_3 o OCH_3 ;

con más preferencia hidrógeno.

15 La reacción de las tiotriazinas de la fórmula (VII) con el halógeno usualmente se lleva a cabo desde $0^\circ C$ hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente desde $15^\circ C$ hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, particularmente preferiblemente desde $15^\circ C$ hasta $40^\circ C$, en un solvente orgánico inerte (por ejemplo J. K. Chakrabarti et al., Tetrahedron 1975, 31, 1879 - 1882).

La reacción se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

20 En el proceso de acuerdo con la invención, el halógeno se utiliza en exceso con respecto a las tiotriazinas de la fórmula (VII).

La reacción de las tiotriazinas de la fórmula (VII) con el halógeno se lleva a cabo en un solvente orgánico.

25 En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver las tiotriazinas de la fórmula (VII) y el halógeno por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción. Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano, ciclohexano y mezclas de alcanos C_5-C_8 , hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo y tetracloruro de carbono; éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter (TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF), alcoholes tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y tert.-butanol, así como también ácidos orgánicos como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido cítrico, ácido trifluoroacético.

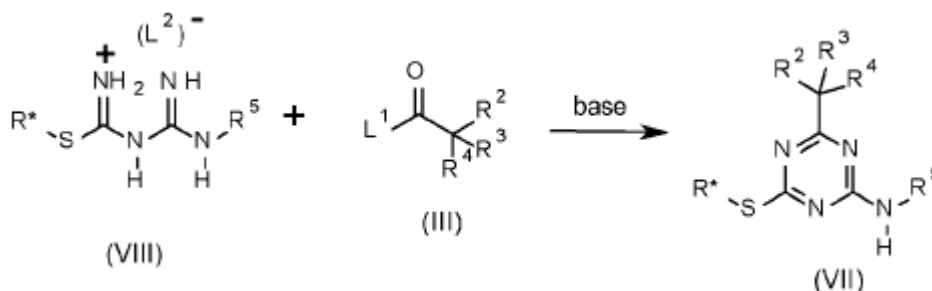
30

Los solventes preferidos son hidrocarburos halogenados y ácidos orgánicos como se definió anteriormente.

El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

El experto puede determinar fácilmente el fin de la reacción por medio de métodos de rutina. Las mezclas de reacción se tratan finalmente en una forma habitual, por ejemplo al mezclar con agua, separación de las fases y, si es apropiado, purificación cromatográfica del producto crudo.

- 5 Las tiotriazinas de la fórmula (VII) requeridas para la preparación de halotriazinas de la fórmula (VI) se pueden preparar de acuerdo con al hacer reaccionar sales de guanidina de la fórmula (VIII) con compuestos de carbonilo de la fórmula (III) en la presencia de una base:



Las variables R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se define en la fórmula (I) mencionada anteriormente;

- 10 R^* es alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_2 - C_6 o fenilo; preferiblemente alquilo C_1 - C_6 o haloalquilo C_2 - C_6 ;

con particular preferencia alquilo C_1 - C_6 ;

con especial preferencia CH_3 ;

L^1 es un grupo saliente nucleófilo desplazable tal como halógeno, CN, alcoxi C_1 - C_6 , alcoxycarbonilo C_1 - C_6 , alquilcarbonilo C_1 - C_6 o alcoxycarbonilo C_1 - C_6 ; preferiblemente halógeno o alcoxi C_1 - C_6 ;

- 15 con particular preferencia Cl o alcoxi C_1 - C_6 ,

también con particular preferencia halógeno;

con especial preferencia Cl; y

L^2 es un grupo saliente nucleófilo desplazable tal como halógeno, alquilo sulfonilo C_1 - C_6 , haloalquilo sulfonilo C_1 - C_6 , alcoxi sulfonilo C_1 - C_6 o fenilsulfonilo; preferiblemente halógeno o haloalquilo sulfonilo C_1 - C_6 ;

- 20 con particular preferencia halógeno;

con especial preferencia I; y

R^5 es H, alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 ;

con particular preferencia H, alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 o alcoxi C_1 - C_6 ;

con especial preferencia H, CH_2OCH_3 o OCH_3 ;

- 25 con más preferencia hidrógeno.

La reacción de la sal de guanidina de la fórmula (VIII) con el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) usualmente se lleva a cabo a temperaturas des 50°C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente desde 50°C hasta 100°C .

- 30 La reacción se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

En una realización del proceso de acuerdo con la invención, las sales de guanidina de la fórmula (VIII) y el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) se utilizan en cantidades equimolares.

En otra realización del proceso de acuerdo con la invención, el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) se utiliza en exceso con respecto a las sales de guanidina de la fórmula (VIII).

5 Preferiblemente la relación molar del compuesto de carbonilo de la fórmula (III) con la sal de guanidina de la fórmula (VIII) está en el rango desde 1.5:1 a 1:1, preferiblemente 1.2:1 a 1:1, con especial preferencia 1.2:1, también con especial preferencia 1:1.

La reacción de la sal de guanidina de la fórmula (VIII) con el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) usualmente se lleva a cabo en un solvente orgánico.

10 En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver la sal de guanidina de la fórmula (VIII) y el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción.

15 Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno, éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter (TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF), nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo, así como también solventes apróticos dipolares tales como sulfolano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida (DMAC), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), N,N'-dimetilpropileno urea (DMPU), sulfóxido de dimetilo (DMSO) y 1-metil-2-pirrolidinona (NMP).

Los solventes preferidos son éteres y solventes apróticos dipolares como se definió anteriormente. Con más preferencia los solventes son éteres como se definió anteriormente.

El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

20 La reacción de las sales de guanidina de la fórmula (VIII) con el compuesto de carbonilo de la fórmula (III) se lleva a cabo en la presencia de una base.

25 Ejemplos de bases adecuadas incluyen bases que contienen metal y bases que contienen nitrógeno. Ejemplos de bases que contienen metal adecuadas son compuestos inorgánicos tales como óxido de metal alcalino o metal alcalinotérreo, y otros óxidos de metal, tales como óxido de litio, óxido de sodio, óxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio y óxido de magnesio, óxido de hierro, óxido de plata; hidruros de metal alcalino y metal alcalinotérreo tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y hidruro de calcio, carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de magnesio, y carbonato de calcio, así como también hidrógeno carbonatos de metales alcalinos (bicarbonatos) tales como hidrógeno carbonato de litio, hidrógeno carbonato de sodio, hidrógeno carbonato de potasio; fosfatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como fosfato de sodio, fosfato de potasio y fosfato de calcio; y adicionalmente bases orgánicas, tales como aminas terciarias tales como tri-alquilaminas C₁-C₆, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, N-etildisopropilamina, y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas tales como colidina, lutidina, N-metilmorfolina, y también aminas bicíclicas tales como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU) o 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN).

35 Las bases preferidas son tri-alquilaminas C₁-C₆ como se definió anteriormente.

El término base como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más, preferiblemente dos de los compuestos anteriores. Se da particular preferencia al uso de una base.

Las bases en general se emplean en exceso; sin embargo también se pueden emplear en cantidades equimolares, o, si es apropiado, se pueden utilizar como solvente.

40 Preferiblemente desde 1 hasta 5 equivalentes de base, con particular preferencia se utilizan 3 equivalentes de base, con base en las sales de guanidina de la fórmula (VIII).

El experto puede determinar fácilmente el fin de la reacción por medio de métodos de rutina. Las mezclas de reacción se tratan finalmente en una forma habitual, por ejemplo al mezclar con agua, separación de las fases y, si es apropiado, purificación cromatográfica del producto crudo.

45 Los compuestos de carbonilo de la fórmula (III) requeridos para la preparación de azinas de la fórmula (I) se conocen de la literatura. Se pueden preparar de acuerdo con y/o están disponibles comercialmente.

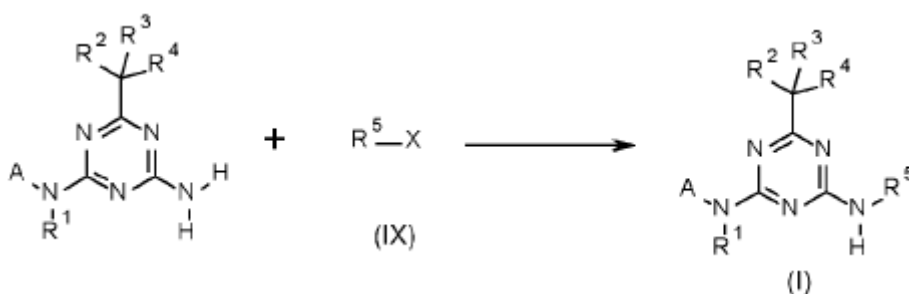
La sal de guanidina de la fórmula (VIII), en la que L² es yodo, requerida para la preparación de tiotriazinas de la fórmula (VII) se conoce de la literatura (por ejemplo M. Freund et al., Chem. Ber. 1901, 34, 3110 - 3122; H.

Eilingsfeld et al., Chem. Ber. 1967, 100, 1874 - 1891). Las sales de guanidina de la fórmula (VIII) están disponibles comercialmente y/o se pueden preparar de acuerdo con la literatura mencionada.

Proceso C)

Las azinas de la fórmula (I), en la que

- 5 R^5 es CN, (alquilo C_1-C_6)carbonilo, (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, (alquilo C_1-C_6)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ; se pueden preparar al hacer reaccionar azinas de la fórmula (I), en la que R^5 es hidrógeno con un compuesto de la fórmula (IX):



- 10 (I) en la que R^5 es hidrógeno

Las variables A, R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados, en particular los significados preferidos, como en la fórmula (I) mencionada anteriormente,

- 15 R^5 es CN, (alquilo C_1-C_6)carbonilo, (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, (alquilo C_1-C_6)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ;

con particular preferencia CN, (alquilo C_1-C_6)carbonilo, (alcoxi C_1-C_6)carbonilo o (alquilo C_1-C_6)sulfonilo;

con especial preferencia CN, $COCH_3$, $COOCH_3$ o SO_2CH_3 ; y

X es halógeno o oxicarbonil-alquilo C_1-C_6 ;

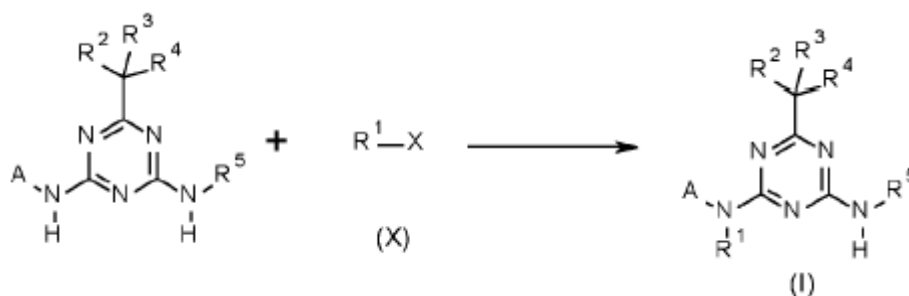
con particular preferencia halógeno;

- 20 con especial preferencia Cl o Br.

Proceso D)

Las azinas de la fórmula (I), en la que

- 25 R^1 es CN, (alquilo C_1-C_6)carbonilo, (alcoxi C_1-C_6)carbonilo, (alquilo C_1-C_6)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ; se pueden preparar al hacer reaccionar azinas de la fórmula (I), en la que R^1 es hidrógeno con un compuesto de la fórmula (X):



(I) en la que R⁵ es hidrógeno

Las variables A, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como en la fórmula (I) mencionada anteriormente,

5 R¹ es CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

con particular preferencia CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo;

con especial preferencia CN, COCH₃, COOCH₃ o SO₂CH₃; y

X es halógeno o oxicarbonil-alquilo C₁-C₆;

10 con particular preferencia halógeno;

con especial preferencia Cl o Br.

Ambos procesos C y D independientemente entre sí usualmente se llevan a cabo a desde 0°C hasta el punto de ebullición de la mezcla de reacción, preferiblemente desde 23°C hasta 130°C, particularmente preferiblemente desde 23°C hasta 100°C, (por ejemplo Y. Yuki et al., Polym. J. 1992, 24, 791-799).

15 Ambos procesos C y D independientemente entre sí se puede llevar a cabo a presión atmosférica o bajo presión elevada, si es apropiado bajo un gas inerte, de forma continua o en tandas.

En una realización de los procesos C y D de acuerdo con la invención independientemente entre sí, las azinas de la fórmula (I), en la que R⁵, o R¹ respectivamente, es hidrógeno se utilizan en exceso con respecto al compuesto de la fórmula (IX), o (X) respectivamente.

20 En otra realización de los procesos C y D de acuerdo con la invención independientemente entre sí, las azinas de la fórmula (I), en la que R⁵, o R¹ respectivamente, es hidrógeno y el compuesto de la fórmula (IX), o (X) respectivamente, se utilizan en cantidades equimolares.

25 Preferiblemente la relación molar de las azinas de la fórmula (I), en la que R⁵, o R¹ respectivamente, es hidrógeno con el compuesto de la fórmula (IX), o (X) respectivamente está en el rango desde 1:1.5 a 1:1, preferiblemente 1:1.2 a 1:1, con especial preferencia 1:1.

30 Ambos procesos C y D independientemente uno del otro se llevan a cabo en un solvente orgánico. En principio son adecuados todos los solventes que son capaces de disolver las azinas de la fórmula (I), en la que R⁵, o R¹ respectivamente, es hidrógeno y el compuesto de la fórmula (IX), o (X) respectivamente, por lo menos parcialmente y preferiblemente completamente bajo condiciones de reacción. Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, 1,2-dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno; éteres tales como éter de dietilo, éter de diisopropilo, tert.-butil metiléter (TBME), dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo; alcoholes tales como metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol y tert.-butanol; ácidos orgánicos como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido metibenzenosulfónico, ácido benzenosulfónico, ácido canforsulfónico, ácido cítrico, 35 ácido trifluoroacético así como también solventes apróticos dipolares tales como sulfolano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida (DMAC), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), N,N'-dimetilpropileno urea (DMPU), sulfóxido de dimetilo (DMSO) y 1-metil-2-pirrolidinona (NMP).

Los solventes preferidos son hidrocarburos halogenados, éteres y solventes apróticos dipolares como se mencionó anteriormente.

40 Con más preferencia los solventes son diclorometano o dioxano.

También es posible utilizar mezclas de los solventes mencionados.

El término solvente como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más de los compuestos anteriores.

Ambos procesos C y D independientemente uno del otro opcionalmente se llevan a cabo en la presencia de una base.

5 Ejemplos de bases adecuadas incluyen bases que contienen metal y bases que contienen nitrógeno. Ejemplos de bases que contienen metal adecuadas son compuestos inorgánicos tales como hidruros de metal alcalino y metal alcalinotérreo tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y hidruro de calcio, carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de magnesio, y carbonato de calcio, así como también hidrógeno carbonatos de metales alcalinos (bicarbonatos) tales como hidrógeno carbonato de litio, hidrógeno carbonato de sodio, hidrógeno carbonato de potasio; fosfatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como fosfato de sodio, fosfato de potasio y fosfato de calcio; y adicionalmente bases orgánicas, tales como aminas terciarias tales como tri-alquilaminas C₁-C₆, por ejemplo trietilamina, trimetilamina, N-etildiisopropilamina, y N-metilpiperidina, piridina, piridinas sustituidas tales como colidina, lutidina, N-metilmorfolina y 4-dimetilaminopiridina (DMAP), y también aminas bicíclicas tales como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU) o 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN).

Las bases preferidas son bases orgánicas y carbonatos de metales alcalinos como se mencionó anteriormente.

Con especial preferencia las bases son bases orgánicas como se mencionó anteriormente.

15 El término base como se utiliza aquí también incluye mezclas de dos o más, preferiblemente dos de los compuestos anteriores. Se da particular preferencia al uso de una base.

Las bases en general se emplean en exceso; sin embargo también se pueden emplear en cantidades equimolares, o, si es apropiado, se pueden utilizar como solvente.

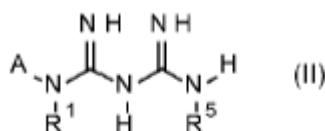
Preferiblemente desde 1 hasta 5 equivalentes de base, con particular preferencia se utilizan 3 equivalentes de base, con base en las azinas de la fórmula (I).

20 Se puede realizar el tratamiento final en una forma conocida.

Los compuestos de la fórmula (IX), o (X) respectivamente, son compuestos conocidos. Están disponibles comercialmente o se pueden preparar en analogía a métodos conocidos.

Las biguanidinas de la fórmula (II) son compuestos novedosos y como se mostró anteriormente intermedios adecuados para la preparación de las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención.

25 Por lo tanto la presente invención también proporciona biguanidinas de la fórmula (II)



en la que

30 A es fenilo, que se sustituye por dos a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfinilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆;

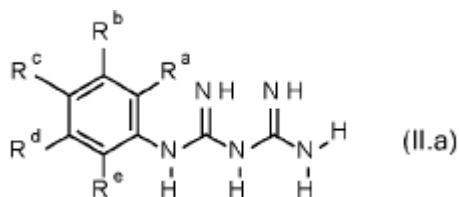
que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

35 Con respecto a la variable A, las realizaciones particularmente preferidas de las biguanidinas de la fórmula (II) corresponden, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra, a aquellas de la variable A de las azinas fórmula (I), y, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra,

R¹ es con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃; con más preferencia hidrógeno;

40 R⁵ es con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃; con más preferencia hidrógeno.

Se da particular preferencia a biguanidinas de la fórmula (II.a), que corresponden a biguanidinas de la fórmula (II) en la que A es (A.1) y R¹ y R⁵ son H:



- 5 en la que las variables R^a, R^b, R^c, R^d y R^e tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las biguanidinas de las fórmulas (II.a.1) a (II.a.37) de la Tabla B, donde las definiciones de las variables R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R³ y R⁴ son de particular importancia para los compuestos de acuerdo con la invención no solo en combinación una con la otra sino en cada caso también por su cuenta:

Tabla B

No.	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e
II.a.1	F	H	H	H	F
II.a.2	Cl	H	H	H	F
II.a.3	Br	H	H	H	F
II.a.4	CN	H	H	H	F
II.a.5	CH ₃	H	H	H	F
II.a.6	F	H	H	F	F
II.a.7	Cl	H	H	F	F
II.a.8	F	H	H	Cl	F
II.a.9	Cl	H	H	F	F
II.a.10	CN	H	H	F	F
II.a.11	F	H	H	CN	F

II.a.12	CN	H	H	F	F
II.a.13	F	H	F	H	F
II.a.14	Cl	H	F	H	F
II.a.15	CN	H	F	H	F
II.a.16	F	F	F	H	F
II.a.17	Cl	F	F	H	F
II.a.18	F	Cl	F	H	F
II.a.19	Cl	F	F	H	F
II.a.20	CN	F	F	H	F
II.a.21	F	CN	F	H	F
II.a.22	CN	F	F	H	F
II.a.23	F	F	H	F	F

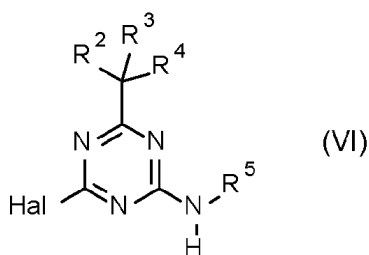
II.a.24	Cl	F	H	F	F
II.a.25	F	Cl	H	F	F
II.a.26	CN	F	H	F	F
II.a.27	F	CN	H	F	F
II.a.28	F	F	F	F	F
II.a.29	Cl	F	F	F	F
II.a.30	F	Cl	F	F	F

II.a.31	CN	F	F	F	F
II.a.32	F	CN	F	F	F
II.a.33	H	F	F	F	F
II.a.34	F	F	Br	F	F
II.a.35	F	F	C≡CH	F	F
II.a.36	CF ₃	Cl	H	H	F
II.a.37	F	F	I	F	F

- 10 Se da particular preferencia a las biguanidinas de las fórmulas (II.a.1), (II.a.4), (II.a.9), (II.a.23) y (II.a.28) como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las biguanidinas de las fórmulas (II.a.1), (II.a.4), (II.a.23) y (II.a.28) como se definió anteriormente; se da más preferencia a las biguanidinas de las fórmulas (II.a.23) y (II.a.28) como se definió anteriormente.

- 15 Las halotriazinas de la fórmula (VI) son compuestos novedosos y como se mostró anteriormente intermedios adecuados para la preparación de las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención.

Por lo tanto la presente invención también proporciona halotriazinas de la fórmula (VI)



en el que

R² es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

5 R³ es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

R⁴ es H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

10 R³ y R⁴ juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de carbonilo, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros, en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ o heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆; y

Hal es halógeno;

79 que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

15 Con respecto a las variables R², R³ y R⁴, las realizaciones particularmente preferidas de las tiotriazinas de la fórmula (VII) corresponden, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra, con aquellas de las variables de R², R³ y R⁴ de las azinas fórmula (I), y, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra,

R⁵ es con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

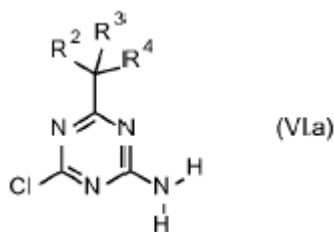
con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

20 con más preferencia hidrógeno;

Hal es preferiblemente Cl o Br;

con particular preferencia Cl.

Se da preferencia a las halotriazinas de la fórmula (VI.a), que corresponden a las halotriazinas de la fórmula (VI) en las que R⁵ es hidrógeno y Hal es Cl:



25

en las que las variables R², R³ y R⁴ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las halotriazinas de las fórmulas (VI.a.1) a (VI.a.38) de la Tabla C, donde las definiciones de las variables R², R³ y R⁴ son de particular importancia para los compuestos de acuerdo con la invención no solo en combinación una con la otra sino en cada caso también por su cuenta:

Tabla C

No.	R ²	R ³	R ⁴
VI.a.1	CH ₃	H	H
VI.a.2	CH ₃	CH ₃	H
VI.a.3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
VI.a.4	F	F	F
VI.a.5	F	CF ₃	F
VI.a.6	F	CH ₃	F
VI.a.7	F	CH ₃	H
VI.a.8	F	CH ₃	CH ₃
VI.a.9	Cl	CH ₃	CH ₃
VI.a.10	F	C ₂ H ₅	CH ₃
VI.a.11	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

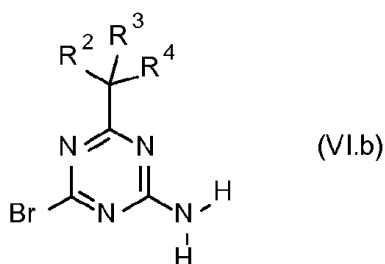
VI.a.12	H	-(CH ₂) ₂ -
VI.a.13	H	-(CH ₂) ₃ -
VI.a.14	H	-(CH ₂) ₄ -
VI.a.15	H	-(CH ₂) ₅ -
VI.a.16	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -
VI.a.17	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -
VI.a.18	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -
VI.a.19	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -
VI.a.20	F	-(CH ₂) ₂ -
VI.a.21	F	-(CH ₂) ₃ -
VI.a.22	F	-(CH ₂) ₄ -
VI.a.23	F	-(CH ₂) ₅ -

VI.a.24	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
VI.a.25	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
VI.a.26	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
VI.a.27	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
VI.a.28	C ₂ H ₅	CH ₃	H
VI.a.29	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
VI.a.30	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
VI.a.31	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃

VI.a.32	Cl	CH ₃	H
VI.a.33	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
VI.a.34	CN	CH ₃	CH ₃
VI.a.35	OCH ₃	H	H
VI.a.36	OCH ₃	CH ₃	H
VI.a.37	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
VI.a.38	H	-(O(CH ₂)) ₃ -	

5

También se prefieren las halotriazinas de la fórmula (VI.b), con particular preferencia las halotriazinas de las fórmulas (VI.b.1) a (VI.b.27), que difieren de las halotriazinas correspondientes de las fórmulas (VI.a.1) a (VI.a.27) solo en el que Hal es Br:

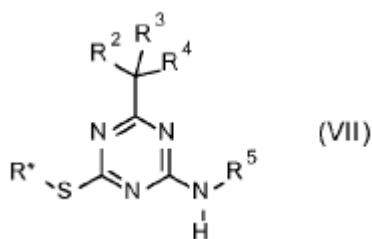


10

Se da particular preferencia a las halotriazinas de las fórmulas (VI.a.2), (VI.a.3), (VI.a.6), (VI.a.8), (VI.a.9), (VI.a.14) y (VI.a.15) como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las halotriazinas de las fórmulas (VI.a.2), (VI.a.3), (VI.a.8), (VI.a.9) como se definió anteriormente; se da más preferencia a la halotriazina de la fórmula (VI.a.8) como se definió anteriormente.

Las tiotriazinas de la fórmula (VII) son compuestos novedosos y como se mostró anteriormente los intermedios adecuados para la preparación de las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención.

Por lo tanto la presente invención también proporciona tiotriazinas de la fórmula (VII)



en la que

R² H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

5 R³ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; 81

R⁴ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

R³ y R⁴ juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de carbonilo, alquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros, en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ o heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆; y

R* es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆ o fenilo;

que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

15 Con respecto a las variables R², R³ y R⁴, las realizaciones particularmente preferidas de las tiotriazinas de la fórmula (VII) corresponden, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra, a aquellas de las variables de R², R³ y R⁴ de las azinas fórmula (I), y, ya sea independientemente entre sí o en combinación una con la otra,

R⁵ es con particular preferencia H, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

con especial preferencia H, CH₂OCH₃ o OCH₃;

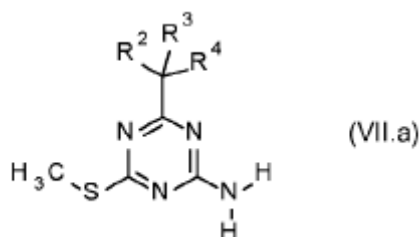
20 con más preferencia hidrógeno;

R* es preferiblemente alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₂-C₆;

con particular preferencia alquilo C₁-C₆;

con especial preferencia CH₃.

25 Se da preferencia a las tiotriazinas de la fórmula (VII.a), que corresponden a las tiotriazinas de la fórmula (VII) en las que R⁵ es hidrógeno y R* es metilo:



en las que las variables R², R³ y R⁴ tienen los significados, en particular los significados preferidos, como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las tiotriazinas de las fórmulas (VII.a.1) a (VII.a.38) de la Tabla D, donde

las definiciones de las variables R², R³ y R⁴ son de particular importancia para los compuestos de acuerdo con la invención no solo en combinación una con la otra sino en cada caso también por su cuenta:

Tabla D

No.	R ²	R ³	R ⁴
VII.a.2	CH ₃	CH ₃	H
VII.a.3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
VII.a.4	F	F	F
VII.a.5	F	CF ₃	F
VII.a.6	F	CH ₃	F
VII.a.7	F	CH ₃	H
VII.a.8	F	CH ₃	CH ₃
VII.a.9	Cl	CH ₃	CH ₃
VII.a.10	F	C ₂ H ₅	CH ₃
VII.a.11	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
VII.a.12	H	-(CH ₂) ₂ -	
VII.a.13	H	-(CH ₂) ₃ -	
VII.a.14	H	-(CH ₂) ₄ -	
VII.a.15	H	-(CH ₂) ₅ -	
VII.a.16	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -	
VII.a.17	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	
VII.a.18	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	
VII.a.19	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -	
VII.a.20	F	-(CH ₂) ₂ -	

VII.a.1	CH ₃	H	H
VII.a.21	F	-(CH ₂) ₃ -	
VII.a.22	F	-(CH ₂) ₄ -	
VII.a.23	F	-(CH ₂) ₅ -	
VII.a.24	Cl	-(CH ₂) ₂ -	
VII.a.25	Cl	-(CH ₂) ₃ -	
VII.a.26	Cl	-(CH ₂) ₄ -	
VII.a.27	Cl	-(CH ₂) ₅ -	
VII.a.28	C ₂ H ₅	CH ₃	H
VII.a.29	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
VII.a.30	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃
VII.a.31	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
VII.a.32	Cl	CH ₃	H
VII.a.33	CH ₂ Cl	Cl	CH ₃
VII.a.34	CN	CH ₃	CH ₃
VII.a.35	OCH ₃	H	H
VII.a.36	OCH ₃	CH ₃	H
VII.a.37	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
VII.a.38	H	-O(CH ₂) ₃ -	

5 Se da particular preferencia a las tiotriazinas de las fórmulas (VII.a.2), (VII.a.3), (VII.a.6), (VII.a.8), (VII.a.9), (VII.a.14) y (VII.a.15) como se definió anteriormente; se da especial preferencia a las tiotriazinas de las fórmulas (VII.a.2), (VII.a.3), (VII.a.8), (VII.a.9) como se definió anteriormente; se da más preferencia a la tiotriazina de la fórmula (VII.a.8) como se definió anteriormente.

10 Para ampliar el espectro de acción y para lograr efectos sinérgicos, las azinas de la fórmula (I) se pueden mezclar con una gran cantidad de representantes de otros grupos de ingredientes activos herbicidas o que regulan el crecimiento, y luego aplicar concomitantemente.

15 Los componentes adecuados para las mezclas son, por ejemplo, herbicidas de las clases de acetamidas, amidas, ariloxifenoxipropionatos, benzamidas, benzofurano, ácidos benzoicos, benzotiadiazinonas, bupiridilio, carbamatos, cloroacetamidas, ácidos clorocarboxílicos, ciclohexandionas, dinitroanilinas, dinitrofenol, difenil éter, glicinas, imidazolinonas, isoxazoles, isoxazolidinonas, nitrilos, N-fenilftalimidias, oxadiazoles, oxazolidindionas, oxiacetamidas, ácidos fenoxicarboxílicos, fenilcarbamatos, fenilpirazoles, fenilpirazolinonas, fenilpiridazinas, ácidos fosfínicos, fosforoamidatos, fosforoditioatos, ftalamatos, pirazoles, piridazinas, piridinas, ácidos piridincarboxílicos, piridincarboxamidas, pirimidindionas, pirimidinil(tio)benzoatos, ácidos quinolincarboxílicos, semicarbazonas, sulfonilaminocarboniltriazolinonas, sulfonilureas, tetrazolinonas, tiadiazoles, tiocarbamatos, triazinas, triazinonas, triazoles, triazolinonas, triazolocarboxamidas, triazolopirimidinas, tricetonas, uracilos, ureas.

25 También adicionalmente es benéfico aplicar las azinas de fórmula (I) por separado o en combinación con otros herbicidas, o si no en forma de una mezcla con otros agentes para la protección de cultivos, por ejemplo, junto con agentes para el control de plagas o bacterias u hongos fitopatógenicos. También es de interés la miscibilidad con soluciones de sales minerales, que se utilizan para el tratamiento de deficiencias nutricionales y de oligoelementos. También se pueden agregar otros aditivos, tales como aceites y concentrados oleosos no fitotóxicos.

La invención también se relaciona con composiciones agroquímicas que comprenden por lo menos un auxiliar y por lo menos una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención.

5 Una composición agroquímica comprende una cantidad pesticidamente efectiva de una azina de la fórmula (I). El término "cantidad efectiva" denota una cantidad de la composición o de los compuestos I, que es suficiente para controlar las plantas no deseadas, en especial, para controlar las plantas no deseadas en plantas cultivadas, y que no resultan en un daño sustancial a las plantas tratadas. Dicha una cantidad puede variar en un amplio rango y depende de varios factores, tales como las plantas que se desean controlar, el material o la planta cultivada tratada, las condiciones climáticas y la azina específica de la fórmula (I) utilizada.

10 Las azinas de la fórmula (I), sus N-óxidos o sales se pueden convertir en los tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvillos, polvos, pastas, gránulos, productos prensados, cápsulas y mezclas de los mismos. Los ejemplos de tipos de composiciones agroquímicas son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsificables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvillos humectantes (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), productos prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y tipos de composiciones agroquímicas adicionales se definen en "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6.a edición, mayo de 2008, CropLife International.

20 Las composiciones agroquímicas se preparan de la manera conocida, como describen Mollet y Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agron Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

25 Los auxiliares adecuados son solventes, portadores líquidos, portadores sólidos o agentes de relleno, surfactantes, dispersantes, emulsificadores, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, mejoradores de penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes alimenticios, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespuma, colorantes, mejoradores de la pegajosidad y aglutinantes.

30 Los solventes y los portadores líquidos adecuados son agua y solventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral con un punto de ebullición de medio a alto, por ejemplo, queroseno, gasoleo; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo, etanol, propanol, butanol, bencilalcohol, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo, ciclohexanona; ésteres, por ejemplo, lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo, N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.

35 Los portadores o rellenos sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, geles de sílice, talco, caolín, piedra caliza, cal viva, tiza, arcilla, dolomita, tierra diatomácea, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de los mismos.

40 Los surfactantes adecuados son compuestos activos en superficie, tales como surfactantes aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Dichos surfactantes se pueden utilizar como emulsificadores, dispersantes, solubilizantes, humectantes, mejoradores de penetración, coloides protectores o adyuvantes. Ejemplos de surfactantes se enumeran en McCutcheon, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.).

45 Los surfactantes aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérricas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquifenoles etoxilados, sulfonatos de arifenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecibencenos y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquifenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son alquilcarboxilatos, y alcohol carboxilado o etoxilados de alquifenol.

55 Los surfactantes no iónicos adecuados son alcoxilados, amidas de ácidos grasos sustituidos con N, óxidos de amina, ésteres, surfactantes a base de azúcar, surfactantes poliméricos y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilados son compuestos, tales como alcoholes, alquifenoles, aminas, amidas, arifenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que se alcoxilan con 1 a 50 equivalentes. El óxido de etileno y/o el óxido de propileno se

5 pueden emplear para la alcoxilación, preferiblemente, el óxido de etileno. Ejemplos de aminas de ácidos grasos sustituidas con N son glucamidas de ácido graso o alcanolamidas de ácido graso. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de surfactantes a base de azúcar son sorbitán, sorbitán etoxilado, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de surfactantes poliméricos son homopolímeros o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o vinilacetato.

10 Los surfactantes catiónicos adecuados son surfactantes cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con 1 o 2 grupos hidrófobos o sales de aminas primarias de cadena larga. Los surfactantes anfóteros adecuados son alquilbetainas e imidazolininas. Los polímeros en bloque adecuados son polímeros en bloque de tipo A-B o A-B-A, que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o de tipo A-B-C, que comprenden alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros poliácidos tipo peine. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

15 Los adyuvantes adecuados son compuestos que tienen poca o incluso ninguna actividad pesticida y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I en el objetivo. Ejemplos son surfactantes, aceites minerales o vegetales, y otros auxiliares. Se enumeran ejemplos adicionales en Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, capítulo 5.

Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma xantano, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (modificadas en forma orgánica o no modificadas), policarboxilados y silicatos.

20 Los bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona, tales como alquilisotiazolinonas y bencisotiazolinonas.

Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

Los agentes antiespumación adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

25 Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y tinturas solubles en agua. Ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo y ftalocianina).

Los agentes de pegajosidad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, alcoholes de polivinilo, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Ejemplos de tipos de composiciones agroquímicas y su preparación son los siguientes:

i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

30 Se disuelven 10-60% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y 5-15% en peso de agente humectante (por ejemplo, alcohol alcoxilado) en agua y/o en un solvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta 100% en peso. La sustancia activa se disuelve luego de dilución con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

35 Se disuelven 5-25% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en un solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) hasta 100% en peso. La dilución con agua produce una dispersión.

iii) Concentrados emulsionables (EC)

40 Se disuelven 15-70% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y 5-10% en peso de emulsificadores (por ejemplo, dodecibencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en un solvente orgánico no soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta 100% en peso. La dilución con agua produce una emulsión.

iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

45 Se disuelven 5-40% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de emulsificadores (por ejemplo, dodecibencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en 20-40% en peso de solvente orgánico no soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en hasta

100% en peso de agua mediante una maquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua produce una emulsión.

v) Suspensiones (SC, OD, FS)

5 En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 20-60% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención con adición de 2-10% en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilado), 0.1-2% en peso de espesante (por ejemplo, goma xantano) y agua hasta 100% en peso para obtener una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición tipo FS, se agrega hasta 40% en peso de aglutinante (por ejemplo, polivinilalcohol).

10 vi) gránulos dispersables en agua y gránulos soluble en agua (WG, SG)

15 Se muelen finamente 50-80% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención con adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilado) hasta 100% en peso y se preparan como gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua mediante accesorios técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

20 vii) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS) Se muelen 50-80% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención en un molino rotor estator con adición de 1-5% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3% en peso de agentes humectantes (por ejemplo, alcohol etoxilado) y portador sólido (por ejemplo, gel de sílice) hasta 100% en peso. La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

viii) Gel (GW, GF)

25 En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 5-25% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención con adición de 3-10% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-5% en peso de espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y agua hasta 100% en peso para obtener una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa.

iv) Microemulsión (ME)

30 Se agregan 5-20% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención a 5-30% en peso de mezcla de solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona y dimetilamida de ácido graso), 10-25% en peso de una mezcla de surfactantes (por ejemplo, alcohol etoxilado y arilfenol etoxilado) y agua hasta 100% en peso. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir de manera espontánea una microemulsión termodinámicamente estable.

iv) Microcápsulas (CS)

35 Una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de solvente orgánico no soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático), 2-15% en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metilmetacrilato, ácido metacrílico y un diacrilato o triacrilato) se dispersa en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La polimerización de radicales iniciada mediante un iniciador radical produce la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. Alternativamente, una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de solvente orgánico no soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeten-4,4'- diisocianato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) resulta en la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros representan 1-10% en peso. El % en peso se relaciona con la composición CS total.

ix) Polvos pulverizados (DP, DS)

45 Se muelen finamente 1-10% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y se mezclan íntimamente con un portador sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) hasta 100% en peso.

x) Gránulos (GR, FG)

Se muelen finamente 0.5-30% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y se asocian con un portador sólido (por ejemplo, silicato) hasta 100% en peso. La granulación se obtiene mediante extrusión, secado por aspersión o lecho fluidizado.

xi) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

- 5 Se disuelven 1-50% en peso de una azina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención en solvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta 100% en peso.

Los tipos de composiciones agroquímicas de i) a xi) pueden comprender, opcionalmente, otros auxiliares, tales como 0.1-1% en peso de bactericidas, 5-15% en peso de agentes anticongelantes, 0.1-1% en peso de agentes antiespuma y 0.1-1% en peso de colorantes.

- 10 En general, las composiciones agroquímicas comprenden de 0.01 a 95%, preferiblemente, de 0.1 a 90% y, en particular, de 0.5 a 75% en peso de las azinas de la fórmula (I). Las azinas de la fórmula (I) se utilizan en una pureza de 90% a 100%, preferiblemente, de 95% a 100% (de acuerdo con el espectro de RMN).

- 15 Con frecuencia se emplean soluciones para el tratamiento de semillas (LS), supoemulsiones (SE), concentrados fluidizables (FS), polvos para tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) se utilizan para propósitos de tratamiento de materiales de propagación vegetal, en particular, semillas. Las composiciones agroquímicas en cuestión producen, después de una dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa de 0.01 a 60% en peso, preferiblemente, de 0.1 a 40% en peso, en preparaciones listas para uso. La aplicación se puede realizar antes o durante la siembra.

- 20 Los métodos para aplicar las azinas de la fórmula (I) o composiciones agroquímicas de las mismas, sobre el material de propagación vegetal, en especial semillas, incluyen métodos de aplicación por recubrimiento, revestimiento, granulación, espolvoreo, inmersión y en surco del material de propagación. Preferiblemente, el compuesto I o las composiciones del mismo, respectivamente, se aplican sobre el material de propagación vegetal mediante un método que no induce la germinación, por ejemplo, mediante recubrimiento, granulación, revestimiento y espolvoreo de semillas.

- 25 Se pueden agregar varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y plaguicidas adicionales (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores de crecimiento, protectores) a las azinas de la fórmula (I) o a las composiciones agroquímicas que las comprenden, como premezclas o, si es apropiado, solo inmediatamente antes de utilizar (mezcla en el tanque). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferiblemente, de 1:10 a 10:1.

- 30 Usualmente el usuario aplica las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la invención o las composiciones agroquímicas que las comprenden, con un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un aeroplano de pulverización o un sistema de irrigación. Usualmente, la composición agroquímica se compone de agua, regulador y/u otros auxiliares para la concentración de aplicación deseada y, de esta manera se obtiene la composición agroquímica o el licor de pulverización listo para uso. Usualmente, se aplican de 20 a 2000 litros, preferiblemente, de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para uso por hectárea de área agrícola útil.

- 35 De acuerdo con una realización, el usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición agroquímica de acuerdo con la invención o los componentes parcialmente mezclados en forma previa, por ejemplo, los componentes que comprenden azinas de la fórmula (I), en un tanque de pulverización, y se pueden agregar otros auxiliares y aditivos, si es apropiado.

En una realización adicional, el usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición agroquímica de acuerdo con la invención, tales como partes de un equipo o partes de una mezcla binaria o ternaria, en un tanque de pulverización, y se pueden agregar otros auxiliares, si es apropiado.

- 40 En una realización adicional, los componentes individuales de la composición agroquímica de acuerdo con la invención o los componentes parcialmente mezclados en forma previa, por ejemplo, los componentes que comprenden las azinas de la fórmula (I), se pueden aplicar en forma conjunta (por ejemplo, después de la mezcla en el tanque) o consecutivamente.

- 45 Las azinas de la fórmula (I) son adecuadas como herbicidas. Son adecuadas como tales o como una composición formulada de manera adecuada (composición agroquímica).

- 5 Las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que comprenden las azinas de la fórmula (I) controlan de manera muy efectiva la vegetación en áreas que no son de cultivo, en especial, con altas tasas de aplicación. Actúan contra malezas de hoja amplia y malezas del pasto en cultivos, tales como trigo, arroz, maíz, soja y algodón, sin provocarle a las plantas de cultivo ningún daño significativo. Este efecto se observa principalmente con bajas tasas de aplicación.
- 10 Las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden se aplican a las plantas principalmente al pulverizar las hojas o se aplican en el suelo donde se han sembrado las semillas de plantas. Aquí, la aplicación se puede realizar, por ejemplo, con agua como portador mediante técnicas de pulverización habituales que utilizan una cantidad de licor de pulverización de aproximadamente 100 a 1000 l/ha (por ejemplo, de 300 a 400 l/ha). Las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden también se pueden aplicar con el método de volumen bajo o ultrabajo, o en forma de microgránulos. La aplicación de las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden se puede realizar antes, durante y/o después de la emergencia de las plantas no deseables.
- 15 Las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden se pueden aplicar antes de la emergencia, después de la emergencia o antes de las plantas, o junto con la semilla de una planta de cultivo. También es posible aplicar las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden al aplicar las semillas, tratadas previamente con las azinas de la fórmula (I), o las composiciones agroquímicas que las comprenden de una planta de cultivo. Si los ingredientes activos son menos tolerados por ciertas plantas de cultivo, se pueden utilizar técnicas de aplicación con las cuales las composiciones herbicidas se pulverizan, con la ayuda de
- 20 equipo de pulverización, de tal manera que, en la medida de lo posible, no entren en contacto con las hojas de las plantas de cultivos sensibles, mientras que los ingredientes activos llegan a las hojas de las plantas no deseables que crecen debajo de estas o a la superficie del suelo desnudo (posdirigida, área de descanso).
- 25 En una realización adicional, las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden se pueden aplicar mediante el tratamiento de semillas. El tratamiento de semillas comprende, esencialmente, todos los procedimientos conocidos por un experto en la técnica (revestimiento de semillas, recubrimiento de semillas, pulverización de semillas, inmersión de semillas, recubrimiento de semillas con películas, recubrimiento de semillas con múltiples capas, incrustación de semillas, embebido de semillas y granulación de semillas) sobre la base de las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas preparadas de ellas. Aquí, las composiciones herbicidas se pueden aplicar diluidas o sin diluir.
- 30 El término "semilla" comprende todo tipo de semillas, tales como granos, semillas, frutos, tubérculos, plántulas y formas similares. Aquí, preferiblemente, el término semilla describe granos y semillas. La semilla utilizada puede ser la semilla de las plantas útiles anteriormente mencionadas, pero también la semilla de plantas transgénicas o plantas obtenidas por métodos de reproducción habituales.
- 35 Cuando se emplean para fotoprotección de planta, la cantidad de sustancias activas aplicadas, es decir, las azinas de la fórmula (I), sin auxiliares de formulación, varía, dependiendo el tipo de efecto deseado, de 0.001 a 2 kg por ha, preferiblemente, de 0.005 a 2 kg por ha, más preferiblemente de 0.005 a 0.9 kg por ha y, en particular, de 0.05 a 0.5 kg por ha.
- 40 En otra realización de la invención, la tasa de aplicación de las azinas de la fórmula (I) es de 0.001 a 3 g/ha, preferiblemente, de 0.005 a 2.5 kg/ha de sustancia activa (a.s.).
- 40 En otra realización preferida de la invención, las tasas de aplicación de las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención (cantidad total de azina de la fórmula (I)) son de 0.1 g/ha a 3000 g/ha, preferiblemente, de 10 g/ha a 1000 g/ha, dependiendo del objetivo de control, la estación, las plantas objetivo y la etapa de crecimiento.
- En otra realización preferida de la invención, las tasas de aplicación de las azinas de la fórmula (I) están en el rango de 0.1 g/ha a 5000 g/ha y, preferiblemente, en el rango de 1 g/ha a 2500 g/ha o de 5 g/ha a 2000 g/h.
- 45 En otra realización preferida de la invención, la tasa de aplicación de las azinas de la fórmula (I) es de 0.1 a 1000 g/ha, preferiblemente, de 1 a 750 g/ha, más preferiblemente de 5 a 500 g/ha.
- 50 En el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas, por ejemplo, por espolvoreo, revestimiento o recubrimiento de semillas, en general se requieren cantidades de sustancia activa de 0.1 a 1000 g, preferiblemente, de 1 a 1000 g, más preferiblemente de 1 a 100 g y, aún más preferiblemente de 5 a 100 g por 100 kilogramos de material de propagación vegetal (preferiblemente, semillas).
- En otra realización de la invención, para tratar las semillas, en general se emplea la cantidad de sustancia activa aplicada, es decir, las azinas de la fórmula (I) en cantidades de 0.001 a 10 kg por 100 kg de semilla.

Cuando se utilizan para la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades que se aplican habitualmente para la protección de materiales son de 0.001 g a 2 kg, preferiblemente de 0.005 g a 1 kg, de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

- 5 Dependiendo el método de aplicación en cuestión, las azinas de la fórmula (I) o las composiciones agroquímicas que las comprenden también se pueden utilizar en una cantidad de plantas de cultivo adicionales para eliminar las plantas no deseables. Ejemplos de cultivos adecuados son los siguientes:

10 *Allium cepa*, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Avena sativa*, *Beta vulgaris spec. altissima*, *Beta vulgaris spec. rapa*, *Brassica napus var. napus*, *Brassica napus var. napobrassica*, *Brassica rapa var. silvestris*,
 15 *Brassica oleracea*, *Brassica nigra*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*,
 20 *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*,
 25 *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*,
 30 *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*,
 35 *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus spec.*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus avium*,
 40 *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Prunus armeniaca*, *Prunus cerasus*, *Prunus dulcis* y

45 *Prunus domestica*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Sinapis alba*,
 50 *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (*s. vulgare*), *Theobroma cacao*, *Trifolium pratense*, *Triticum aestivum*, *Triticale*,
 55 *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* y *Zea mays*.

Los cultivos preferidos son *Arachis hypogaea*, *Beta vulgaris spec. altissima*, *Brassica napus var. napus*, *Brassica oleracea*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cynodon dactylon*,
 25 *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hordeum vulgare*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*,
 30 *Medicago sativa*, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Pistacia vera*, *Pisum sativum*, *Prunus dulcis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Solanum tuberosum*,
 35 *Sorghum bicolor* (*s. vulgare*), *Triticale*, *Triticum aestivum*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* y *Zea mays*

Los cultivos especialmente preferidos son cultivos de cereales, maíz, soja, arroz, colza oleaginosa, algodón, papa, maní o cultivos permanentes.

30 Las azinas de la fórmula (I) de acuerdo con la invención o las composiciones agroquímicas que las comprenden también se pueden utilizar en plantas genéticamente modificadas. El término "plantas genéticamente modificadas" se entiende como plantas cuyo material genético fue modificado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante para incluir una secuencia de ADN insertada que no es natural en el genoma de esa especie vegetal o para exhibir una eliminación de ADN que era natural en el genoma de esa especie, en el que las modificaciones no se pueden
 35 obtener fácilmente solo mediante reproducción cruzada, mutagénesis o recombinación natural. Con frecuencia, una planta genéticamente modificada es aquella que obtuvo sus modificaciones genéticas por herencia mediante un proceso de reproducción natural o propagación de una planta ancestral cuyo genoma fue tratado directamente utilizando una técnica de ADN recombinante. Normalmente, se han integrado uno o mas genes en el material genético de una planta genéticamente modificada, con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta Dichas
 40 modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a la modificación dirigida posterior a la traducción de proteína(s), oligopéptidos o polipéptidos, por ejemplo, mediante inclusión de mutaciones de aminoácidos que permiten, disminuyen o promueven la glucosilación o adiciones de polímeros, tales como prenilación, acetilación, farnesilación o fijación de unidades estructurales de PEG.

45 Las plantas que se han modificado mediante reproducción, mutagénesis o ingeniería genética, por ejemplo, se volvieron tolerantes a aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como herbicidas de auxina, tales como dicamba o 2,4-D; herbicidas blanqueadores, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) o inhibidores de fitoeno desaturasa (PDS); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonilureas o imidazolinonas; inhibidores de enolpiruvil shiquimato 3-fosfato sintasa (EPSP), tales como glifosato; inhibidores de glutamina sintetasa (GS), tales como glufosinato; inhibidores de protoporfirinogeno-IX oxidasa; inhibidores de biosíntesis de lípidos, tales como inhibidores de acetil COA carboxilasa (ACCase); o herbicidas de oxinilo (es decir, bromoxinilo o ioxinilo), como resultado de los métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética; adicionalmente, las plantas se vuelven resistentes a múltiples clases de herbicidas mediante múltiples modificaciones genéticas, tales como resistencia a glifosato y glufosinato, o a glifosato y un herbicida de otra clase, tales como inhibidores de ALS, inhibidores de HPPD, herbicidas de auxina o inhibidores de ACCase. Estas
 50 tecnologías de resistencia a los herbicidas se describen, por ejemplo en *Pest Management Science* 61, 2005, 246; 61, 2005, 258; 61, 2005, 277; 61, 2005, 269; 61, 2005, 286; 64, 2008, 326; 64, 2008, 332; *Weed Science* 57, 2009, 108; *Australian Journal of Agricultural Research* 58, 2007, 708; *Science* 316, 2007, 1185; y en las referencias allí citadas. Varias plantas cultivadas se volvieron tolerantes a los herbicidas mediante mutagénesis y métodos

convencionales de reproducción, por ejemplo, colza de verano Clearfield® (Canola, BASF SE, Alemania) que es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox, o girasoles ExpressSun® (DuPont, EE.UU.) que es tolerante a sulfonilureas, por ejemplo, tribenurón. Se han utilizados métodos de ingeniería genética para hacer que las plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, se volvieran tolerantes a herbicidas, tales como glifosato, imidazolinonas y glufosinato, algunos de los cuales están bajo desarrollo o se encuentran disponibles comercialmente con las marcas o nombres comerciales RoundupReady® (tolerante a glifosato, Monsanto, EE.UU.), Cultivance® (tolerante a imidazolinona, BASF SE, Alemania) y LibertyLink® (tolerante a glufosinato, Bayer CropScience, Alemania).

Adicionalmente, también se cubren plantas que son capaces de sintetizar, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una o mas proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género bacteriano Bacillus, particularmente Bacillus thuringiensis, tales como deltaendotoxinas, por ejemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de nematodos colonizantes de bacterias, por ejemplo, Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnido, toxinas de avispa u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomyces; lectinas de plantas, tales como lectinas de arveja o cebada; aglutininas; inhibidores de proteínasa, tales como, inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosoma (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxi-esteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glucosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o HMG-COA-reductasa; bloqueadores del canal iónico, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio; esterasa de hormona juvenil; receptores de la hormona diurética (receptores de helicoquinina); estilbeno sintasa, bibencilo sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas se deben entender expresamente como que también incluyen pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de otro modo modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de proteína (véase, por ejemplo, WO 021015701). Ejemplos adicionales de estas toxinas o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar las toxinas se describen, por ejemplo, en EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/18810 y WO 03/52073. Los métodos para producir estas plantas genéticamente modificadas en general son conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones anteriormente mencionadas. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas genéticamente modificadas imparten a las plantas que producen estas proteínas tolerancia a las plagas perjudiciales de todos los grupos taxonómicos de artrópodos, especialmente a escarabajos (Coleóptera), insectos de dos alas (Díptera) y polillas (Lepidóptera), y nematodos (Nemátoda). Las plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar una o mas proteínas insecticidas se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente, y algunas de las cuales están disponibles comercialmente, tales como YieldGard® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab), YieldGard® Plus (cultivares de maíz que producen las toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Starlink® (cultivares de maíz que producen la toxina Cry9c), Herculex® RW (cultivares de maíz que producen Cry34Ab1, Cry35Ab1 y la enzima fosfinotricin-N-acetiltransferasa [PAT]); NuCOTN® 33B (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® I (cultivares de algodón que producen la toxina Cry1Ac), Bollgard® II (cultivares de algodón que producen las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab2); VIPCOT® (cultivares de algodón que producen una toxina VIP); NewLeaf® (cultivares de papa que producen la toxina Cry3A); Bt-Xtra®, NatureGard®, KnockOut®, BiteGard®, Protectan®, Bt 11 (por ejemplo, Agrisure® CB) y Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Francia, (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1Ab y la enzima PAT), MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Francia (cultivares de maíz que producen una versión modificada de la toxina Cry3A, c.f. WO 03/018810), MON 863 de Monsanto Europe S.A., Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry3Bba), IPC 531 de Monsanto Europe S.A., Bélgica (cultivares de algodón que producen una versión modificada de la toxina Cry1Ac) y 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Bélgica (cultivares de maíz que producen la toxina Cry1F y la enzima PAT).

Adicionalmente, también se cubren las plantas que son capaces de sintetizar, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una o mas proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de dichas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de dichas proteínas son las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo, EP-A 392 225), genes resistentes a las enfermedades de las plantas (por ejemplo, cultivares de papa que expresan genes resistentes que actúan contra Phytophthora infestans derivado de la papa silvestre mexicana Solanum bulbocastanum) o T4-lisozima (por ejemplo, cultivares de papa capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia a bacterias, tales como Erwinia amylovora). Los métodos para producir estas plantas genéticamente modificadas, en general, se conocen por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

Adicionalmente, también se cubren plantas que son capaces de sintetizar, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una o mas proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, producción de biomasa, rendimiento del grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteína), tolerancia a sequía, salinidad u otros factores ambientales que limitan el crecimiento, o la tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.

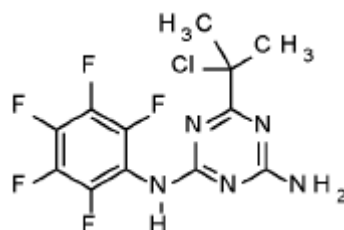
Adicionalmente, también se cubren plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de ingredientes o nuevos ingredientes, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cultivos oleaginosos que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga que mejoran la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo, colza Nexera®, Dow AgroSciences, Canadá).

- 5 Adicionalmente, también se incluyen plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de ingredientes o nuevos ingredientes, específicamente para mejorar la producción de materia prima, por ejemplo, papas que producen una mayor cantidad de amilopectina (por ejemplo, papa Amflora®, BASF SE, Alemania).

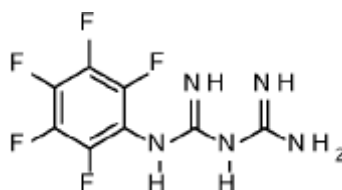
10 La preparación de las azinas de la fórmula (I) se ilustra mediante los ejemplos; sin embargo, la materia objeto de la presente invención no se limita a los ejemplos dados.

A Ejemplos de preparación

Ejemplo 1: 6-(1-cloro-1-metil-etil)-N4-(2,3,4,5,6-pentafluorofenil)-1,3,5-triazina-2,4-diamina



1.1: 1-Carbamimidoil-3-(2,3,4,5,6-pentafluorofenil)guanidina



15 una suspensión de 2,3,4,5,6-pentafluoroanilina (2.00 g, 10.9 mmol) y 1-cianoguanidina (1.10 g, 11.9 mmol) en una mezcla de acetonitrilo y clorhidrato ac. (38% p/p) se calientan a 150°C durante 2 h en un reactor de microondas. La mezcla resultante se agrega cuidadosamente a NaHCO₃ ac., se agrega acetato de etilo y las fases se separan. La fase orgánica se seca sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtra y se concentra bajo presión reducida reproduciendo el compuesto del título como un sólido incoloro (0.97 g, 33.2% de rendimiento). MS (ESI) m/z = 268.1 [M+H⁺]

20

RMN ¹H (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 6.75 (br s, 4H), 5.47 (s, 2H) ppm.

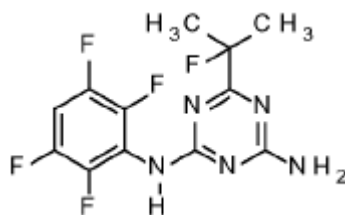
1.2: 6-(1-Cloro-1-metil-etil)-N4-(2,3,4,5,6-pentafluorofenil)-1,3,5-triazina-2,4-diamina

25 Se agrega cloruro de 2-cloro-2-metil-propanoilo (0.69 g, 4.89 mmol) a una solución de 1-carbamimidoil- 3-(2,3,4,5,6-pentafluorofenil)guanidina (1.31 g, 4.89 mmol) en una mezcla de THF y trietilamina (1.49 g, 14.7 mmol). La mezcla de reacción resultante se calienta a 60°C durante 4 h, se enfría a temperatura ambiente y se diluye con agua y acetato de etilo. Las fases se separan y la fase orgánica se seca sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtra y se concentra bajo presión reducida. La cromatografía en columna del producto crudo resultante (ISCO-CombiFlash Rf, ciclohexano/acetato de etilo) produce el compuesto del título deseado como sólido incoloro (0.72 g, 41.8% de rendimiento).

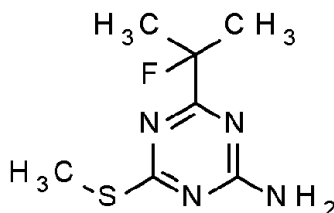
30 MS (ESI) m/z = 354.2 [M+H⁺].

RMN ¹H (400 MHz, H₃COD): δ = 1.85 (s, 6H) ppm.

Ejemplo 2: 6-(1-Fluoro-1-metil-etil)-N4-(2,3,5,6-tetrafluorofenil)-1,3,5-triazina-2,4-diamina



2.1: 4-(1-fluoro-1-metil-etil)-6-metilsulfanil-1,3,5-triazin-2-amina

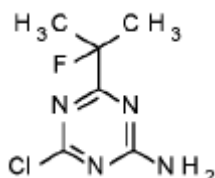


- 5 cloruro de 2-Fluoro-2-metil-propanoilo (23.0 g, 0.18 mol) y trietilamina (93.4 g, 0.92 mol) se agregan a una solución de yodhidrato de 1-carbamimidoil-2-metil-isotiurea (48.0 g, 0.18 mol) en THF a través de dos embudos de adición. Después de que finaliza la reacción exotérmica inicial débil, la mezcla se agita durante 3 h a 50°C. La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, se diluye con agua y acetato de etilo y las fases se separan. La fase orgánica se seca sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtra y se concentra bajo presión reducida reproduciendo el compuesto del título como un sólido incoloro (33.3 g, 89.2% de rendimiento).

10 MS (ESI) m/z 203.3 [M+H⁺]

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 6.82 (brs, 1H), 5.64 (brs, 1H), 1.63 (d, J= 21.0 Hz, 6H) ppm.

2.2: 4-cloro-6-(1-fluoro-1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2-amina

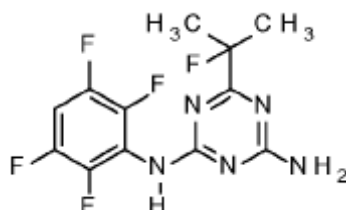


- 15 4-(1-fluoro-1-metil-etil)-6-metilsulfanil-1,3,5-triazin-2-amina (65.0 g, 0.32 mol) se disuelve en ácido acético y se burbujea gas de Cl₂ gas a través de la solución durante 30 min. La mezcla de reacción se agita durante una hora adicional a temperatura ambiente y luego se agrega cuidadosamente a una solución fría de NaOH (130 g) en agua (1 L). Se agrega acetato de etilo y las fases se separan. La fase orgánica se seca sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtra y se concentra bajo presión reducida reproduciendo el compuesto del título como un sólido incoloro (41.3 g, 67.4% de rendimiento).

20 MS (ESI) m/z 191.3 [M+H⁺]

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.12 (brs, 1H), 6.32 (brs, 1H), 1.69 (d, J= 21.8 Hz, 6H) ppm.

2.3: 6-(1-fluoro-1-metil-etil)-N4-(2,3,5,6-tetrafluorofenil)-1,3,5-triazina-2,4-diamina

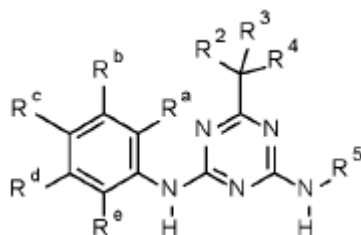


5 Una solución de 4-cloro-6-(1-fluoro-1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2-amina (0.64 g, 2.83 mmol), 2,3,5,6-tetrafluoroanilina (0.51 g 3.11 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (0.21 g, 0.28 mmol) y KOtBu (0.95 g, 8.50 mmol) en dioxano se calienta a 100° C durante 16 h. La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, se diluye con agua y acetato de etilo y las fases se separan. La fase orgánica se seca sobre Na₂SO₄ anhidro, se filtra y se concentra bajo presión reducida. La cromatografía en columna del producto crudo resultante (ISCO-CombiFlash Rf, ciclohexano/acetato de etilo) produce el compuesto del título como sólido incoloro (0.30 g, 31.9% de rendimiento).

MS (ESI) m/z 320.0 [M+H⁺].

RMN ¹H (400 MHz, H₃COD): δ = 7.42 - 7.29 (m, 1 H), 1.61 (d, J = 21.5 Hz, 6H) ppm.

10 Los compuestos enumerados adelante en las tablas 1 y 2 (ejemplos 3 a 311) se han preparado de forma similar a los ejemplos mencionados anteriormente:



I en la que A es A.1 y R¹ es H

Tabla 1

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
3	F	F	F	F	F	H	H	H	H	292.0
4	F	F	F	F	F	H	H	CH ₃	H	305.9
5	F	F	F	F	F	H	CH ₃	CN	H	331.3
6	F	F	H	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	301.9
7	F	F	F	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	320.2
8	F	F	H	F	F	F	F	CH ₃	H	323.9
9	F	F	F	F	F	F	F	CH ₃	H	342.2
10	F	H	F	H	H	F	CH ₃	H	H	270.3
11	F	H	H	F	H	F	CH ₃	H	H	270.1
12	F	H	H	H	F	F	CH ₃	H	H	270.2
13	H	F	H	F	H	F	CH ₃	H	H	270.0
14	F	F	F	H	H	F	CH ₃	H	H	288.2
15	F	H	F	H	F	F	CH ₃	H	H	288.2
16	H	F	F	F	H	F	CH ₃	H	H	288.2
17	F	F	H	F	F	F	CH ₃	H	H	306.2
18	F	F	F	F	F	F	CH ₃	H	H	324.1

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
19	F	H	Br	H	F	F	CH ₃	H	H	349.9
20	F	F	F	H	Br	F	CH ₃	H	H	368.1
21	H	CF ₃	H	CF ₃	H	F	CH ₃	H	H	370.2
22	F	H	F	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	284.2
23	F	H	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H	284.2
24	F	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	284.3
25	H	F	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H	284.0
26	F	F	F	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	302.2
27	F	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	302.3
28	F	H	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	302.2
29	H	F	F	F	H	F	CH ₃	CH ₃	H	302.2
30	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	338.1
31	F	H	H	H	Br	F	CH ₃	CH ₃	H	344,1
32	F	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	317,9
33	F	H	Br	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	364,1
34	F	F	F	H	Br	F	CH ₃	CH ₃	H	382,1
35	Cl	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	300,3
no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
36	Cl	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	318,1
37	F	H	CN	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	291.3
38	F	H	H	H	CN	F	CH ₃	CH ₃	H	291.3
39	F	H	NO ₂	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	311.2
40	F	CH ₃	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	298.0
41	F	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H	280.2
42	F	H	H	H	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H	296.3
43	F	OCH ₃	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	314.0
44	F	OC ₂ H ₅	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	328.3
45	F	H	SCH ₃	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	312.2

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
46	H	CF ₃	H	CF ₃	H	F	CH ₃	CH ₃	H	384.2
47	OCH ₃	H	H	H	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H	308.2
48	F	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H	352.0
49	F	F	F	F	F	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	366.0
50	F	F	F	F	F	F	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	380.1
51	F	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	256.2
52	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	334.2
53	F	F	F	F	F	CH ₃	=CH ₂		H	318.3
54	F	H	H	H	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	264.3
55	F	F	H	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	300.3
56	F	F	F	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	318.1
57	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₃ -		H	332.3
58	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	346.3
59	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	360.3
60	F	F	F	F	F	F	CH ₃	H	H	323.9*
61	F	F	H	H	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H	314.3
62	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	334.1
63	F	F	F	F	F	ciclopropilo	CH ₃	H	H	346.3
64	F	F	F	F	F	CN	CH ₃	CH ₃	H	345.3
65	F	F	F	F	F	CH ₃	CO		H	320.2
66	F	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	H	266.2
67	F	Cl	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	H	300
68	F	F	F	F	F	F	F	CF ₃	H	395.9
69	F	F	F	F	F	OH	CH ₃	H	H	322.1
70	F	H	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	298
71	F	H	CN	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	309
72	F	F	F	F	F	CF ₃	H	H	H	360
73	F	F	F	F	F	CH ₂ CF ₃	H	H	H	374

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
74	F	F	F	F	F	1-CH ₃ -ciclohexilo	H	H	H	406
75	F	F	F	F	F	1-CH ₃ -ciclohexilo	H	H	CO(1-CH ₃ -ciclohexilo)	526
76	Br	H	H	H	Br	F	CH ₃	CH ₃	H	406
77	F	Cl	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	332
78	F	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	300.1
79	F	H	H	CF ₃	H	F	CH ₃	CH ₃	H	334.1
80	F	F	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	298.1
81	F	Cl	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	314.1
82	F	F	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	348.2
83	F	F	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	H	348.1
84	F	F	F	F	F	Cl	CH ₃	H	H	340.1
85	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -		H	278.1
86	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	292.2
87	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	306.2
88	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	374.2
89	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	334.1
90	F	F	F	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	360.1
91	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	316.4
92	F	F	F	F	F	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	348.3
93	t-Bu	H	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	304.4
94	F	H	F	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	298.1
95	F	F	OCH ₃	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	350
96	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	380
97	F	H	Cl	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	318
98	F	H	C≡C H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	308
99	F	CH ₃	Cl	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	332
100	F	H	CH ₃	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	298

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
101	F	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	320
102	F	F	C≡CH	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	344
no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
103	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	478.1
104	F	H	H	H	F	CH ₂ CH ₃	H	H	H	252.2
105	F	H	H	H	F	F	F	F	H	292.1
106	F	Cl	H	H	CF ₃	F	CH ₃	CH ₃	H	368.1
107	CF ₃	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	334.2
108	F	Cl	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	334.1
109	SO ₂ CH ₃	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	344.2
110	F	F	H	H	F	F	CH ₃	H	H	288.1
111	F	F	H	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	336.1
112	F	F	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	318.1
113	CN	H	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	307.1
114	F	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	316.1
115	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	acetilo	380
116	F	H	OCH ₃	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	314
117	F	H	F	H	F	=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -			H	308
118	F	F	H	F	F	=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -			H	326
119	F	F	H	H	F	=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -			H	308
120	F	H	H	H	F	=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -			H	290
121	F	F	F	F	F	F	F	H	H	328.1
122	F	H	H	H	F	F	F	H	H	274.1
123	F	F	H	H	F	F	F	H	H	292.1
124	F	H	H	H	F	CH ₃	=CHCH ₃ [(E) conf]		H	278

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
125	F	F	F	F	F	CH ₃	=CHCH ₃ [(E) conf]		H	332
126	F	Cl	H	H	F	F	F	F	H	326
127	F	F	H	H	F	F	F	F	H	310.1
128	F	F	Cl	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	354
129	Cl	F	H	H	F	F	CH ₃	H	H	304.1
130	F	H	H	H	Br	F	F	F	H	352
131	F	H	H	H	Cl	F	F	F	H	308.1
132	F	F	H	F	F	F	F	F	H	328
133	F	F	F	F	F	F	F	F	H	346.1
134	F	H	F	H	F	F	F	F	H	310
135	CN	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	287.1
136	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	330.2
137	F	H	F	H	F	F	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	316.1
138	F	H	F	H	F	F	F	CH ₃	H	306.1
139	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	324.2
140	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	310.2
141	F	H	F	H	F	H	H	C ₃ H ₅	H	296.2
142	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₃ -		H	296.2
143	F	H	F	H	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	282.2
144	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	324.2
145	F	H	F	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	338.2
146	F	F	F	F	F	F	F	Cl	H	362
147	F	F	F	F	F	Cl	Cl	CH ₃	H	374
148	F	F	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	H	284.1
149	F	H	H	H	CN	F	F	H	H	281.1

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
150	F	F	H	F	F	F	F	H	H	310.1
151	F	H	H	H	CN	F	F	F	H	299.1
152	Cl	F	H	H	F	F	F	H	H	308.1
153	F	Cl	H	H	F	F	F	H	H	308.1
154	Cl	F	H	H	F	F	F	F	H	326
155	F	H	H	H	Metoxicarbo- nilo	F	F	F	H	332.1
156	F	H	F	H	Cl	F	F	H	H	308.1
157	F	H	Br	H	H	F	F	H	H	334
158	F	F	H	H	OCH ₃	F	F	F	H	322.1
159	F	F	Br	F	F	F	F	H	H	389.9
160	F	F	Br	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	396
161	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	376
162	F	F	F	F	F	Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	394
163	F	F	H	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	362
164	F	F	F	F	F	Cl	CH ₂ Cl	CH ₃	H	388
165	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCF ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	428
166	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₂ CH ₃ - (CH ₂) ₂ -		H	388
167	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		H	390
168	F	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	336.1
169	F	F	H	H	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		H	296.2
170	F	H	metoxicarbonilo	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	324.1
171	F	F	H	F	F	(CH ₂) ₄ CH ₃	H	H	H	330.1
172	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	474.1
173	F	H	CO ₂ H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	310.1
174	F	F	F	F	F	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		H	346.1

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ^z	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
175	F	F	F	F	F	F	-(CF2) ₅ -		H	558
176	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	352
177	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHC(CH ₃) ₃ - (CH ₂) ₂ -		H	416
178	F	F	F	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		CH ₃	360
179	F	F	H	F	F	CN	CH ₃	CH ₃	H	327
180	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	H	H	384
181	F	F	H	F	F	CH ₂ CH ₃	H	H	H	288.1
182	F	F	H	H	metoxicar bonilo	F	F	F	H	350.1
183	F	F	Br	F	F	F	F	F	H	408
184	F	F	OH	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	336.1
185	F	H	OH	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	300.1
186	F	F	H	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		H	314.1
187	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	356.1
188	F	F	F	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -		H	364.1
189	F	NO ₂	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	329.1
190	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	342.2
191	3,5- dimetilofen oxi	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	386.1
192	F	F	H	C ₆ H 5	F	F	CH ₃	CH ₃	H	378.1
193	F	F	H	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	316.1
194	F	F	Br	F	F	CH ₃	=CHCH ₃ [(Z) conf]		H	392
195	F	F	Br	F	F	Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	430
196	F	F	H	F	F	CN	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	355
197	F	F	H	H	F	CN	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	H	337
198	F	F	H	F	F	F	H	H	H	292
199	F	H	H	H	F	F	H	H	H	256

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
200	F	F	F	F	F	Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	368
201	F	F	H	F	F	CN	H	H	H	299
202	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	H	H	320
203	F	F	Br	F	F	C ₆ H ₅	H	H	H	428.1
204	F	F	Br	F	F	CH ₂ CH ₃	H	H	H	368
205	F	F	H	F	F	Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	350.2
206	F	F	H	F	F	CH ₃	=CHCH ₃ [(Z) conf]		H	314.2
207	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	acetilo	376.1
208	F	F	H	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	324.2
209	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	420.1
210	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	408
211	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	328.1
212	F	F	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	310.2
213	F	F	F	F	F	=CH-(CH ₂) ₄ -		H	358.1	
214	F	F	H	H	F	CH ₃	=CHCH ₃ [(Z) conf]		H	296.2
215	F	F	Br	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	396
216	F	F	H	F	F	CN	-CH ₂ -CH ₂ -		H	325
217	F	F	Br	F	F	CH ₃	=CH ₂		H	378
218	F	F	Br	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	416
219	F	F	H	F	F	CN	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	355
220	F	H	NO ₂	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	329
221	F	F	CN	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	345
222	F	F	acetilo	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	344
223	F	H	acetilo	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	326
224	Cl	F	H	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H	334.1

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ₅	MS
225	F	F	H	F	F	CH ₃	ciclopropilo	H	H	328.1
226	F	F	F	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	350.1
227	F	Cl	H	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	364.1
228	F	F	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	299.8
229	F	H	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	281.8
230	F	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	317.8
231	F	Cl	H	H	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	315.8
232	F	H	F	H	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	299.8
233	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCF ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	428.2
234	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCF ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	428.2
235	F	Cl	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	336
236	F	H	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	320.5
237	F	F	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	338.5
238	H	H	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	248.4
239	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	338.5
240	F	F	Br	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	435.7
241	F	Cl	H	H	F	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	353.8
242	F	H	H	H	CN	F	CH ₃	H	H	276.8
243	F	F	Br	F	F	Cl	-(CH ₂) ₄ -		H	442.2
244	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	356.6
245	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		H	320.5
246	F	Cl	H	H	CF ₃	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	382.5
247	F	Cl	H	H	CF ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		H	390.6
248	3-metilofenoxi	H	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	316
249	F	F	H	F	F	O(CH ₂) ₂ OC H ₃	H	H	H	347.8

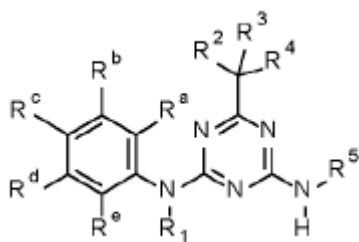
ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
250	F	F	H	F	F	OCH ₂ CH ₃	H	H	H	317,8
251	F	F	F	F	F	O(CH ₂) ₂ OC H ₃	H	H	H	365.7
252	F	F	F	F	F	OCH ₂ CH ₃	H	H	H	335.7
253	F	F	H	F	F	C(CH ₃) ₃	H	H	H	329.8
254	F	F	F	F	F	C(CH ₃) ₃	H	H	H	347.8
255	F	F	H	F	F	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	315.8
256	F	F	F	F	F	CH(CH ₃) ₂	H	H	H	333.7
257	F	F	H	F	F	OCH ₃	H	H	H	304.4
258	F	F	F	F	F	OCH ₃	H	H	H	321.8
259	3-metilofenoxi	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	372.1
260	3-fluorofenoxi	H	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	H	358.2
261	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₅ -		CH ₃	374
262	F	F	I	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	446.6
263	F	F	F	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂)		H	362.5
264	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂)		H	344.5
265	F	CH ₃	H	H	F	F	F	F	H	306.1
266	F	F	CF ₃	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	387.8
267	F	F	F	F	F	H	-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ - CH ₂ -CHCH ₃ -		H	402
268	F	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	334
269	F	F	Br	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	414
270	F	F	F	F	F	CF ₃	CH ₃	H	H	374
271	F	H	CF ₃	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	352
272	F	F	H	F	F	H	H	CH ₂ OC H ₃	H	318.6
273	F	F	F	F	F	H	H	CH ₂ OC H ₃	H	335.7

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	MS
274	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	327.8
275	F	F	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	309.8
276	F	H	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -		H	291.8
277	F	F	H	F	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	341.8
278	F	Cl	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	339.8
279	F	F	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	323,8
280	F	H	H	H	F	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -		H	305.8
281	F	F	Br	F	F	F	-(CH ₂) ₄ -		H	426.4

*(R)-enantiómero



I en la que A es A.1

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	MS
282	F	H	H	H	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	CO(ciclopropilo)	332.3
283	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	COC(CH ₃) ₃	418.3
284	F	H	H	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	COC(CH ₃) ₃	280.2
285	F	F	H	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -		H	CO(ciclopropilo)	368.2
286	F	F	H	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	COC(CH ₃) ₃	400.3
287	F	F	F	F	F	OH	CH ₃	H	H	CH ₃	336.1
288	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCF(CH ₃) ₂	426
289	F	Cl	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCF(CH ₃) ₂	406
290	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	COCH ₃	COCH ₃	422
291	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	380
292	F	F	Br	F	F	CH ₃	H	H	COCH ₂ CH ₃	COCH ₂ CH ₃	478.1

ES 2 599 779 T3

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	MS
293	F	F	Br	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCH(CH ₂) ₂	COCH(CH ₂) ₂	522.2
294	F	F	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	344.1
295	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	COCF(CH ₂ CH ₃)CH ₃	436.1
296	F	H	F	H	F	H	-(CH ₂) ₅ -		H	COCH ₃	366.2
297	F	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	362.1
298	F	H	H	H	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	340.1
299	F	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	326.1
300	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	COCH ₃	COCH ₃	418.1
301	F	F	H	F	F	F	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	COCH ₃	376.1
302	F	F	H	H	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	CO(ciclopentano)	406.2
303	F	F	F	F	F	=CH-CH ₂ -(CH ₂) ₃ -		H		CO(ciclohex-1-ene)	466.3
304	F	F	H	F	F	H	-(CH ₂) ₄ -		H	Ciclopentano-carbonilo	424.2
305	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃	382
306	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ F	384
307	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	352
308	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	366
309	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ C ₆ H ₅	428
310	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ OMe	396
311	F	F	F	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₂ CF ₃	420

Ejemplos de uso

La actividad herbicida de las azinas de la fórmula (I) se demostró mediante los siguientes experimentos de invernadero:

- 5 Los recipientes de cultivo utilizados fueron macetas de plástico que contienen arena arcillosa con aproximadamente 3.0 % de humus como sustrato. Las semillas de las plantas de prueba se sembraron por separado para cada especie.

- 10 Para el tratamiento de emergencia previo, los ingredientes activos, que han suspendido o emulsionado en agua, se aplicaron directamente después de la siembra por medio de boquillas de distribución fina. Los recipientes se regaron suavemente para promover la germinación y el crecimiento, y después se cubrieron con campanas de plástico transparentes hasta que las plantas echaron raíces. Esta cubierta provoca germinación uniforme de las plantas de prueba, a menos que los ingredientes activos la dificulten.

- 15 Para el tratamiento posterior a emergencia, las plantas de prueba se cultivaron primero hasta una altura de 3 a 15 cm, dependiendo el hábito de la planta, y solo luego se trataron con los ingredientes activos que se han suspendido o emulsionado en agua. Para este propósito, las plantas de prueba se sembraron directamente y se cultivaron en los

mismos recipientes, o se cultivaron primero por separado como plántulas y se transplantaron a los recipientes de prueba unos pocos días antes del tratamiento.

Dependiendo de la especie, las plantas se mantuvieron a una temperatura de 10–25°C o 20–35°C, respectivamente.

5 El periodo de prueba se extendió de 2 a 4 semanas. Durante este tiempo, se cuidaron las plantas, y se evaluó su respuesta a los tratamientos individuales.

10 La evaluación se llevo a cabo utilizando una escala de 0 a 100. 100 significa sin emergencia de plantas o destrucción completa de por lo menos las partes aéreas, y 0 significa que no hubo daño o que el crecimiento siguió su curso normal. Una actividad herbicida moderada se obtiene con valores de por lo menos 60; una buena actividad herbicida se da en valores de por lo menos 70; y una muy buena actividad herbicida se da en valores de por lo menos 85.

Las plantas utilizadas en los experimentos de invernadero pertenecen a las siguientes especies:

Código Bayer	Nombre científico
ABUTH	Abutilon theophrasti
AMARE	Amaranthus retroflexus
APESV	Apera spica-venti
CAPBP	Capsella bursa-pastoris
CHEAL	Chenopodium album
ECHCG	Echinochloa crus-galli
GERDI	Geranium dissectum
LAMPU	Lamium purpureum
MATIN	Matricaria maritima
POAAN	Poa annua
POLCO	Polygonum convolvulus
SETFA	Setaria faberi
SETVI	Setaria viridis
STEME	Stellaria media
THLAR	Thlaspi arvense
VIOAR	Viola arvensis

El Ejemplo 1 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y STEME.

15 El Ejemplo 2 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CHEAL y ECHCG.

El Ejemplo 4 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP y LAMPU.

ES 2 599 779 T3

- El Ejemplo 5 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 6 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra POLCO.
- 5 El Ejemplo 7 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y GERDI.
- El Ejemplo 8 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y CHEAL.
- 10 El Ejemplo 9 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y GERDI.
- El Ejemplo 12 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP y VIOAR.
- El Ejemplo 15 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.0625 kg/ha, mostró actividad herbicida moderada contra SETVI.
- 15 El Ejemplo 16 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró buena actividad herbicida contra ABUTH, y actividad herbicida moderada contra STEME.
- El Ejemplo 17 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y POLCO.
- 20 Los Ejemplos 18 y 30 aplicados por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 3 kg/ha, mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH y SETFA.
- El Ejemplo 19 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró buena actividad herbicida contra VIOAR.
- El Ejemplo 22 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró buena actividad herbicida contra VIOAR.
- 25 El Ejemplo 24 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra SETVI y POLCO.
- El Ejemplo 25 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra VIOAR.
- 30 El Ejemplo 26 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra VIOAR y buena actividad herbicida contra CAPBP.
- El Ejemplo 27 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y ECHGC.
- El Ejemplo 28 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- 35 El Ejemplo 29 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró actividad herbicida moderada contra VIOAR.
- El Ejemplo 31 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- 40 El Ejemplo 32 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra GERDI y POLCO.
- El Ejemplo 34 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP y STEME.

ES 2 599 779 T3

- El Ejemplo 35 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y STEME.
- El Ejemplo 36 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- 5 Los Ejemplos 37 y 54 aplicados por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostraron actividad herbicida moderada contra AMARE.
- El Ejemplo 38 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL.
- 10 El Ejemplo 39 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró actividad herbicida moderada contra APESV.
- El Ejemplo 40 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL.
- El Ejemplo 41 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró buena actividad herbicida contra AMARE.
- 15 El Ejemplo 42 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.0625 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 43 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.031 kg/ha, mostró buena actividad herbicida contra AMARE.
- 20 El Ejemplo 44 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- El Ejemplo 46 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra THLAR.
- El Ejemplo 47 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- 25 El Ejemplo 48 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y STEME.
- El Ejemplo 49 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CHEAL y GERDI.
- 30 El Ejemplo 50 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP y STEME.
- El Ejemplo 51 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- El Ejemplo 52 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y GERDI.
- 35 El Ejemplo 53 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y a buena actividad herbicida contra SETFA.
- Los Ejemplos 55 y 56 aplicados por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL.
- 40 El Ejemplo 57 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y ECHCG.
- Los Ejemplos 58 y 59 aplicados por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.125 kg/ha, mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL.

ES 2 599 779 T3

- El Ejemplo 61 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 0.062 kg/ha, mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y POLCO.
- El Ejemplo 62 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.
- 5 El Ejemplo 63 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ECHCG, SETVI y STEME.
- El Ejemplo 64 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y STEME.
- 10 El Ejemplo 66 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 62.5 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 67 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra ABUTH.
- El Ejemplo 68 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, CAPBP y STEME.
- 15 El Ejemplo 69 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 2000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra MATIN y POAAN.
- Los Ejemplos 70 y 77, 82, 89 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.
- 20 El Ejemplo 71 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CHEAL y buena actividad herbicida contra POLCO.
- El Ejemplo 72 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- El Ejemplo 73 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.
- 25 El Ejemplo 75 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 78 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró buena actividad herbicida contra APESV.
- 30 Los Ejemplos 79 y 85, 86, 87 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 80 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, ECHCG y STEME.
- El Ejemplo 81 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.
- 35 El Ejemplo 83 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, ECHCG y STEME.
- Los Ejemplos 84, 110 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y SETFA.
- 40 El Ejemplo 88 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, LAMPU y STEME.
- Los Ejemplos 91, 101, 103, 106, 107, 112 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ECHCG, SETVI y STEME.

ES 2 599 779 T3

Los Ejemplos 92, 136, 137 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.

Los Ejemplos 96, 102, 113, 290, 148, 163 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.

- 5 El Ejemplo 97 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró buena actividad herbicida contra CAPBP y LAMPU.

Los Ejemplos 104, 134 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron buena actividad herbicida contra AMARE.

- 10 El Ejemplo 108 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.

El Ejemplo 111 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, ECHCG y SETVI.

El Ejemplo 114 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 32 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ECHCG, POLCO y SETVI.

- 15 Los Ejemplos 115, 288, 289 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.

El Ejemplo 116 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra APESV y buena actividad herbicida contra AMARE.

- 20 El Ejemplo 117, 120 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró buena actividad herbicida contra AMARE.

Los Ejemplos 118, 125 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.

Los Ejemplos 119, 184 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE.

- 25 El Ejemplo 121 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.

El Ejemplo 123 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra ABUTH y ECHCG.

- 30 El Ejemplo 124 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.

El Ejemplo 126 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra ABUTH.

El Ejemplo 127 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL, y buena actividad herbicida contra POLCO.

- 35 El Ejemplo 128 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra POAAN y buena actividad herbicida contra VIOAR.

Los Ejemplos 129, 133, 170 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE.

- 40 El Ejemplo 132 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, CHEAL y POLCO.

El Ejemplo 135 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.

ES 2 599 779 T3

El Ejemplo 138 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.

Los Ejemplos 139, 140 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostraron buena actividad herbicida contra VIOAR.

- 5 El Ejemplo 141 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y SETFA y buena actividad herbicida contra ECHCG.

El Ejemplo 142 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra ABUTH y SETFA.

- 10 El Ejemplo 143 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y CHEAL, y buena actividad herbicida contra POLCO.

El Ejemplo 146 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, CHEAL y POLCO.

El Ejemplo 147 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.

- 15 El Ejemplo 149 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró buena actividad herbicida contra STEME.

El Ejemplo 150 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y SETFA.

- 20 El Ejemplo 151 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró buena actividad herbicida contra ABUTH.

El Ejemplo 157 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y ECHCG.

El Ejemplo 158 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH.

- 25 El Ejemplo 160 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, LAMPU y STEME.

Los Ejemplos 161, 162, 164 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.

- 30 El Ejemplo 165 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHGC y SETFA.

Los Ejemplos 166, 178, 183, 292, 293 aplicados por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y SETVI.

El Ejemplo 167 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y SETFA, y buena actividad herbicida contra ABUTH.

- 35 Los Ejemplos 168, 176 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.

Los Ejemplos 169, 174 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.

- 40 El Ejemplo 171 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, ECHCG y STEME.

El Ejemplo 172 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y ECHCG, y buena actividad herbicida contra ABUTH.

ES 2 599 779 T3

- El Ejemplo 173 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró buena actividad herbicida contra ECHCG.
- El Ejemplo 175 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 494 g/ha mostró buena actividad herbicida contra APESV.
- 5 El Ejemplo 177 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra SETFA.
- Los Ejemplos 179, 186, 187 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- 10 El Ejemplo 180 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.
- Los Ejemplos 181, 202 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- Los Ejemplos 188, 190, 294, 295 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.
- 15 El Ejemplo 189 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 507 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- El Ejemplo 191 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- 20 El Ejemplo 192 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- El Ejemplo 193 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y ECHCG.
- El Ejemplo 194 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró buena actividad herbicida contra SETFA.
- 25 El Ejemplo 195 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, y buena actividad herbicida contra ABUTH y ECHCG.
- Los Ejemplos 196, 201 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.
- 30 El Ejemplo 197 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró buena actividad herbicida contra SETFA.
- El Ejemplo 198 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 119 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 200 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CACBP, ECHCG y POLCO.
- 35 Los Ejemplos 204, 213 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 205 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.
- 40 El Ejemplo 206 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.
- El Ejemplo 207 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, SETVI y STEME.

ES 2 599 779 T3

El Ejemplo 209 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra STEME, y buena actividad herbicida contra CAPBP y VIOAR.

El Ejemplo 210 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra CAPBP, STEME y VIOAR.

- 5 El Ejemplo 212 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.

El Ejemplo 216 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, y buena actividad herbicida contra ABUTH y SETFA.

- 10 Los Ejemplos 218, 226, 230 aplicados por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostraron muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y SETFA.

El Ejemplo 219 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 250 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.

El Ejemplo 220 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró buena actividad herbicida contra SETFA.

- 15 El Ejemplo 228 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.

El Ejemplo 283 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 62 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra SETVI.

- 20 El Ejemplo 285 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 62 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y buena actividad herbicida contra CHEAL.

El Ejemplo 286 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra ABUTH, AMARE y SETFA.

El Ejemplo 291 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 2000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra MATIN y POAAN.

- 25 El Ejemplo 302 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y ECHCG, y buena actividad herbicida contra ABUTH.

El Ejemplo 303 aplicado por el método posterior a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró buena actividad herbicida contra ABUTH y AMARE.

- 30 El Ejemplo 304 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 1000 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE, ECHCG y SETFA.

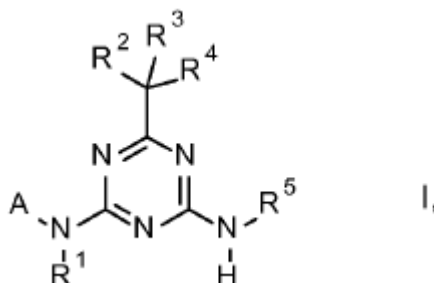
El Ejemplo 305 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 500 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra POLCO, STEME y VIOAR.

El Ejemplo 307 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE y SETFA.

- 35 El Ejemplo 308 aplicado por el método previo a emergencia a una tasa de aplicación de 125 g/ha mostró muy buena actividad herbicida contra AMARE.

REIVINDICACIONES

1. Azinas de la fórmula (I)



5 en la que A es 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a cuatro sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo y (alcoxi C₁-C₆)carbonilo;

10 R¹ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

R² H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

R³ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

15 R⁴ H, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; o

R³ y R⁴ juntos con el átomo de carbono al cual se adhieren forman una unidad estructural seleccionada del grupo que consiste de carbonilo, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ y heterociclilo de tres a seis miembros,

20 en el que el cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆ o y heterociclilo de tres a seis miembros es no sustituido o sustituido por uno a tres sustituyentes seleccionados de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

R⁵ H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo,

en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

25 que incluye sus sales o N-óxidos agrícolamente aceptables.

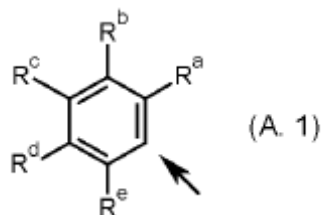
2. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el que A es 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo, amino, (alquilo C₁-C₆)amino, di(alquilo C₁-C₆)amino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo.

30 3. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en el que R¹ y R⁵ independientemente uno del otro son H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, (alquilo C₁-C₆)carbonilo o (alquilo C₁-C₆)sulfonilo.

4. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que R² es H, halógeno, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆.

35 5. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que A es 2-fluoro-fenilo, que se sustituye por uno a tres sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆.

6. Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en los que R¹ y R⁵ son H, A es

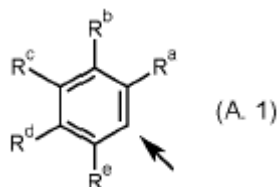


R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R³ y R⁴ tienen los siguientes significados:

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
1	F	F	F	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
2	F	F	H	F	F	F	CH ₃	CH ₃
3	F	H	H	H	F	F	CH ₃	CH ₃
4	F	F	H	F	F	H	CH ₃	ciclopropilo
5	F	F	H	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
6	F	F	F	F	F	H	CH ₃	CF ₃

5

7. Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en los que R¹ y R⁵ son H, A es



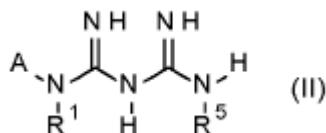
R^a, R^b, R^c, R^d, R^e, R², R³ y R⁴ tienen los siguientes significados:

10

no	R ^a	R ^b	R ^c	R ^d	R ^e	R ²	R ³	R ⁴
7	F	F	H	F	F	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
8	F	F	H	F	F	F	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
9	F	F	F	F	F	H	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
10	F	F	H	F	F	F	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	
11	F	H	H	F	F	F	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	

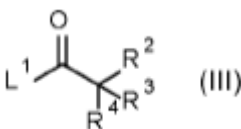
8. Un proceso para la preparación de azinas de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

R¹ y R⁵ independientemente uno del otro son H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; y A, R², R³ y R⁴ son como se definen en las reivindicaciones 1 a 7; al hacer reaccionar biguanidinas de la fórmula (II)



5 en la que A es como se define en las reivindicaciones 1 a 7; y

R¹ y R⁵ independientemente uno del otro son H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; con compuestos de carbonilo de la fórmula (III)



en la que R², R³ y R⁴ son como se definen en las reivindicaciones 1, 3, 4, 6 o 7, y

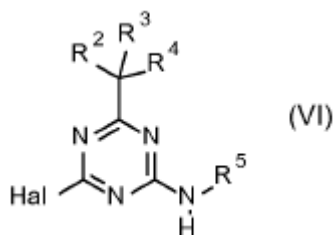
10 L¹ es halógeno, CN, alcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆ o alcoxycarboniloxi C₁-C₆; en la presencia de una base.

9. Un proceso para la preparación de azinas de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

R¹ y R⁵ independientemente uno del otro son H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

y A, R², R³ y R⁴ son como se definen en las Reivindicaciones 1 a 7;

15 mediante reacción de halotriazinas de la fórmula (VI),



en la que R², R³ y R⁴ son como se definen en las Reivindicaciones 1, 3, 4, 6 o 7;

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; y

Hal es halógeno;

20 con aminas de la fórmula (V),



en la que A es como se define en las Reivindicaciones 1 a 7, y

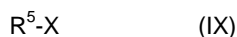
R¹ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;

en la presencia de una base y un catalizador.

10. Un proceso para la preparación de azinas de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

R⁵ es CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

5 mediante reacción de azinas de la fórmula (I), en la que R⁵ es hidrógeno,
con un compuesto de la fórmula (IX)



en la que

R⁵ es CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)-sulfonilo o fenilsulfonilo,

10 en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

X es halógeno o oxicarbonil-alquilo C₁-C₆.

11. Un proceso para la preparación de azinas de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

R¹ es CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)sulfonilo o fenilsulfonilo, en el que

15 el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

mediante reacción de azinas de la fórmula (I), en la que R¹ es hidrógeno,

con un compuesto de la fórmula (X)



20 en la que

R¹ es CN, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)-sulfonilo o fenilsulfonilo,

en el que el fenilo es no sustituido o sustituido por uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste de halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆; y

X es halógeno o oxicarbonil-alquilo C₁-C₆.

25 12. Una composición agroquímica que comprende una cantidad herbicidamente activa de por lo menos una azina de la fórmula I como se reivindica en la reivindicación 1 y por lo menos un portador líquido y/o sólido inerte y, si es apropiado, por lo menos una sustancia de superficie activa.

30 13. Un proceso para la preparación de composiciones agroquímicas activas herbicidas, que comprende mezclar una cantidad herbicidamente activa de por lo menos una azina de la fórmula I como se reivindica en la reivindicación 1 y por lo menos un portador líquido y/o sólido inerte y, si se desea, por lo menos una sustancia de superficie activa.

14. Un método para controlar la vegetación no deseada, que comprende permitir que una cantidad herbicidamente activa de por lo menos una azina de la fórmula I como se reivindica en la reivindicación 1 para actuar sobre las plantas, su ambiente o sobre semilla.

35 15. El uso de la azina de la fórmula I como se reivindica en la reivindicación 1 como herbicidas o para la desecación/defoliación de plantas.