

(12) Ausschließungspatent

(11) DD 283 546 A5



Erteilt gemäß § 17 Absatz 1 Patentgesetz
der DDR vom 27.10.1983
in Übereinstimmung mit den entsprechenden
Festlegungen im Einigungsvertrag

5(51) ~~A 01 N 37/52~~ C 07 D 213/643
A 01 N 31/14 C 07 D 307/42
A 01 N 43/40
A 01 N 43/08
C 07 C 257/04

DEUTSCHES PATENTAMT

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

(21) DD A 01 N / 321 851 6
(31) 122,877
263,605

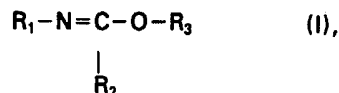
(22) 16.11.88
(32) 17.11.87
31.10.88

(44) 17.10.90
(33) US

(71) siehe (73)
(72) Broadhurst, Michael D.; Cromartie, Thomas H.; Fisher, Karl J.; Haag, William G.; Kanne, David B.; Leadbet-
ter, Michael R., US
(73) ICI AMERICAS INC. Wilmington, Delaware 19897, US
(74) Internationales Patentbüro Berlin, Wallstraße 23/24, Berlin, 1020, DD

(54) Insektizide Zusammensetzung

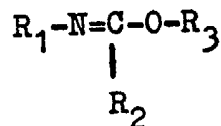
(55) starke insektizide Wirkung; Anwendung zur Insektenbekämpfung in Gartenbau, Land- und Forstwirtschaft
(57) Die Erfindung betrifft insektizide Zusammensetzungen für die Bekämpfung von Insekten im Gartenbau sowie in der Land- und Forstwirtschaft. Die insektiziden Zusammensetzungen werden aufgebracht auf Insekten, den Ort, wo sich Insekten aufhalten oder wo eine Insektenbekämpfung gewünscht wird. Sie sind besonders wirksam gegen Insekten der Ordnung Lepidoptera, der Ordnung Coleoptera und Hemiptera. Erfindungsgemäß enthalten die neuen insektiziden Zusammensetzungen als Wirkstoff eine insektizid wirksame Menge einer Verbindung der Formel,



worin R_1 , R_2 und R_3 die in der Beschreibung und in den Ansprüchen angegebene Bedeutung aufweisen und einen geeigneten Verdünner oder Träger.

Patentansprüche:

1. Insektizide Zusammensetzung, **dadurch gekennzeichnet**, daß sie besteht
(a) aus einer insektizid wirkenden Menge einer Verbindung der Formel



(I)

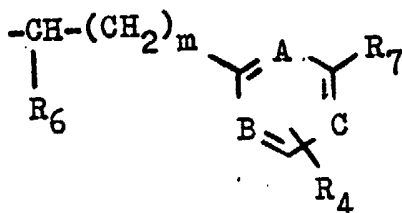
worin

R_1 ist Naphthyl, wahlweise substituiert mit bis zu 2 Halogenen; oder Phenyl, wahlweise substituiert durch ein oder mehrere von:

C_2-C_5 -Alkoxycarbonyl, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, C_2-C_5 -Alkylcarbonyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_3-C_6 -Cycloalkyl, Phenyl, monosubstituiertes Phenyl, Pyridyloxy, C_2-C_4 -Alkylendioxy, C_1-C_4 -Alkylendioxy, C_1-C_3 -Halogenalkylendioxy, C_2-C_4 -Alkyl-, Amido, Nitro, Cyan, bis zu zwei C_1-C_4 -Alkylthio-Gruppen, bis zu zwei C_1-C_4 -Alkylthio-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Alkoxy-Gruppen bis zu drei C_1-C_4 -Halogenalkoxy-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Alkyl-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Halogenalkyl-Gruppen, oder bis zu fünf Halogenen;

R_2 ist Methyl; Ethyl; n-Propyl; Verzweigtes C_3-C_7 -Alkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl; Cyclopropyl, wahlweise substituiert mit bis zu vier Methyl-Gruppen oder bis zu zwei Halogenen; Cyclobutyl; Cyan; C_2-C_4 -Alkoxyalkyl; C_2-C_3 -Alkenyl oder C_2-C_3 -Halogenalkenyl;

R_3 ist



(a)

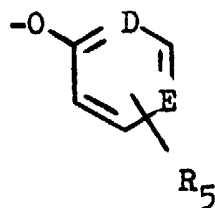
worin m 0 oder 1 ist;

A, B und C sind jedes Kohlenstoff oder Stickstoff, vorausgesetzt, daß A, B oder C nicht alle Stickstoff sind, und wenn zwei von A, B oder C Stickstoff sind, dann A und C;

R_4 ist Wasserstoff oder Halogen;

R_6 ist Wasserstoff, Methyl, Fluor oder Ethinyl;

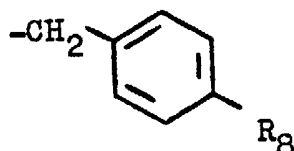
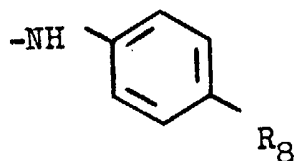
R_7 ist

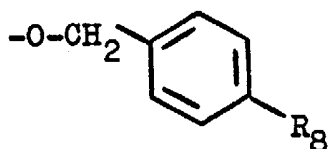


(i)

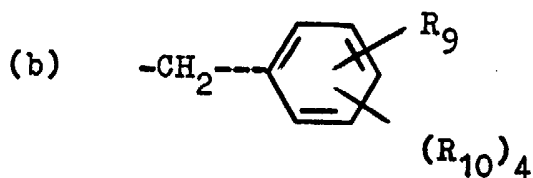
worin D und E jeder Kohlenstoff oder Stickstoff sind, vorausgesetzt, daß nicht D und E gleichzeitig Stickstoff sind und weiter vorausgesetzt, daß, wenn A, B oder C Stickstoff ist, dann sind D und E beide Kohlenstoff;

R_5 ist Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, Trifluormethyl, Cyan, C_1-C_4 -Alkylthio, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl oder Mono- oder Polyhalogen;



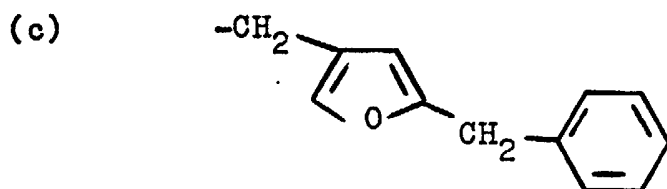


worin R_8 Wasserstoff oder Halogen ist;
(iii) $-O-CH_2-CH=CH_2$;

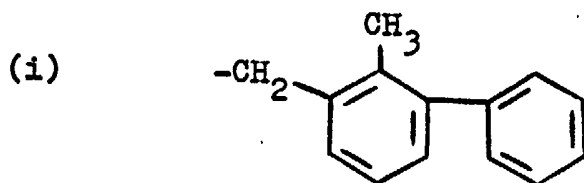


worin

- (i) R_9 ist 4-Fluor, 4-Methoxymethyl oder 4-Propargyl R_{10} ist Fluor
- (ii) R_9 ist 3- oder 4-Allyl, 3- oder 4-Propargyl oder 3- oder 4-(Mono- oder Dihalogen-allyl) und R_{10} ist Wasserstoff oder Fluor;

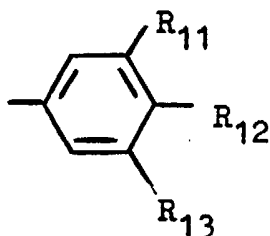


- (d) 4-Phenoxy-but-2-in-2-yl;
- (e) 3-Brom-4-fluor-benzyl;
- (f) 4-Benzyloxy-benzyl;
- (g) 4-(4-Fluor-benzyloxy)benzyl;
- (h) 4-(4-Trifluormethyl-pyrid-2-yloxy)benzyl;



vorausgesetzt, daß

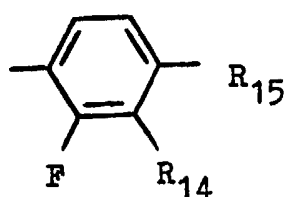
- (i) R_1 ist nicht 2,3-Dichlor-phenyl, 2,6-Difluor-phenyl, 2,6-Bis(C_{11} - C_4 -alkyl)phenyl, 2,4,6-Tribrom-phenyl oder 2,4,6-Tris-(C_1 - C_4 -alkoxy)phenyl;
 - (ii) wenn R_2 tert-Butyl ist, ist R_1 nicht Phenyl, m-Tolyl, 4-Butyl-phenyl oder 4-tert-Butyl;
 - (iii) wenn R_2 eine C_5 -Alkyl-Gruppe ist, dann ist R_1 nicht 4-Isopropyl-phenyl und (b) aus einem insektizid geeigneten Verdünner oder Träger.
2. Zusammensetzung gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß in den Verbindungen der Formel I R_1 ist



worin R_{11} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_2 - C_5 -Alkoxycarbonyl, C_2 - C_5 -Alkylcarbonyl, Nitro, Cyan; R_{12} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, Nitro, Cyan, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_2 - C_5 -Alkylcarbonyl oder C_2 - C_5 -Alkoxycarbonyl; R_{13} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Halogenalkyl oder

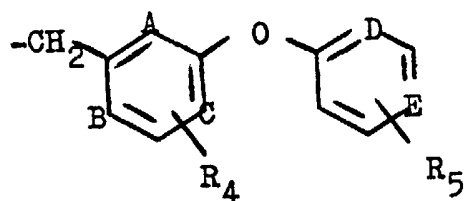
C₁-C₄-Alkoxy, oder R₁₁ und R₁₂ sind zusammen C₁-C₄-Alkylendioxy, C₂-C₄-Alkylen, C₁-C₄-Alkylendioxy, Halogen-C₁-C₃-Alkylendioxy; vorausgesetzt, daß R₁₁, R₁₂ und R₁₃ nicht alle Wasserstoff sind.

3. Zusammensetzung gemäß Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁₃ Wasserstoff ist, und R₁₁ und R₁₂ sind etwas anderes als Wasserstoff.
4. Zusammensetzung gemäß Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁₁ und R₁₃ Wasserstoff sind.
5. Zusammensetzung gemäß Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁₂ und R₁₃ Wasserstoff sind.
6. Zusammensetzung gemäß Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁₂ Halogen und R₁₃ Wasserstoff ist.
7. Zusammensetzung gemäß Anspruch 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁₁ Chlor, R₁₂ Fluor und R₁₃ Wasserstoff ist.
8. Zusammensetzung gemäß Anspruch 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₁ ist

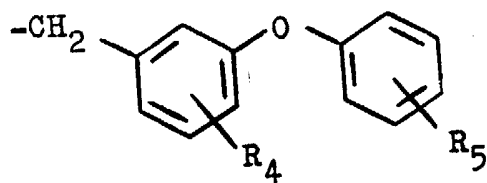


worin R₁₄ Halogen und R₁₅ Wasserstoff oder Halogen ist.

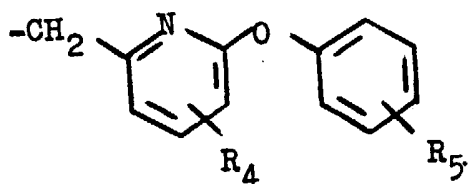
9. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₃ ist.



10. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-9, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₃ ist

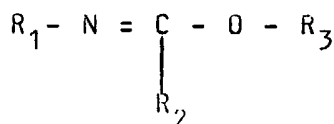


11. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8 oder 10, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₄ und R₅ beide Wasserstoff sind.
12. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8 oder 10, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₄ und R₅ beide 4-Fluor sind.
13. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8 oder 10, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₄ 4-Fluor und R₅ 4-Chlor ist.
14. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8 oder 10, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₄ Wasserstoff und R₅ 4-Halogen ist.
15. Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1-8 oder 10; **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₄ 4-Fluor und R₅ Wasserstoff ist.
16. Zusammensetzung gemäß Anspruch 14, **dadurch gekennzeichnet**, daß in den Verbindungen der Formel I R₃ ist



R_4 ist Wasserstoff, und R_5 ist Wasserstoff oder 4-Halogen.

17. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten, **dadurch gekennzeichnet**, daß eine insektizid wirkende Menge einer Verbindung oder Zusammensetzung gemäß einem der Ansprüche 1–16 auf ein Insekt, den Ort eines Insektes oder den Ort, an dem eine Insektenbekämpfung gewünscht wird, aufgebracht wird.
18. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten gemäß Anspruch 17, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Insekt ein Mitglied der Ordnung **Lepidoptera** ist.
19. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten gemäß Anspruch 17, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Insekt ein Mitglied der Ordnung **Coleoptera** ist.
20. Verfahren zur Bekämpfung von Insekten gemäß Anspruch 17, **dadurch gekennzeichnet**, daß das Insekt ein Mitglied der Ordnung **Hemiptera** ist.
21. Verfahren zur Herstellung einer Verbindung der Formel



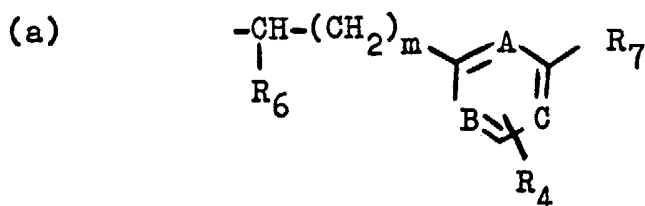
(I),

worin

R_1 ist Naphthyl, wahlweise substituiert mit bis zu 2 Halogenen; oder Phenyl, wahlweise substituiert durch ein oder mehrere von:

C_2 – C_5 -Alkoxy-carbonyl, C_1 – C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 – C_4 -Halogenalkylsulfonyl, C_2 – C_5 -Alkylcarbonyl, C_2 – C_4 -Alkenyl, C_1 – C_4 -Halogenalkylthio, C_3 – C_6 -Cycloalkyl, Phenyl, monosubstituiertes Phenyl, Pyridyloxy, C_2 – C_4 -Alkylendioxy, C_1 – C_4 -Alkylendioxy, C_1 – C_5 -Halogenalkylendioxy, C_2 – C_4 -Alkylen, Amido, Nitro, Cyan, bis zu zwei C_1 – C_4 -Alkylthio-Gruppen, bis zu drei C_1 – C_4 -Alkoxy-Gruppen, bis zu drei C_1 – C_4 -Halogenalkoxy-Gruppen, bis zu drei C_1 – C_4 -Alkyl-Gruppen, bis zu drei C_1 – C_4 -Halogenalkyl-Gruppen, oder bis zu fünf Halogenen; R_2 ist Methyl; Ethyl; n-Propyl; Verzweigtes C_3 – C_7 -Alkyl; C_1 – C_5 -Halogenalkyl; Cyclopropyl, wahlweise substituiert mit bis zu vier Methyl-Gruppen oder bis zu zwei Halogenen; Cyclobutyl; Cyan; C_2 – C_4 -Alkoxyalkyl; C_2 – C_3 -Alkenyl oder C_2 – C_3 -Halogenalkenyl;

R_3 ist



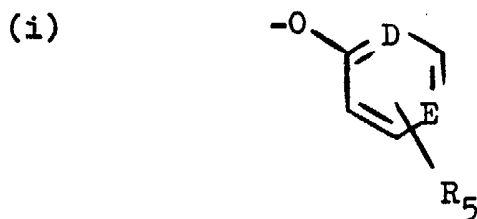
worin m 0 oder 1 ist;

A, B und C sind jedes Kohlenstoff oder Stickstoff, vorausgesetzt, daß A, B oder C nicht alle Stickstoff sind, und wenn zwei von A, B oder C Stickstoff sind, dann A und C;

R_4 ist Wasserstoff oder Halogen;

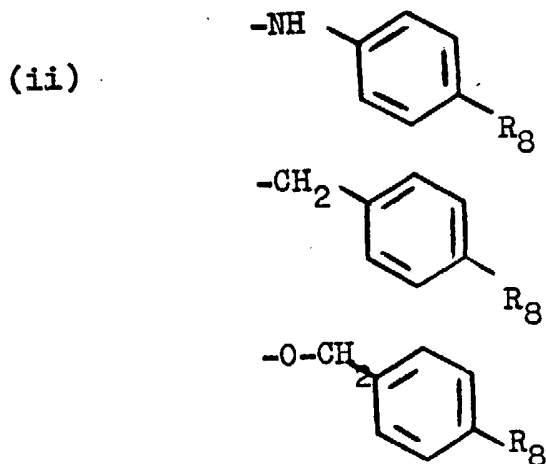
R_6 ist Wasserstoff, Methyl, Fluor oder Ethinyl;

R_7 ist

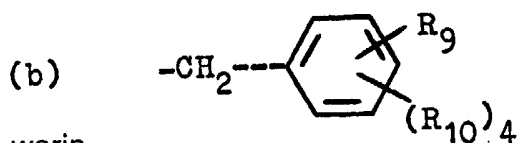
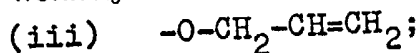


worin D und E jeder Kohlenstoff oder Stickstoff sind, vorausgesetzt, daß nicht D und E gleichzeitig Stickstoff sind und weiter vorausgesetzt, daß, wenn A, B oder C Stickstoff ist, dann sind D und E beide Kohlenstoff;

R₅ ist Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Trifluormethyl, Cyan, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder Mono- oder Polyhalogen;



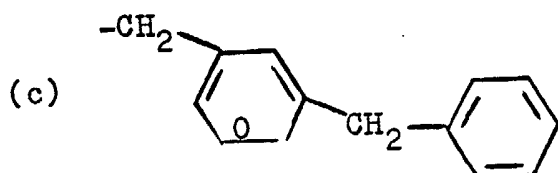
worin R₈ Wasserstoff oder Halogen ist;



worin

(i) R₉ ist 4-Fluor, 4-Methoxymethyl oder 4-Propargyl R₁₀ ist Fluor

(ii) R₉ ist 3- oder 4-Allyl, 3- oder 4-Propargyl oder 3- oder 4-(Mono- oder Dihalogen-allyl) und R₁₀ ist Wasserstoff oder Fluor;



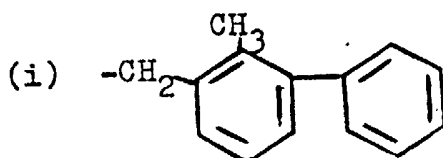
(d) 4-Phenoxy-but-2-in-2-yl;

(e) 3-Brom-4-fluor-benzyl;

(f) 4-Benzyloxy-benzyl;

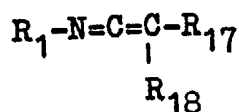
(g) 4-(4-Fluor-benzyloxy)benzyl;

(h) 4-(4-Trifluormethyl-pyrid-2-yloxy)benzyl;



vorausgesetzt, daß

- (i) R_1 ist nicht 2,3-Dichlor-phenyl, 2,6-Difluor-phenyl, 2,6-Bis(C_{11} - C_4)alkylphenyl, 2,4,6-Tribrom-phenyl oder 2,4,6-Tris-(C_1 - C_4 -alkoxy)phenyl;
- (ii) wenn R_2 tert-Butyl ist, ist R_1 nicht Phenyl, m-Tolyl, 4-Butyl-phenyl oder 4-tert-Butyl;
- (iii) wenn R_2 eine C_5 -Alkyl-Gruppe ist, dann ist R_1 nicht 4-Isopropyl-phenyl, dadurch gekennzeichnet, daß eine Verbindung der Formel



mit einem Alkohol der Formel R_3-OH in Gegenwart einer Alkylmetallbase umgesetzt wird, wobei R_{17} und R_{18} unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, Halogen, C_1 - C_5 -Halogenalkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_2 -Alkenyl oder C_2 -Halogenalkenyl sind, oder R_{17} oder R_{18} sind zusammen eine C_2 - C_3 -Alkylen-Kette, wahlweise substituiert durch bis zu 4 Methyl-Gruppen oder bis zu 2 Halogenen.

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft insektizide Zusammensetzungen mit einem insektizid wirkenden Anteil an Verbindungen vom Imidat-Typ.

Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen werden angewandt für die Insektenbekämpfung im Gartenbau sowie in der Land- und Forstwirtschaft.

Charakteristik des bekannten Standes der Technik

Es sind keine Angaben darüber bekannt, welche Verbindungen mit insektizider Wirkung bisher zur Insektenbekämpfung im Gartenbau und in der Land- und Forstwirtschaft angewandt wurden.

Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist die Bereitstellung neuer Zusammensetzungen mit starker insektizider Wirkung für die Bekämpfung von Insekten im Gartenbau sowie in der Land- und Forstwirtschaft.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit starker insektizider Wirkung aufzufinden, die als Wirkstoff in insektiziden Zusammensetzungen geeignet sind.

Erfindungsgemäß werden als Wirkstoff in den neuartigen insektiziden Zusammensetzungen neue Verbindungen vom Imidat-Typ angewandt. Sie sind gekennzeichnet durch die Formel



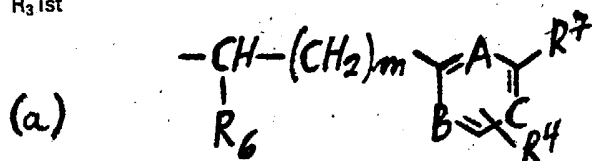
R_1 ist eine wahlweise substituierte Aryl-Gruppe, in der die Substituenten Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, Nitro, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_2 - C_5 -Alkoxy-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylthio, Cyan, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, C_2 - C_5 -Alkyl-carbonyl, C_2 - C_4 -Alkylenoxy, C_1 - C_4 -Alkylendioxy, C_1 - C_3 -halogen-substituiertes Alkylendioxy, Phenyl, monosubstituiertes Phenyl, Pyridyloxy, C_2 - C_4 -Alkylen, C_2 - C_4 -Alkenyl und/oder Amido; R_2 ist C_1 - C_7 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, mono- oder polyhalogen- oder methyl-substituiertes Cyclopropyl, Cyan, C_2 - C_4 -Alkoxyalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl oder C_2 - C_6 -Alkenyl;

R_3 ist (a) ein wahlweise substituiertes 3-Phenoxy-phenylalkyl, 3-Phenoxy-pyridylalkyl, 3-(Pyridyloxy)phenylalkyl, 3-Anilinophenylalkyl, 3-Benzyl-phenylalkyl oder Benzyl-oxy-phenylalkyl; (b) Benzylfurylmethyl; (c) 3- oder 4-substituiertes Benzyl oder Tetrafluorbenzyl; (d) 4-Phenoxy-but-2-in-2-yl; (e) 2-Methyl-3-phenyl-benzyl; (f) 4-(4-Trifluormethyl-pyrid-2-yl-oxy)benzyl. Verbindungen dieser Erfindung zeigen Aktivität bei der Bekämpfung verschiedener Arten von Insekten, einschließlich Lepidoptera, Hemiptera und Coleoptera, besonders bei Aufbringung auf die Blätter.

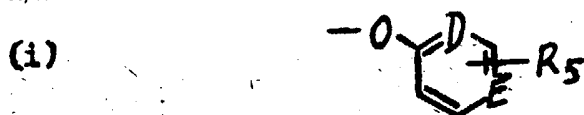
Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen bestehen aus einer insektizid wirkenden Menge einer Verbindung der Formel I und einem insektizid geeigneten Verdünner oder Träger.

In einem weiteren Aspekt beinhaltet diese Erfindung eine Methode zur Bekämpfung von Insekten durch Aufbringen einer insektizid wirkenden Menge einer Verbindung oder Zusammensetzung dieser Erfindung auf die Stelle, wo die Bekämpfung gewünscht ist.

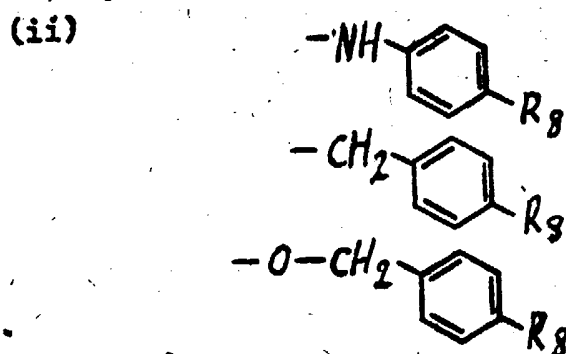
Der Terminus „Insekten“, wie er hier verwendet wird, bezieht sich auf die breite und allgemeinverständliche Anwendung, und weniger auf die Kreaturen, die im streng biologischen Sinne als Insekten klassifiziert werden. Zusätzlich zu denen, die zur Klasse der Insekten gehören, schließt dieser Terminus einige Klassen von Akariden wie Milben und ähnliche ein. Insbesondere sind Verbindungen der Formel (I) jene, in denen: R_1 ist Naphthyl, wahlweise substituiert durch bis zu zwei Halogenen; oder Phenyl, wahlweise substituiert durch einen oder mehrere folgender Substituenten: C_2-C_6 -Alkoxy-carbonyl, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, C_2-C_6 -Alkylcarbonyl, C_2-C_4 -Alkenyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_3-C_6 -Cycloalkyl, Phenyl, monosubstituiertes Phenyl, Pyridyloxy, C_2-C_4 -Alkylendioxy, C_1-C_3 -Halogenalkylendioxy, C_2-C_4 -Alkylen, Amido, Nitro, Cyan, bis zwei C_1-C_4 -Alkylthio-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Alkoxy-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Halogenalkoxy-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Alkyl-Gruppen, bis zu drei C_1-C_4 -Halogenalkyl-Gruppen oder bis zu fünf Halogenen; R_2 ist Methyl; Ethyl; n-Propyl; C_3-C_7 -Alkyl (verzweigt); C_1-C_6 -Halogenalkyl; Cyclopropyl, wahlweise substituiert durch bis zu 4 Methyl-Gruppen, bis zu zwei Halogenen; Cyclobutyl; Cyan; C_2-C_4 -Alkoxyalkyl; C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Halogenalkenyl; R_3 ist



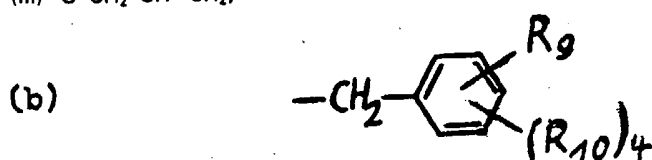
worin m 0 oder 1 ist; A, B und C sind jeder Kohlenstoff oder Stickstoff, vorausgesetzt, A, B und C sind nicht alle Stickstoff, und wenn zwei von den A, B oder C oder C Stickstoff sind, dann sind es A und C; R_4 ist Wasserstoff, Mono- oder Dihalogen; R_6 ist Wasserstoff, Methyl, Fluor oder Ethinyl; R_7 ist



worin D und E jeder Kohlenstoff oder Stickstoff sind, vorausgesetzt, daß nicht beide, D und E, Stickstoff sind, und weiter vorausgesetzt, daß, wenn eines von den A, B oder C Stickstoff ist, dann sind D und E beide Kohlenstoff; R_5 ist Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, Trifluormethyl, Cyan, C_1-C_4 -Alkylthio, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl oder Mono- oder Polyhalogen;

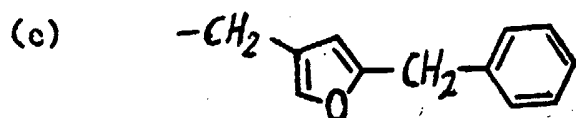


worin R_8 Wasserstoff oder Halogen ist;
(iii) $-O-CH_2-CH=CH_2$;



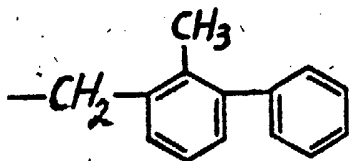
worin

- (i) R_9 ist 4-Fluor, 4-Methoxymethyl oder 4-Propargyl und R_{10} ist Fluor oder
(ii) R_9 ist 3- oder 4-Allyl, 3- oder 4-Propargyl oder 3- oder 4-(Mono- oder Dihalogen)allyl, und R_{10} ist Wasserstoff oder Fluor;



- (d) 4-Phenoxy-but-2-in-yl;
 (e) 3-Brom-4-fluor-benzyl;
 (f) 4-Benzyloxy-benzyl;
 (g) 4(4-Fluor-benzyloxy)benzyl;
 (h) 4-(4-Trifluormethyl-pyrid-2-yloxy)benzyl;

(j)



vorausgesetzt, daß

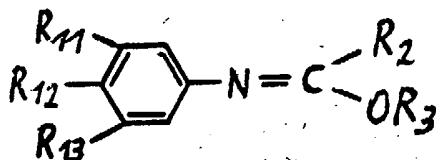
(i) R_1 ist nicht 2,3-Dichlor-phenyl, 2,6-Difluor-phenyl, 2,6-Bis(C_1 - C_4 -alkyl)phenyl, 2,4,6-Tribrom-phenyl oder 2,4,6-Tris-(C_1 - C_4 -alkoxy)phenyl;

(ii) wenn R_2 tert-Butyl ist, ist R_1 nicht Phenyl, 3-Methylphenyl, 4-Butyl-phenyl oder 4-tert-Butyl-phenyl; und

(iii) wenn R_2 eine C_5 -Alkyl-Gruppe ist, dann ist R_1 nicht 4-Isopropyl-phenyl.

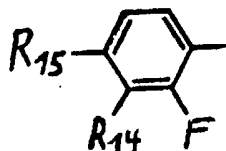
Eine bevorzugtere Verbindungsklasse ist diejenige, in der der Rest R_1 in beiden o-Stellungen des Phenyl-Rings keine Substituenten enthält, das heißt, in denen R_1 im Phenyl-Ring nicht 2,6-disubstituiert, 2,3,6-trisubstituiert oder 2,4,6-trisubstituiert ist.

Eine noch bevorzugtere Klasse ist diejenige, in der der Phenyl-Ring von R_1 in 3-, 4- und/oder 5-Stellung, einschließlich mono-, di- und trisubstituierter Phenyl-Verbindungen wie auch der Phenyl-Verbindungen, die eine 3,4-Alkyl-, -Alkylendioxy-, -Alkylendioxy- oder Halogenalkylendioxy-Substitution haben. Solche Verbindungen insbesondere haben die Formel



in der R_2 und R_3 wie oben definiert sind; R_{11} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy-, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_2 - C_6 -Alkoxy-carbonyl, C_2 - C_6 -Alkyl-carbonyl, Nitro oder Cyan; R_{12} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, C_1 - C_4 -Alkylthio, Nitro, Cyan, C_2 - C_6 -Alkyl-carbonyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl oder C_2 - C_6 -Alkoxy-carbonyl; R_{13} ist Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_4 -2alogenalkyl oder C_1 - C_4 -Alkoxy oder R_{11} und R_{12} sind zusammen C_2 - C_4 -Alkyl-, C_2 - C_4 -Alkylendioxy-, C_1 - C_4 -Alkylendioxy oder C_1 - C_3 -Halogenalkylendioxy; vorausgesetzt, daß R_{11} , R_{12} und R_{13} nicht alle Wasserstoff sind.

Eine weitere bevorzugte Verbindungsklasse ist die, in der R_1 folgende Formel hat



in der R_{14} Wasserstoff und R_{15} Wasserstoff oder Halogen ist.

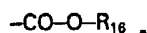
Beispiele solcher Phenyl-Gruppen sind 2,3-Difluor-, 2,4-Difluor-3-chlor- und 2,3,4-Trifluor-phenyl.

Ebenfalls von Interesse sind Verbindungen mit 2,5-, 2,3,4- oder 2,4,5-Substitution.

Wenn sie hier verwendet werden, haben diese Terms folgende Bedeutungen:

„Alkylendioxy“ und „Alkylendioxy“ bedeuten verbindende Gruppen mit 1 bzw. 2 Sauerstoffatomen und mindestens einem Kohlenstoffatom (wahlweise substituiert) in der Kette. Die Alkylendioxy-Einheiten haben zwischen 2 und 4 Kohlenstoffatomen in dieser Kette und sind zum Beispiel Ethylendioxy ($-O-C_2H_4-$) und ähnliches. Alkylendioxy-Einheiten sind Methylendioxy ($-O-CH_2-O-$), 1,2-Ethylendioxy ($-O-C_2H_4-O-$), Mono- oder Dihalogenmethylendioxy (eine Methylendioxy-Gruppe, in der ein oder beide Wasserstoffe durch Halogen ersetzt sind) und Isopropylendioxy ($-O-C(CH_3)_2-O-$).

Der Term „Alkoxy-carbonyl“ bedeutet eine Gruppe mit der Formel



in der R_{16} eine Alkyl-Gruppe ist. Im Kohlenstoff-Gehalt der Alkoxy-carbonyl-Gruppe ist das Kohlenstoffatom der Carbonyl-Gruppe mit enthalten. So bedeutet C_2 -Alkoxy-carbonyl Methoxy-carbonyl usw. Ähnlich schließt der Kohlenstoff-Gehalt einer Alkyl-carbonyl-Gruppe das Carbonyl-Kohlenstoff mit ein. Das einfachste Glied dieser Gruppe ist also Acetyl, $-CO-CH_3$.

Wenn R_1 einen Phenyl-Ring darstellt, der durch einen zweiten Phenyl-Ring substituiert ist, dann kann der zweite Phenyl-Ring unsubstituiert oder mit den Substituenten Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkyl, Nitro, Cyan, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl oder C_1 - C_4 -Alkylendioxy (wahlweise weiter substituiert durch bis zu 2 Halogenen).

Termini, die halogenierte Gruppen wie „Halogenalkyl“, „Halogenalkoxy“, „Halogenalkenyl“ und ähnliche definieren, umfassen mono- und polyhalogenierte Gruppen der angegebenen Zahl von Kohlenstoffatomen. In polyhalogenierten Gruppen können die Halogene gleich oder verschieden sein.

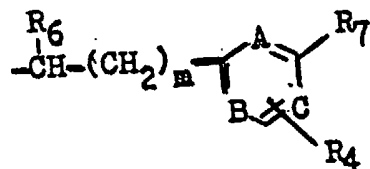
„Propargyl“ bedeutet die Prop-2-ynyl-Gruppe $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$, „Allyl“ bedeutet die Prop-2-enyl-Gruppe $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$. Cyclopropyl-Gruppen für R_2 können durch bis zu 4 Methyl-Gruppen oder alternativ durch bis zu 2 Halogenatomen substituiert sein.

Für die verschiedenen Untergruppen, die in die allgemeine Definition von R_3 fallen, sind die bevorzugten Typen:

Für R_4 : Wasserstoff und 2-, 4- oder 6-Monohalogen, besonders Monochlor oder Monofluor.

Für R_5 : 2-, 3- oder 4-Halogen, 2,4-, 3,4- oder 3,5-Dihalogen, besonders Difluor, Pentahalogen, besonders Pentafluor, 4-Methyl, 4-Trifluormethyl, 4-Methoxy, 4-Methylthio und 4-Methylsulfonyl.

Das Folgende sind Beispiele für spezifische Verkörperungen von Gruppen, die in die Definition von R_3 fallen. Aus Bequemlichkeit bei der Spezifizierung der Substitutionsstellungen der Verbindungen des Typs



erhält die Verknüpfungsstelle der Gruppe $-\text{CH}(\text{R}_6)-(\text{CH}_2)_n-$ die Zahl 1 und die Stellung der Gruppe R_7 die Zahl 3. Wenn A, B oder C ein Stickstoffatom sind, werden die Verbindungen als Pyrid-2-yl, Pyrid-6-yl bzw. Pyrid-4-yl bezeichnet.

3-Phenoxy-benzyl

1-(3-Phenoxy-phenyl)ethyl

3-Phenoxy-phenethyl

3-(Pyrid-4-yloxy)benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)benzyl

3-(4-Chlor-phenoxy)benzyl

3-(4-Brom-phenoxy)benzyl

3-(4-Iod-phenoxy)benzyl

3-(2,4-Difluor-phenoxy)benzyl

3-(3,4-Difluor-phenoxy)benzyl

3-(3,5-Difluor-phenoxy)benzyl

3-Pentafluorophenoxy-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-4-fluor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-4-chlor-benzyl

3-(4-Chlor-phenoxy)-4-fluor-benzyl

3-Phenoxy-4-fluor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-6-chlor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-5-fluor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-4,6-difluor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-6-fluor-benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)-2-fluor-benzyl

3-(4-Cyan-phenoxy)benzyl

3-(p-Tolyloxy)benzyl

3-(4-Methoxy-phenoxy)benzyl

3-(3,4-Difluor-phenoxy)-4-fluor-benzyl

3-(3-Fluor-phenoxy)benzyl

3-(2-Fluor-phenoxy)benzyl

3-(3-Chlor-phenoxy)benzyl

3-(4-Trifluormethyl-phenoxy)benzyl

3-(4-Methylthio-phenoxy)benzyl

3-(4-Fluor-phenoxy)- α -fluor-benzyl

3-Phenoxy-pyrid-2-ylmethyl

3-Phenoxy-pyrid-4-ylmethyl

3-Phenoxy-pyrid-6-ylmethyl

3-(4-Fluor-phenoxy)pyrid-2-ylmethyl

3-(4-Chlor-phenoxy)pyrid-2-ylmethyl

3-(4-Fluor-phenoxy)pyrid-4-ylmethyl

3-(4-Chlor-phenoxy)pyrid-4-ylmethyl

3-(4-Chlor-phenoxy)pyrid-6-ylmethyl

3-(3,4-Difluor-phenoxy)pyrid-2-ylmethyl

3-(p-Tolyloxy)pyrid-2-ylmethyl

3-(4-Fluor-phenoxy)pyrid-6-ylmethyl

3-(Pyrid-2-yloxy)benzyl

3-(4-Chlor-pyrid-2-yloxy)benzyl

2,3,4,5,6-Pentafluor-benzyl

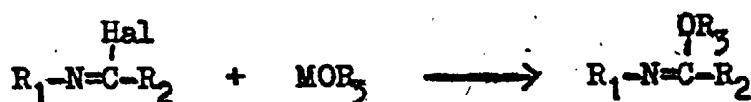
4-Methoxymethyl-2,3,5,6-tetrafluor-benzyl

4-Propargyl-2,3,5,6-tetrafluor-benzyl
 3-Allyloxy-benzyl
 3-Benzyl-benzyl
 3-Benzoyloxy-benzyl
 3-(4-Fluor-benzoyloxy)benzyl
 3-Anilino-benzyl
 3-(4-Fluor-anilino)benzyl
 1-(3-Phenoxy-phenyl)prop-2-ynyl
 3-Brom-4-fluor-benzyl
 4-Phenoxy-but-2-in-2-yl
 4-Benzoyloxy-benzyl
 4-(4-Fluor-benzoyloxy)benzyl
 4-(4-Trifluormethyl-pyrid-2-yloxy)benzyl
 2-Methyl-3-phenyl-benzyl
 5-Benzyl-3-furfuryl

Verfahren zur Darstellung der Verbindungen dieser Erfindung

Verfahren (A)

Die Verbindungen dieser Erfindung werden im allgemeinen durch Reaktion eines Imidoylhalogenids (vorzugsweise Chlorid) mit einem Alkalimetall-alkoholat entsprechend folgender allgemeiner Reaktionsgleichung dargestellt:

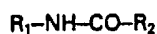


worin M ein Alkalimetall ist, vorzugsweise Natrium oder Kalium, und Halogen (Hal) ist vorzugsweise Chlor oder Brom. Die Reaktion wird bei einer Temperatur von etwa -70°C bis etwa $+65^\circ\text{C}$, vorzugsweise etwa bei Raumtemperatur für eine Zeit von etwa 5 Minuten bis etwa 24 Stunden, durchgeführt. Die Reaktion erfolgt in Gegenwart eines Lösungsmittels, zum Beispiel eines aromatischen Kohlenwasserstoffs wie Benzen, Toluol, Xylen oder Naphthalen, oder eines Ethers wie Diethylether, Diisopropylether, Diisopentylether, Dibutylether, Furan, 1,2-Dimethoxy-ethan oder Tetrahydrofuran (vorzugsweise Tetrahydrofuran). In einigen Fällen, offensichtlich für Fachleute, ist es vorteilhaft, eine Lösung des Alkalimetall-alkoholats zu einer Lösung des Imidoylhalogenids zu geben oder einen wesentlichen Überschuß an Alkoholat zu verwenden. Das entstandene Produkt kann mit Hilfe konventioneller Verfahren erhalten werden.

Das Alkoholat R_3OM wird durch Reaktion eines geeigneten Alkohols wie 3-Phenoxy-benzylalkohol mit einer Alkalimetall-haltigen Base, zum Beispiel einem Alkalimetallhydrid (zum Beispiel Kalium- oder vorzugsweise Natriumhydrid) in Gegenwart eines Lösungsmittels hergestellt, wie es bei der Reaktion des Alkalimetallalkoholats mit dem Imidoylhalogenid verwendet wird. Im allgemeinen wird diese Reaktion bei Siedetemperatur unter einer inerten Atmosphäre für eine Zeit bis zu 2 Stunden durchgeführt.

Die Alkohole können, falls nicht im Handel erhältlich, nach bekannten Methoden dargestellt werden, wie sie in folgenden Quellen beschrieben sind: US-PS 4.256.893, 4.261.920 und 4.329.518 und Band 7 des Textes „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel“ (Phenoxybenzyl, Phenoxy-pyridylmethyl- und Pyridyloxyalkohole); Elliott et al., J. Chem. Soc. (C), 1971, S. 2551-2554 (5-Benzyl-fur-2-ylmethanol); Pesticide Science 14, (1983) 560-570 (2-Methyl-3-phenyl-benzylalkohol); US-PS 4.370.346 und 4.594.355; GB-PS 2.122.616; EP-PS 196.156 und 271.240; J. Sci. Food & Agriculture 18, (1967) 167 für verschiedene, substituierte Benzylalkohole; EP-PS 211.561 für 3-Anilino-benzylalkohole; CH-PS 549.342 für 4-Phenoxy-but-2-in-1-ol-1 JP-PS 49-27331 für 1-(3-Phenoxy-phenyl)prop-2-in-1-ol.

Das Imidoylhalogenid kann hergestellt werden aus einem Ausgangsamin der Formel R_1-NH_2 oder aus einem Amid der Formel



in Abhängigkeit von der Verfügbarkeit. Die Amine sind entweder allgemein erhältlich, oder sie können durch bekannte Verfahren hergestellt werden, zum Beispiel solchen, die in dem „Compendium of Organic Synthetic Methods“ Harrison et al. (Wiley-Interscience, New York, 1971) beschrieben sind.

Die Amide, wenn nicht erhältlich, können hergestellt werden durch Reaktion des Amins mit einem entsprechenden Säurechlorid der Formel:

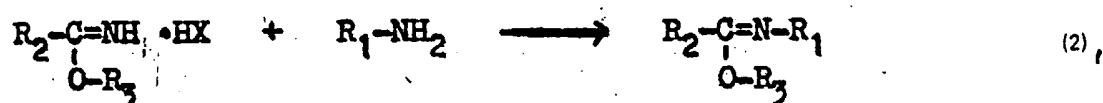
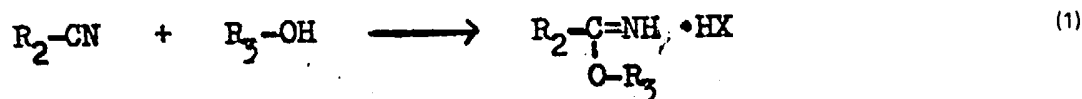


Die Temperatur dieser Reaktion liegt im Bereich von etwa -40°C bis etwa $+80^\circ\text{C}$. Geeignete Lösungsmittel sind Kohlenwasserstoffe wie Toluol und chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Ethylendichlorid, Tetrachlorethan und ähnliche, vorzugsweise Methylenchlorid. Diese Reaktion wird in Gegenwart einer Base, vorzugsweise eines tertiären Amins, durchgeführt. Geeignete Basen sind Triethylamin, Chinolin, Dimethylanilin, Diethylanilin und Pyridin. Triethylamin ist die bevorzugte Base. Die resultierenden Amide werden in herkömmlicher Weise erhalten und gereinigt.

Das Imidoylhalogenid kann hergestellt werden aus dem Amid durch Reaktion mit einem Halogenierungsmittel wie Phosphorpentachlorid oder Phosgen in einem organischen Lösungsmittel wie sie in der Amid-Herstellung verwendet werden (vorzugsweise Methylenchlorid) oder alternativ durch Verwendung von Phosphoroxychlorid als Lösungsmittel. Die Reaktion wird ausgeführt unter einer inerten Atmosphäre für eine Zeit, die bis zu 24 Stunden betragen kann, vorzugsweise von 1 bis 24 Stunden, bei einer Temperatur von etwa 0°C bis etwa 110°C. Bevor das Imidoylchlorid-haltige Produkt in der letzten Reaktionsstufe eingesetzt wird, sollten alle Substanzen wie Phosphoroxychlorid oder Chlorwasserstoff, die mit dem Alkoholat in der letzten Reaktionsstufe reagieren könnten, entfernt werden. Dies kann allgemein durch Evaporierung oder Destillation erreicht werden.

Alternativ können die Verbindungen dieser Erfindung in zwei Stufen wie folgt dargestellt werden:

Verfahren (B)



in denen „HX“ eine Mineralsäure darstellt.

In der ersten Stufe wird ein geeigneter Alkohol (zum Beispiel ein Phenoxybenzylalkohol) mit einem Nitril der Formel R_2 bei einer Temperatur von etwa -20°C bis etwa +40°C gemischt.

Dann wird eine Lösung einer Mineralsäure wie Salzsäure, Bromwasserstoffsäure, Schwefel- oder Phosphorsäure (vorzugsweise Salzsäure), gelöst in einem geeigneten organischen Lösungsmittel, bei Temperaturen von etwa -5°C bis etwa +40°C, vorzugsweise bei 0°C, zugegeben, dann wird bei Raumtemperatur gerührt, um das entsprechende Imidat-Salz zu bilden.

Geeignete Lösungsmittel für diese Reaktion sind aromatischen Kohlenwasserstoffe wie Benzen, Toluol, Xylen oder Naphthalen und Ether wie Diethylether, Diisopropylether, Dipentylether, Furan, Tetrahydrofuran und Dioxan (vorzugsweise Dioxan). Die Reaktionszeit kann bis 52 Stunden betragen. Die Imidat-Salze sind neu und stellen einen Aspekt dieser Erfindung dar.

In der zweiten Stufe wird das Imidat-Salz in einem organischen Lösungsmittel, wie sie auch in der ersten Stufe verwendet wurden, vorzugsweise Benzen, suspendiert und dann mit einem Amin der Formel R_1-NH_2 umgesetzt. Das Gemisch wurde, wahlweise unter Rühren, bei einer Temperatur zwischen etwa -50°C und +80°C, meistens bei Raumtemperatur und für einen Zeitraum umgesetzt, der zur Vollendung der Reaktion notwendig ist und bis zu 120 Stunden betragen kann. Das Imidat-Endprodukt kann wie im Verfahren (A) erhalten werden.

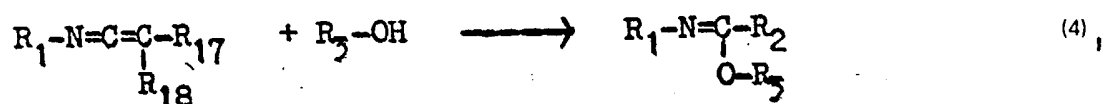
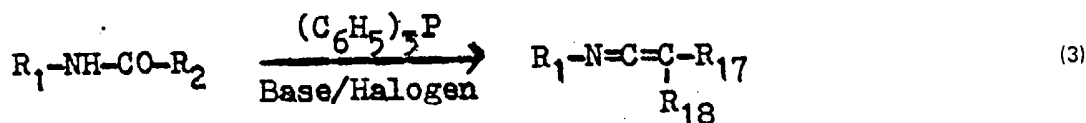
Verfahren (C)

Ein drittes Verfahren kann zur Herstellung vieler Verbindungen dieser Erfindung, mit Ausnahme jener, in denen R_2 eine Gruppe ohne α -ständiges Wasserstoffatom wie Cyan, tert-Butyl, Vinyl oder Halogenvinyl ist, verwendet werden. Dieses Verfahren verläuft über ein Ketenimin-Zwischenprodukt, das aus dem Amid oder Imidoylhalogenid dargestellt werden kann. Im ersten Fall wird das Amid (dargestellt zum Beispiel wie im Verfahren (A) beschrieben) mit einer billigen Base und einer dreiwertigen Phosphorverbindung, vorzugsweise Triphenylphosphin, umgesetzt. Die Base ist vorzugsweise ein tertiäres Amin wie Triethylamin. Die Reaktion wird bei einer Temperatur von etwa -10°C bis +40°C in Gegenwart eines Halogens, vorzugsweise Chlor oder Brom, und einem aromatischen oder chlorierten Kohlenwasserstoff-Lösungsmittel wie Benzen, Toluol, Xylen, Methylenchlorid, Ethylendichlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Tetrachlorethan und ähnliche, vorzugsweise Methylenchlorid, durchgeführt. Die Reaktion kann dann unter Rückflusstemperatur des Lösungsmittels durchgeführt und das Ketenimin nach bekannten Methoden isoliert werden.

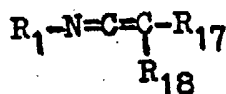
Alternativ kann das Ketenimin durch Reaktion des Imidoylhalogenids mit einer Base, wie schon beschrieben, jedoch ohne Halogen, oder dreiwertige Phosphorverbindung, hergestellt werden.

In der zweiten Stufe dieses Verfahrens wird das Ketenimin mit einem Alkohol der Formel R_3-OH in Gegenwart eines Lösungsmittels, vorzugsweise einem Ether wie Diethylether, Dipropylether, Diisopropylether, Dibutylether, Tetrahydrofuran oder 1,2-Dimethoxy-ethan, und einer Alkalimetallbase wie Kalium- oder Natriumhydrid, vorzugsweise Natriumhydrid, umgesetzt. Diese Reaktion wird unter Rückfluß in einer Zeit bis zu 48 Stunden, vorzugsweise von etwa 2 bis etwa 10 Stunden, durchgeführt, an ihrem Ende wurde das Reaktionsgemisch abgekühlt, und das Imidat-Produkt wurde wie oben beschrieben isoliert.

Dieses Verfahren kann durch folgendes allgemeine Schema beschrieben werden:



worin R_1 , R_2 und R_3 wie vorstehend beschrieben sind, R_{17} und R_{18} sind unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, Halogen, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy, C_2 - C_6 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Halogenalkenyl oder zusammen eine C_2 - C_3 -Alkylen-Kette, wahlweise substituiert durch bis zu 4 Methyl-Gruppen oder bis zu 2 Halogenen.
Die Ketenimine sind neu.



Verfahren (D):

Dieses Verfahren kann als Alternative zu Verfahren (A) zur Darstellung von Verbindungen dieser Erfindung aus Alkoholen (R_3 -OH) benutzt werden, die empfindlich gegenüber starken Basen wie den Alkalimetall-haltigen Basen (zum Beispiel Alkalimetallhydriden), die zur Darstellung der Alkoholate (R_3 -OM) benutzt werden, sind und durch sie negativ beeinflusst werden können (zum Beispiel zersetzt). Alkohole, die gegenüber solch starken Basen empfindlich sind, sind Phenoxypyridylalkane, α -Ethynylalkohole (R_8 ist Ethynyl) wie 1-(3-Phenoxy-phenyl)-prop-2-in-1-ol und Tetrafluorpropargylbenzylalkohol. Verbindungen dieses Typs können direkt aus dem Alkohol und dem Imidoylchlorid in Gegenwart einer tertiären Amin-Base und einer Reaktionsfördernden Menge eines 4-Bis(niederes alkyl)-amino-pyridins, vorzugsweise 4-Dimethylamino-pyridin, dargestellt werden.

Tertiäre Amine, die in diesem Verfahren verwendet werden können, sind Trialkylamine wie Trimethyl-, Triethyl-, Tributylamin und ähnliche, einschließlich tertiärer Amine mit gemischten Alkyl-Gruppen, N,N-Dialkyl-aniline wie N,N-Dimethyl-anilin, Pyridin und verschiedene substituierte Pyridine.

Bevorzugte tertiäre Amine, primär aus ökonomischen Gründen, sind Triethylamin, N,N-Dimethyl-anilin und Pyridin. Das tertiäre Amin kann auch eine zusätzliche Menge des Katalysators 4-Bis(niederes alkyl)amino-pyridin, oberhalb der zur Förderung der Reaktion notwendigen Menge, sein.

Das tertiäre Amin wird vorzugsweise in einer stöchiometrischen Menge in bezug auf den Alkohol verwendet, es kann jedoch auch im Überschuß verwendet werden. Der Katalysator 4-Bis(niederes alkyl)amino-pyridin kann verwendet werden in einer Menge von etwa 0,05 bis etwa 1 Äquivalent pro Äquivalent Alkohol, vorzugsweise von etwa 0,05 bis 0,15 Äquivalent pro Äquivalent, am besten etwa 0,1.

Dieses Verfahren wird vorzugsweise bei Temperaturen von etwa 10°C bis etwa 50°C durchgeführt. Niedrigere Temperaturen können angewendet werden, aber dann wird die Reaktionsgeschwindigkeit schnell geringer. Das Verfahren wird in Gegenwart eines inerten Lösungsmittels wie aromatischer Kohlenwasserstoff (zum Beispiel Benzen, Toluol oder Xylen), eines chlorierten Lösungsmittels (wie Methylenchlorid, Ethylendichlorid oder Chlor-benzen) oder eines Ethers (wie Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran) durchgeführt.

Während dieses Verfahren besonders geeignet ist zur Darstellung von Verbindungen aus baseempfindlichen Alkoholen, kann es auch zur Darstellung von Verbindungen dieser Erfindung im allgemeinen aus anderen Alkoholen als beschrieben verwendet werden.

α -Fluor-phenoxy-benzyl-Verbindungen werden aus α -Fluorbenzylhalogenid (vorzugsweise -bromid) dargestellt, lieber als der Alkohol durch Reaktion mit einem Amid, R_1 -NH-CO- R_2 , in Gegenwart eines Halogenid-Ionen bindenden Mittels, wie Silberoxid oder ein Silbersalz, und eines inerten Lösungsmittels. Die Reaktionstemperaturen reichen von etwa -20°C bis etwa 100°C.

Ausführungsbeispiele

Die Erfindung wird nachstehend an einigen Beispielen näher erläutert.

Das Folgende sind repräsentative Beispiele der Darstellung von Verbindungen dieser Erfindung nach den oben beschriebenen Verfahren.

Beispiel 1

Darstellung von N-(3-Chlor-4-fluor-phenyl)isobutyrimidsäure-(3-phenoxy-benzylester)
(Verbindung 88 hier) (Verfahren A)

(a) Darstellung des Anilids

Zu einer Lösung von 3-Chlor-4-fluor-anilin (10,0g, 0,069 mol) und Triethylamin (11,2 ml, 0,08 mol) in 100 ml Methylenchlorid wurde unter Rühren und Kühlen mit einem Eisbad Isobutyrylchlorid (7,8 ml, 0,075 mol) zugetropft. Danach ließ man das Reaktionsgemisch auf Raumtemperatur erwärmen, dann wurden 100 ml Wasser zugegeben. Die wäßrige und die organische Schicht wurden getrennt, die organische Schicht wurde getrocknet (über wasserfreiem Natriumsulfat), dann wurde das Lösungsmittel abgedampft; es wurden 15,2 g (103% der theoretischen Ausbeute) eines gelbbraunen Feststoffs erhalten, der spektroskopisch als 3-Chlor-4-fluor-isobutyrylanilid, F. 114–117°C, identifiziert wurde.

(b) Darstellung des Imidoylchlorids

Zu einer Lösung des in Stufe (a) dargestellten Anilids (10,0g, 0,069 mmol) in 50 ml Methylenchlorid unter einer Argon-Atmosphäre wurde Phosphorpentachlorid gegeben (1,93 g, 9,3 mmol). Nach zwei Stunden wurde das Lösungsmittel bei 20 mm Hg abgedampft, und das resultierende braune Öl wurde bei 40°C und weniger als 1 mm Hg weiter evaporiert. Das Produkt, N-(1-Chlor-2-methyl-propylen)-3-chlor-4-fluor-anilin, wurde ohne weitere Reinigung in der nächsten Stufe eingesetzt.

(c) Darstellung des Natriumalkoholats

Eine Suspension von Natriumhydrid (0,26 g, 11 mmol) in Tetrahydrofuran (40 ml) wurde dargestellt und unter einer Argon-Atmosphäre gerührt. Zu dieser Suspension wurde 3-Phenoxy-benzyl-alkohol (1,75 ml, 10 mmol) gegeben. Das resultierende Gemisch wurde 0,5 Stunden lang unter Rückfluß erhitzt und dann abgekühlt. Es wurde eine blaßgelbe Lösung von Natrium-3-phenoxy-benzylalkoholat erhalten, die eine geringe Menge eines grauen Feststoffes enthielt.

(d) Darstellung des Imidats

Zu der in Stufe (c) dargestellten Alkoholat-Lösung wurde das in Stufe (b) dargestellte Imidoylechlorid, gelöst in etwa 10 ml Tetrahydrofuran, bei Raumtemperatur unter mehreren Minuten langem Köhlen zugegeben. Nach einer Stunde wurde das Reaktionsgemisch in etwa 200 ml Hexan gegossen und durch Silicagel filtriert. Das Lösungsmittel wurde abgedampft, es hinterblieben 3,0 g (82% der theoretischen Ausbeute) eines gelbbraunen Öls, das durch Chromatographie an Silicagel weiter gereinigt wurde. Abdampfen des Lösungsmittels von der Produktfraktion ergab 2,4 g (65% der theoretischen Ausbeute) eines nahezu farblosen, viskosen Öls, spektroskopisch als das gewünschte Produkt identifiziert.

Beispiel 2

(Verfahren B)

Dieses Beispiel illustriert die Darstellung der Verbindung aus Beispiel 1 durch das zweite beschriebene Verfahren über das Imidatsalz als Zwischenprodukt.

(a) Eine Lösung von 3-Phenoxy-benzylalkohol (10 ml, 57,4 mmol) und Isobutyronitril (5,2 ml, 57,88 mmol) wurde auf 0°C gekühlt. Dann wurden 12,5 ml einer 4,1 ml Lösung von wasserfreiem HCl (62,5 mmol) in Dioxan zugetropft, anschließend wurde 16 Stunden lang bei 25°C gerührt. Das Produkt, Isobutyrimidsäure-(3-phenoxy-benzylester)-hydrochlorid, schied sich als weißer Feststoff ab.

(b) Das oben erhaltene Imidat-hydrochlorid (0,99 g, 3,2 mmol) wurde in 15 ml Benzen suspendiert und mit 0,60 g (4,1 mmol) 3-Chlor-4-fluor-anilin versetzt. Das Gemisch wurde dann 72 Stunden lang bei 25°C gerührt und durch Silicagel filtriert. Die vereinigten Filtrate wurden unter vermindertem Druck konzentriert und an Silicagel gereinigt unter Verwendung einer 5%igen Lösung von Ethylacetat in Hexan als Eluens. Es wurden 0,78 g des gewünschten Produktes in 77%iger Reinheit erhalten.

Beispiel 3

Darstellung von N-(3,4-Difluor-phenyl)isobutyrimidsäure-(4-fluor-3-phenoxy-benzylester)

(Verbindung 66 hier) (Verfahren C)

Dieses Beispiel illustriert die Darstellung einer Verbindung dieser Erfindung mit Hilfe des dritten Verfahrens über ein Ketenimin-Zwischenprodukt.

(a) Es wurde eine Mischung aus 3',4'-Difluor-isobutyranilid (4,0 g, 20,1 mmol, dargestellt analog Beispiel 1, Stufe (a)), Triethylamin (6 ml, 43 mmol) und Triphenylphosphin (5,3 g, 20,2 mmol) in 50 ml Methylenchlorid dargestellt. Das Gemisch wurde auf 0°C gekühlt; dann wurde Brom (1,0 ml, 20 mmol) zugetropft. Dann wurde zwei Stunden unter Rückfluß gekocht, auf Raumtemperatur gekühlt und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wurde mit 50 ml Hexan extrahiert, die Extrakte wurden filtriert und im Vakuum konzentriert, dabei wurden 3,84 g des rohen Ketenimins erhalten.

(b) Das so dargestellte Ketenimin wurde mit 3-(4-Fluor-phenoxy)benzylalkohol (0,80 g, 3,7 mmol, erhalten zum Beispiel nach der Methode von Fuchs et al., US-Patent 4.242.357) gemischt, die erhaltene Mischung wurde in 50 ml 1,2-Dimethoxy-ethan gelöst. Natriumhydrid (0,10 g, 4,2 mmol) wurde zugegeben und das Gemisch für zwei Stunden unter Rückfluß erhitzt. Die resultierende Mischung wurde abgekühlt, filtriert und konzentriert. Das Rohprodukt wurde durch Chromatographie an Silicagel unter Verwendung von 5% Ethylacetat in Hexan als Eluens gereinigt. Es wurden 1,05 g (72% der theoretischen Ausbeute) des gewünschten Produkts erhalten.

Beispiel 4

Darstellung von N-(4-Chlor-phenyl)cyclopropancarbonimidsäure-(3-phenoxy-benzylester)

(Verbindung 35 hier) (Verfahren A)

N-(4-Chlor-phenyl)cyclopropancarbonensäureamid (4,0 g, 20,4 mmol), dargestellt aus 4-Chloranilin und Cyclopropancarbonensäurechlorid analog Beispiel 1, Stufe (a), wurde in 50 ml Methylenchlorid gelöst und mit PCl_5 (4,25 g, 20,4 mmol) unter einer Argon-Atmosphäre auf einmal versetzt. Nach 20 Minuten wurde Pentan zugegeben, und der Feststoff wurde abfiltriert. Die Lösungsmittel wurden bei 50°C abgedampft, wobei ein hellbraunes Öl, das gewünschte Imidoylechlorid erhalten wurde. Dieses wurde in einer geringen Menge absoluten Tetrahydrofurans aufgenommen.

Das so erhaltene Imidoylechlorid wurde dann zu einer Lösung von Natrium-3-phenoxy-benzylalkoholat, dargestellt aus 4,1 g 3-Phenoxy-benzylalkohol und 0,5 g Natriumhydrid wie in Beispiel 1, Stufe (c), gegeben. Das Gemisch blieb 4 Stunden bei Raumtemperatur stehen, wurde dann kurz unter Rückfluß erhitzt und gekühlt. Wasser und Hexan wurden zugegeben, und die wäßrige und organische Phase wurden getrennt. Die organische Schicht wurde mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingedampft. Der Rückstand wurde in Hexan aufgelöst und durch Silicagel filtriert. Eindampfen ergab ein farbloses Öl, das spektroskopisch als das gewünschte Produkt identifiziert wurde.

Beispiel 5

Darstellung von N-(3-Trifluormethyl-phenyl)dichloracetimid-säure-(3-phenoxy-benzylester)

(Verbindung 72 hier) (Verfahren A)

In einem Kolben wurden 4,2 g (20,2 mol) Phosphorpentachlorid, 3'-Trifluormethyl-dichloracetanilid (5,4 g, 19,8 mol, dargestellt analog Beispiel 1, Stufe (a)) und Phosphoroxychlorid (Lösungsmittel) unter Argon gemischt. Das Gemisch wurde mehrere Stunden lang auf 60°C erhitzt; dann wurde Hexan zugegeben und die resultierende Lösung filtriert. Die Filtrate wurden eingedampft, und das Imidoylechlorid, ein Öl, wurde in einer geringen Menge absoluten Tetrahydrofurans aufgenommen. Das so dargestellte Imidoylechlorid wurde zu einer Lösung von Natrium-3-phenoxy-benzylalkoholat (dargestellt analog Beispiel 1, Stufe (c) aus 4,0 g 3-Phenoxy-benzylalkohol und 0,5 g Natriumhydrid) gegeben.

Das resultierende Gemisch wurde über Nacht bei Raumtemperatur gerührt; dann wurden Wasser und Hexan zugesetzt, die Phasen des Gemischs wurden getrennt, mit 5%iger HCl und gesättigter Natriumcarbonat-Lösung gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und zu einem Öl eingedampft. Dieses Öl wurde dann durch Chromatographie an Silicagel gereinigt, dabei wurde ein blaßgelbes Öl erhalten, das spektroskopisch als das gewünschte Produkt identifiziert wurde.

Beispiel 6

Darstellung von N-(3,4-Methylenedioxy-phenyl)propionimidsäure-(3-phenoxy-benzylester)

(Verbindung 189 hier) (Verfahren A)

Diese Verbindung wurde analog Beispiel 1 aus 2,0 g (10,4 mmol) 3',4'-Methylenedioxy-propionanilid (seinerseits dargestellt aus 3,4-Methylenedioxy-anilin und Propionylchlorid), 2,26 g 3-Phenoxy-benzylalkohol und 0,29 g Natriumhydrid dargestellt. Es wurden 1,9 g (50 % der theoretischen Ausbeute) eines farblosen, viskosen Öls erhalten, das spektroskopisch als das gewünschte Produkt identifiziert wurde.

Beispiel 7

Darstellung von N-(3-Chlor-4-fluor-phenyl)isobutyrimidsäure-[1-(3-phenoxy-phenyl)prop-2-ynylester]

(Verbindung 533 hier) (Verfahren D)

(a) Darstellung des Alkohols

Eine Lösung aus 2,4 g (24 mmol) Trimethylsilylacetylen in Tetrahydrofuran (50 ml) wurde dargestellt. Dann wurden 10,0 ml einer 2,5 M Lösung von n-Butyllithium in Hexan langsam zugegeben. Nach 15 Minuten langem Rühren wurden 3,5 ml (4,0 g, 20 mmol) 3-Phenoxy-benzaldehyd zugegeben. Die Lösung wurde 10 Minuten lang bei -78°C gerührt, dann ließ man innerhalb von 30 Minuten auf Raumtemperatur erwärmen.

Die Reaktion wurde mit 5%iger Natriumcarbonat-Lösung beendet. Das Tetrahydrofuran wurde im Vakuum entfernt, die wäßrige Phase wurde mit Methylenchlorid extrahiert, die organischen Schichten wurden vereinigt und getrocknet, es ergab sich ein helles Öl.

Eine Lösung des hellen Öls in Methanol wurde mit Kaliumcarbonat gerührt, dann konzentriert, in Wasser gelöst und mit Ether extrahiert. Der gewünschte Alkohol 1-(3-Phenoxy-phenyl)prop-2-in-1-ol (4,3 g, 96 % der theoretischen Ausbeute), ein hellgelbes Öl, wurde aus den Ether-Extrakten erhalten.

(b) Darstellung des Imidats

Zu einer Lösung von 0,7 g (3,0 mmol) N-(3-Chlor-4-fluor-phenyl)-isobutyrimidoylechlorid (dargestellt wie in Beispiel 1 [a]–[b]) wurden Triethylamin (0,63 ml, 0,45 g, 4,5 mmol), 1-(3-Phenoxy-phenyl)prop-2-in-1-ol (dargestellt wie oben) (1,0 g, 4,5 mmol) und 4-Dimethylamino-pyridin (50 mg, 0,4 mmol) gegeben. Das Gemisch wurde 24 Stunden lang bei Raumtemperatur gerührt, konzentriert und mit 100 ml Hexan verdünnt. Die resultierende Aufschlämmung wurde durch Aluminiumoxid filtriert und konzentriert, dabei wurden 0,90 g (70 % der theoretischen Ausbeute) der gewünschten Verbindung erhalten.

Die Tabellen 1 und 2 beschreiben repräsentative Verbindungen dieser Erfindung, die nach den oben beschriebenen Verfahren dargestellt wurden, Tabelle 1 enthält Verbindungen, in denen R_3 eine substituierte oder unsubstituierte 3-Phenoxy-benzyl-Einheit ist. Tabelle 2 enthält Verbindungen, in denen R_3 andere Einheiten repräsentiert. Nahezu alle Verbindungen stellen Öle dar; alle Strukturen wurden spektroskopisch bestätigt.

Da nahezu alle Verbindungen in den Tabellen von dem Typ sind, in dem R_1 ein substituierter oder unsubstituierter Phenyl-Ring ist, sind aus Gründen der Bequemlichkeit in den Tabellen nur die Substituenten (wenn vorhanden) an diesem Ring angegeben mit H = unsubstituiertes Phenyl, 3-Cl = 3-Chlor-phenyl, $3\text{-Cl}, 4\text{F}$ = 3-Chlor-4-fluor-phenyl usw. Naphthyl-Verbindungen werden als solche angegeben.

Insektizide Bewertungstests

Die Verbindungen in den Tabellen 1 und 2 wurden unter Verwendung der folgenden Testverfahren auf ihre insektizide Wirkung getestet.

Hausfliege (HF) (*Musca domestica*):

Die Testverbindungen wurden mit Aceton verdünnt, und aliquote Teile wurden auf den Boden von Aluminiumschalen pipettiert, so daß 100 µg der Testverbindung eingesetzt wurden. Um ein Ausbreiten der Chemikalie über den ganzen Boden der Schale zu sichern, wurde jeder Schale 1 ml Aceton, enthaltend 0,01 % Erdnußöl, zugesetzt. Nach Abdampfen aller Lösungsmittel wurden die Schalen in runde Pappetuis gestellt, die 25 weibliche, 1–2 Tage alte Hausfliegen enthielten. Die Etuis wurden am Boden mit Zellophan und oben mit Tüllgaze bedeckt, jedes enthielt einen mit Zuckerwasser getränkten Wattebausch zur Erhaltung der Fliegen. Die Sterblichkeit wurde nach 48 Stunden ermittelt.

Schwarzbohnen-Blattläuse (BBA) (*Aphis fabae* [Scopl]):

Kapuzinerkressenpflanzen (*Tropaeolum* sp.), ungefähr 5 cm hoch, wurden in sandigen Lehm Boden in kleinen Töpfen umgepflanzt und mit 25–50 Blattläusen gemischten Alters besetzt. 24 Stunden später wurden sie bis zum Abtropfen mit 50:50-Aceton-Wasser-Lösungen, die 0,05 % der Testverbindungen enthielten, besprüht. Die behandelten Pflanzen wurden in einem Gewächshaus gehalten, die Sterblichkeit wurde nach 48 Stunden festgestellt.

Tabakblütenstecher (*Heliothis virescens* [Fabricius]):

(a) Kontakt: (TBW-C) Die Testverbindungen wurden auf eine Konzentration von 0,1 % in einer 50:50-Aceton-Wasser-Lösung verdünnt. Baumwoll-Kotyledone (*Gossypium* sp.) wurden für 2–3 Sekunden in die Testlösungen getaucht und auf ein Drahtgitter zum Trocknen gelegt. Die getrockneten Blätter wurden in Petrischalen gebracht, die ein angefeuchtetes Stück Filterpapier enthielten, und mit 5 Tabakblütenstecher-Larven besetzt. Die Schalen wurden für 5 Tage in eine Hochfeuchtigkeitskammer gebracht, und die prozentuale Sterblichkeit der Larven wurde festgestellt.

(b) Eier: (TBW-E) Filterpapierstücken mit 2 Tage alten Eiern des Tabakblütenstechers wurden in Aceton-Lösungen getaucht, die 0,1 % der Testverbindung enthielten, und in Petri-Schalen gebracht, die Larvenaufzucht-Medium enthielten. Die behandelten Eier wurden bei 78°F gehalten, und die Sterblichkeit wurde bestimmt, nachdem alle Kontrolleier ausgebrütet waren und die jungen Larven sich von dem Medium ernährt hatten.

Kohlspanner (CL) (*Trichoplusia ni* [Hübner]):

Die Testverbindung wurden bis auf eine Konzentration von 0,1 % in einer 50:50-Aceton-Wasser-Lösung verdünnt. Kotyledone von *Calabacita abobrinha*, etwa 1 × 1,5 Zoll, wurden für 2–3 Sekunden in die Test-Lösungen getaucht und auf ein Drahtnetz zum Trocknen gelegt. Die getrockneten Blätter wurden in Petri-Schalen gebracht, die angefeuchtete Filterpapierstücke enthielten, und mit Kohlspannerlarven besetzt. Die Schalen wurden in eine Hochfeuchtigkeitskammer gebracht. 3–5 Tage später wurde die Sterblichkeit der Larven bestimmt.

Rübenraupe (BAW) (*Spodoptera exigua*):

Die Testverbindungen wurden auf eine Konzentration von 0,1 % in einer 50:50-Aceton-Wasser-Lösung verdünnt. Junge Blätter von Zuckerrüben (*Beta vulgaris*) wurden 2–3 Sekunden in die Testlösungen getaucht und auf ein Drahtnetz zum Trocknen gelegt. Die trockenen Blätter wurden in Petrischalen mit angefeuchtetem Filterpapier gelegt und mit fünf Larven des Rübenwurms besetzt. Die Schalen wurden in eine Hochfeuchtigkeitskammer gebracht. Die Sterblichkeit wurde 3–5 Tage später bestimmt.

Astern-Blatthüpfer (LH) (*Macrosteles fascifrons* [Stal])

Hafensämlinge (*Avena* sp) wurden in Töpfen in handelsüblichem Boden gezogen. Wenn die Pflanzen eine Höhe von etwa 10 cm erreicht hatten, wurden sie auf drei pro Topf vereinzelt und für 2–3 Sekunden in 50:50-Aceton-Wasser-Lösungen der Testverbindungen getaucht. Nach dem Trocknen der Pflanzen wurde ein durchsichtiges Plasterrohr über sie gestülpt und das Bodenende in den Topf gedrückt. Dann wurden 10 entwickelte Astern-Blatthüpfer bzw. ihre Larven in jedes Rohr gebracht, die oberen Enden der Rohre wurden mit weißem Organdy-Tuch abgedeckt. Die Moralität wurde nach 48 Stunden bestimmt.

Mais-Kornwurm (MW) (*Sitophilus zeamais* [Motschulsky]):

Die Testverbindungen wurden auf eine Konzentration von 0,01 % in einer 50:50-Aceton-Wasser-Lösung verdünnt. Vier Samen (*Zea mays* [L.]), die für 2–3 Sekunden in die Testlösungen getaucht und anschließend getrocknet worden waren, wurden zusammen mit 10 entwickelten Kornwürmern in Behälter gegeben. Die Behälter wurden abgedeckt und bei einer Temperatur von etwa 25°C gehalten. Nach 48 Stunden wurde die Sterblichkeit bestimmt.

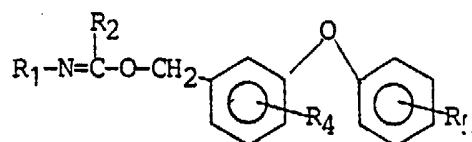
Reis-Wasserrüsselkäfer (RWV) (*Lissorhoptrus oryzophilus* [Kuschel]):

Die Testverbindungen wurden mit Aceton verdünnt. Tröpfchen (1 µl) der Testlösungen wurden auf die Bauchseite des Hinterleibs entwickelter weiblicher Rüsselkäfer so aufgebracht, daß 2,5 µg der Testverbindungen auf jeden Rüsselkäfer gebracht wurden. Die behandelten Rüsselkäfer wurden in Behälter gebracht, die feuchte Wattebällchen und Reislaub enthielten. Die Behälter wurden abgedeckt und bei einer Temperatur von etwa 25°C gehalten. Nach 48 Stunden wurde die Sterblichkeit bestimmt. Die Ergebnisse dieser Tests werden in Tabelle 3 gezeigt. Die Symbole in dieser Tabelle bedeuten folgendes:

- + = 50 % oder größere Sterblichkeit bei der Testkonzentration
- = geringere als 50%ige Sterblichkeit bei der Testkonzentration
- NT = kein Test durchgeführt.

* Verbindung zeigte Aktivität in Tests gegen Zweipunktmißbe

TABLE 1

(R₁ = unsubstituted or substituted phenyl)

Cmpd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
1	3-Cl	CHCl ₂	H	H
2	4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
3	4-Cl	-CCl ₂ CH ₃	H	H
4	2,4-Cl	CHCl ₂	H	H
5	4-Cl		H	H
6	4-Cl	CH ₃ -C=CH ₂	H	H
7	3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
8	4-Cl		H	H
9	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
10	3,5-Cl	i-C ₄ H ₉	H	H
11	4-Cl	C ₂ H ₅	H	H
12	3-Cl	t-C ₄ H ₉	H	H
13	2,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
14	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H

TABLE 1
(continued)

Cmpd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
15	4-Cl		H	H
16	3,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
17	2-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
18	2,4,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
19	2,4,6-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
20	3,4,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
21	4-Cl	-CN	H	H
22	4-Cl	-CH(CH ₃)OCH ₃	H	H
23	4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	H
24	3-Cl		H	H
25	3,4-Cl	t-C ₄ H ₉	H	H
26	4-Cl	sec-C ₄ H ₉	H	H
27	3,4-Cl	-CHClCH ₃	H	H
28	2,3-Cl	C ₂ H ₅	H	H
29	4-Cl	CHCl ₂	H	H
30	4-Cl	t-C ₄ H ₉	H	H
31	4-Cl	CH ₂ Cl	H	H
32	4-Cl		H	H
33	4-Cl	-CHClCH ₃	H	H
34	2-Cl	CHCl ₂	H	H
35	4-Cl	CF ₃	H	H
36	3,4-Cl	C ₂ H ₅	H	H
37	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
38	3,4-Cl	n-C ₃ H ₇	H	H
39	3,4-Cl	sec-C ₄ H ₉	H	H

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
40	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	3-F
41	H	CHCl ₂	H	H
42	H	CH ₃	H	H
43	H	i-C ₃ H ₇	H	H
44	4-F	CHCl ₂	H	H
45	4-F		H	H
46	4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
47	3-F	i-C ₃ H ₇	H	H
48	4-F	t-C ₄ H ₉	H	H
49	4-F	-C=CCl ₂ Cl	H	H
50	4-F	CHF ₂	H	H
51	2,3,4,5,6-F	i-C ₃ H ₇	H	H
52	2,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
53	4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
54	3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
55	3,5-F	i-C ₃ H ₇	H	H
56	2,5-F	i-C ₃ H ₇	H	H
57	2,3,5,6-F	i-C ₃ H ₇	H	H
58	2,4,5-F	i-C ₃ H ₇	H	H
59	2,4-F	C ₂ H ₅	H	H
60	3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
61	4-CF ₃	CHCl ₂	H	H
62	4-CF ₃		H	H
63	4-OCF ₃		H	H
64	4-OCF ₃	CHCl ₂	H	H
65	2-Cl,4-CF ₃		H	H

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
66	3-CF ₃	CHCl ₂	H	H
67	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
68	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
69	2,5-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
70	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
71	3-CF ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
72	2-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
73	2-CH ₃ ,3-F	i-C ₃ H ₇	H	H
74	2-CH ₃ ,5-F	i-C ₃ H ₇	H	H
75	3-F,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
76	3-OCH ₃ ,5-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
77	3-CF ₃ ,5-F	i-C ₃ H ₇	H	H
78	3,5-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
79	2-F,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
80	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
81	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
82	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
83	3-Cl,4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
84	2-F,5-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
85	3-Cl,4-F	C ₂ H ₅	H	H
86	3-CF ₃		H	H
87	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
88	3-CF ₃	t-C ₄ H ₉	H	H
89	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
90	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
91	3,5-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
92	2,6-Cl,4-NO ₂	i-C ₃ H ₇	H	H
93	2-Cl,5-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
94	2-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H

TABLE 1
(continued)

Cmpd.				
No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
95	3-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
96	2-CH ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
97	2-CH ₃ ,3-Cl	CHCl ₂	H	H
98	(4-chloro-alpha-naphthyl)	CHCl ₂	H	H
99	2,5-OCH ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
100	2-Cl,3,6-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
101	3,5-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
102	$\text{3-COOC}_2\text{H}_5, 4\text{-Cl}$	i-C ₃ H ₇	H	H
103	3-Cl,4-SC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
104	$\text{3-Cl, 4-COOC}_2\text{H}_5$	i-C ₃ H ₇	H	H
105	3-NO ₂ ,4-Cl	t-C ₄ H ₉	H	H
106	3-Cl,4-Br	t-C ₄ H ₉	H	H
107	3-Cl,4-CH ₃	t-C ₄ H ₉	H	H
108	3-Cl,4-CN	-C(CH ₃) ₂ Cl	H	H
109	2-CH ₃ ,4-Cl	t-C ₄ H ₉	H	H
110	3-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
111	(4-chloro-alpha-naphthyl)	-C(CH ₃) ₂ Cl	H	H
112	3-Cl,4-SO ₂ C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
113	3-Cl,4-F		H	H
114	3-(pyrid-2-yloxy)	i-C ₃ H ₇	H	H
115	3-Cl,4-F	C ₂ H ₅	H	4-F
116	3-Cl,4F		H	4-F
117	3-Cl,4-F	C ₂ F ₅	H	H
118	3-Cl,4-F	CHBrCH ₃	H	H

TABLE 1
(continued)

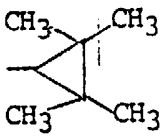
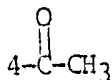
Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
119	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	2-F
120	3-CF ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
121	3-Cl,4-F	n-C ₄ H ₉	H	H
122	3-Cl,4-F	sec-C ₄ H ₉	H	H
123	3-Cl,4-F	n-C ₃ H ₇	H	H
124	3-Cl,4-F		H	H
125	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	3-F
126	3-CN	i-C ₃ H ₇	H	H
127	3-CH ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
128	3-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
129	2,4-F,6-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
130	2,6-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
131	4-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
132	2-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
133	2-CH ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
134	3-Br	t-C ₄ H ₉	H	H
135	4-Br	t-C ₄ H ₉	H	H
136	3-I	i-C ₃ H ₇	H	H
137	4-I	i-C ₃ H ₇	H	H
138	4-CCl ₂ H ₅	CHCl ₂	H	H
139	4-CH ₃	CHCl ₂	H	H
140	4-(t-C ₄ H ₉)	CHCl ₂	H	H
141	4-SCH ₃	CHCl ₂	H	H
142	4-SCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
143	3-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
144	4-(i-C ₃ H ₇)	i-C ₃ H ₇	H	H
145	2-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
146	2,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
147		i-C ₃ H ₇	H	H

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
148	2,3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
149	2-CH ₃ ,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
150	2-OCH ₃ ,5-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
151	4-C(=O)CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
152	4-(n-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	H
153	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	H
154	3-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
155	3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
156	4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
157	4-C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H
158	3,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
159	4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	4-F
160	4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
161	4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
162	3-C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	H	H
163	4-C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	H	H
164	4-OC ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	H	H
165	4-(i-C ₃ H ₇)	t-C ₄ H ₉	H	H
166	3-SCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
167	3,4-CH ₃	t-C ₄ H ₉	H	H
168	3-C(=O)C ₂ H ₅	t-C ₄ H ₉	H	H
169	3,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
170	3-C(=O)CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
171	3-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
172	4-CN	i-C ₃ H ₇	H	H
173	4-NO ₂	CHCl ₂	H	H
174	3-NO ₂	CHCl ₂	H	H
175	3-NO ₂	t-C ₄ H ₉	H	H
176	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-F

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
177	3,4-(-OCH ₂ O-)		H	H
178	3,4-(-OCH ₂ O-)	C ₂ H ₅	H	H
179	3,4-(OC ₂ H ₄ O-)	i-C ₃ H ₇	H	H
180	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	H
181	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	4-F	H
182	3,4-[-OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	H	H
183	3,4-(OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	2-F
184	4-OCH ₃	n-C ₃ H ₇	H	H
185	3,4-(OCH ₂ O-)	sec-C ₄ H ₉	H	H
186	4-C ₆ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
187	3,4-(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	i-C ₃ H ₇	H	H
188	3,4-(-OCH ₂ O-)	n-C ₃ H ₇	H	H
189	4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
190	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	2-F
191	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	H	2, 4-
192	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	3-F
193	3-CF ₃ , 4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
194	3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
195	3-CF ₃ , 4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	3-F
196	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
197	4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
198	2, 3, 4, 5, 6-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
199	3, 5-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
200	3-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
201	3-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
202	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
203	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	H	3-Cl
204	3-Cl, 4-F	t-C ₄ H ₉	H	4-F
205	4-F	i-C ₃ H ₇	H	3-Cl
206	4-F	i-C ₃ H ₇	H	2, 4-

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
207	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	3-Cl
208	4-CN	i-C ₃ H ₇	H	3-Cl
209	2,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
210	3-Cl,4-F	sec-C ₄ H ₉	H	4-F
211	3,4-Cl	sec-C ₄ H ₉	H	4-F
212	3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-CN
213	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	2,4-F
214	3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	2,4-F
215	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	3,5-F
216	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
217	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	3,4-F
218	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	3,4-F
219	3-4-[-OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	H	4-F
220	4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-OC(CH ₃) ₂
221	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-OC(CH ₃) ₂
222	3-F,4-CN	i-C ₃ H ₇	H	4-F
223	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-OC(CH ₃) ₂
224	3-Cl,4-F	-C(CH ₃) ₂ Cl	H	4-F
225	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃
226	4-Br	i-C ₃ H ₇	H	4-F
227	4-CN	i-C ₃ H ₇	H	4-F
228	4-(i-C ₃ H ₇)	i-C ₃ H ₇	H	4-F
229	3-Br	i-C ₃ H ₇	H	4-F
230	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	6-F	4-F
231	4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃
232	2,3,4,5,6-F	i-C ₃ H ₇	H	2,4-F
233	3-F,4-CN	i-C ₃ H ₇	H	H
234	4-I	i-C ₃ H ₇	H	4-F
235	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	4-F
236	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
237	4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-Br

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
238	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Br
239	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
240	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
241	3,4-[-OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
242	3,4-[-OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	4-F	H
243	3,4-(-CH ₂ CH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	H
244	3,4-(-OCF ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-F
245	3,4-(-OCF ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	H
246	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-CF ₃
247	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-CF ₃
248	3,4,5-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
249	2,3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
250	2,5-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
251	3,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	4-F
252	3,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	H
253	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
254	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
255	3-I	i-C ₃ H ₇	H	4-F
256	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-SCF ₃
257	4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-SCF ₃
258	3-Cl,4-F	C ₂ F ₅	H	4-F
259	4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Br
260	3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-Br
261	3-Cl,4-F	sec-C ₄ H ₉	4-F	H
262	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	2-F	4-F
263	2-CH ₃ ,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
264	2-OCH ₃ ,5-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
265	4-F	i-C ₃ H ₇	H	3,4
266	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
267	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
268	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
269	4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
270	3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
271	3-NO ₂	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
272	3-SCF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
273	3-Br, 4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
274	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	6-Cl	4-F
275	3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Br
276	3-Br, 4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Br
277	3-CF ₃ , 4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
278	3,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
279	3-I	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
280	4- 	i-C ₃ H ₇	H	4-F
281	3-I, 4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
282	3-F, 4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
283	3,4-[OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
284	3,4-(-CCF ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
285	3,4-(-OCF ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	4-F	H
286	4-CCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
287	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
288	3-OCF ₂ CHF ₂	i-C ₃ H ₇	H	4-F
289	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
290	4-Cl	-CH(C ₂ H ₅) ₂	H	4-F
291	3-CF ₃	-CH(C ₂ H ₅) ₂	H	4-F
292	2,4-Cl, 5-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
293	3-NO ₂ , 4-F	i-C ₃ H ₇	H	H
294	3-CF ₃		H	4-F
295	3,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
296	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
297	3-CF ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
298	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
299	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
300	3-CF ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
301	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
302	3-NO ₂	i-C ₃ H ₇	H	H
303	2-Cl,5-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
304	2,3,5,6-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
305	3-Cl,4-F	CHBrCH ₃	H	4-F
306	3,4-(OCH ₂ O-)	CHBrCH ₃	H	H
307	3-CF ₃ ,4-NO ₂	i-C ₃ H ₇	H	H
308	3-Cl,4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	4-F
309	3-Cl,4-F	CF(CH ₃) ₂	H	4-F
310	3-Cl,4-F	CF(CH ₃) ₂	4-F	4-F
311	2,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
312	2,4-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
313	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
314	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
315	3-Cl,4-F	CF(CH ₃) ₂	H	2,4-F
316	3-Cl,4-F	CF(CH ₃) ₂	6-F	4-F
317	4-(i-C ₃ H ₇)	sec-C ₄ H ₉	H	H
318	3,4-F	CF(CH ₃) ₂	H	4-F
319	3-CF ₃	CF(CH ₃) ₂	H	4-F
320	4-(i-C ₃ H ₇)	C ₂ H ₅	H	4-F
321	4-(i-C ₃ H ₇)	CH(C ₂ H ₅) ₂	H	H
322	4-(i-C ₃ H ₇)	t-C ₄ H ₉	H	4-F
323	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
324	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
325	4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
326	3-I,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl

TABLE 1
(continued)

Cmpd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
327	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	5-F	4-F
328	3-Cl, 4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	5-F	4-F
329	4-(i-C ₃ H ₇)	i-C ₄ H ₉	H	4-F
330	2,4-F, 3-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
331	2,4-F, 3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
332	2,4-F, 3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	H
333	4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
334	3-I, 4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
335	4-I	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
336	3,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
337	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
338	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
339	4-(i-C ₃ H ₇)		H	H
340	3-CF ₃ , 4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
341	3-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
342	3-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
343	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	4,6-F	4-F
344	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl ₃
345	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	4-OCN ₃
346	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	3,4-F
347	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	3,4-F
348	2,3,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
349	2,3,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
350	3-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	H	4-F
351	2-F, 4-Br	i-C ₃ H ₇	H	4-F
352	2,4-F, 3-Cl	i-C ₃ H ₇	H	4-F
353	4-SCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
354	3-F, 4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
355	3-F, 4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F

TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
356	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
357	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
358	3-CH ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	H
359	3-CH ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
360	4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	H
361	4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
362	3-SCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
363	3,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
364	3-CF ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
365	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
366	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
367	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-(t-C ₄ H ₉)
368	3-Cl,4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
369	3-Cl,4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
370	3-Cl,4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	H
371	4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	H
372	4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
373	4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	H
374	3-Cl,4-I	i-C ₃ H ₇	H	4-F
375	3-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
376	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	H
377	3-Br,4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
378	4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
379	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
380	3-Cl,4-Br	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
381	3-Cl,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
382	3-Cl,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
383	3,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
384	3,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	H
385	3-Cl,4-I	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
386	3-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl

TABLE 1
(continued)

<u>Cmpd.</u> <u>No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₄</u>	<u>R₅</u>
387	3-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	H
388	3-CF ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	H
389	3-I	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
390	3-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
391	4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
392	4-CN	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
393	4-CN	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
394	4-CN	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
395	2,4-F,3-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
396	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
397	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
398	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
399	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
400	3-CH ₃ ,4-F	i-C ₃ H ₇	4-F	H
401	3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
402	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
403	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
404	3-Cl,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
405	3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
406	3,4-CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
407	3-CH ₃ ,4-Br	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
408	3-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
409	3-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
410	3-Cl,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
411	2-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	4-F
412	4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
413	3-I,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
414	4-SO ₂ CH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
415	3-Cl,4-F	-CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
416	3-Cl,4-F	-CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H
417	3-Cl,4-F	-CH(CH ₃)=CH ₂	H	H

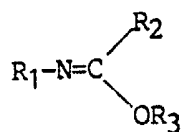
TABLE 1
(continued)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
418	4-OCF ₂ CHFCl	i-C ₃ H ₇	H	H
419	4-OCF ₂ CHFCl	i-C ₃ H ₇	4-F	H
420	3-Cl, 4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
421	3-Cl, 4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
422	4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
423	4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
424	3-Cl, 4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
425	3-Cl, 4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	H
426	3-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
427	2-Cl, 4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	4-F
428	2-Cl, 4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
429	3-F, 4-OCH ₂ CF ₃	i-C ₃ H ₇	H	Cl
430	4-CF ₃	-CH(CH ₃)=CH ₂	H	H
431	4-CF ₃	-CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H
432	4-CF ₃	-CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
433	3-Br, 4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
434	3-Br, 4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
435	3-F, 4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
436	3-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl
437	3-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
438	3-Cl, 4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	4-F
439	3-F, 4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	4-F	H
440	4-n-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
441	3-F, 4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-F
442	4-CF ₃	-CH(CH ₃)=CH ₂	H	4-F
443	4-CF ₃		4-F	H
444	4-CF ₃		4-F	4-Cl

TABLE 1
(continued)

<u>Cmpd. No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₄</u>	<u>R₅</u>
445	2-NO ₂ ,4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	4-F	H
446	3-Br,4-OC ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	H	4-F
447	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-I
448	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	4-Cl	4-F
449	3-I,4-F	i-C ₃ H ₇	H	4-F
450	3,4-(-OCF ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	H	4-Cl
451	2,4-F,3-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	H
452	3-OCH ₂ CF ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	4-F	4-Cl

TABLE 2

(R₁ = unsubstituted or substituted phenyl)

Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
453	4-Cl	CHCl ₂	
454	2,3-Cl	CHCl ₂	
455	4-Cl	i-C ₃ H ₇	
456	4-F	i-C ₃ H ₇	
457	4-Cl	i-C ₃ H ₇	
458	4-F	i-C ₃ H ₇	
459	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
460	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

Cmpd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
461	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
462	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
463	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
464	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
465	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
466	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
467	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
468	3,4-[-OC(CH ₃) ₂ O-]	i-C ₃ H ₇	
469	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
470	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

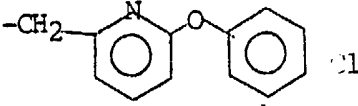
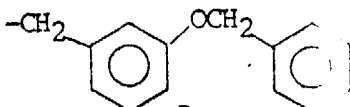
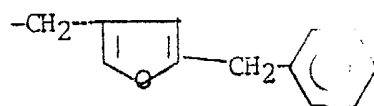
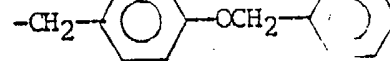
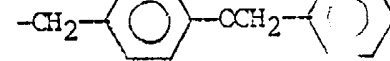
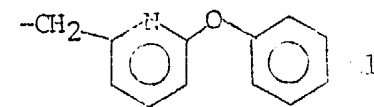
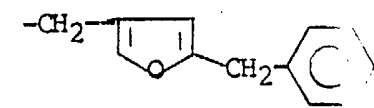
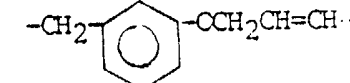
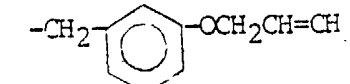
Compd.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
No.			
471	3-Cl, 4-I	i-C ₃ H ₇	
472	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
473	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
474	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
475	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
476	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
477	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
478	4-Br	i-C ₃ H ₇	
479	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
480	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

<u>Compd.</u> <u>No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>
481	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
482	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
483	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
484	4-Cl	i-C ₃ H ₇	
485	3,4-F	i-C ₃ H ₇	
486	2,4-F	i-C ₃ H ₇	
487	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
488	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
489	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
490	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
491	4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

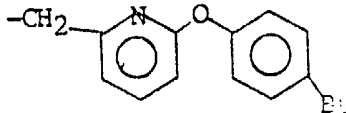
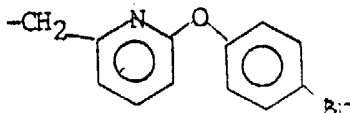
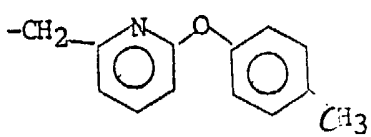
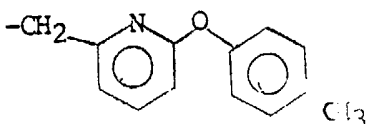
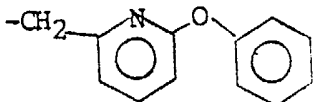
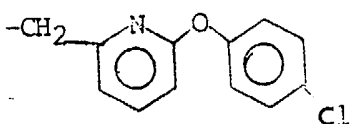
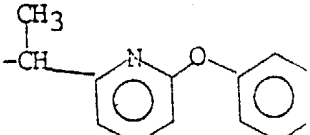
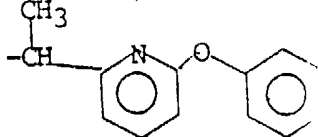
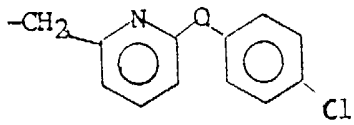
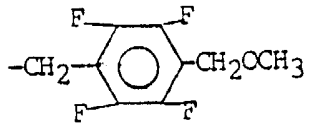
Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
492	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
493	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
494	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
495	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
496	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	
497	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	
498	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
499	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
500	2,4-F,3-Cl	i-C ₃ H ₇	
501	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

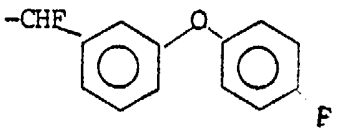
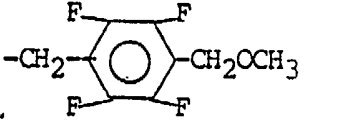
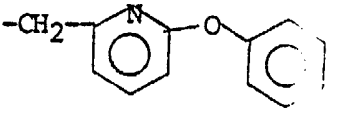
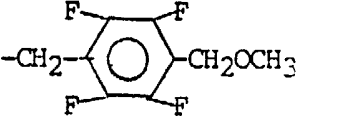
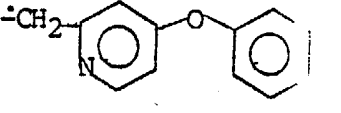
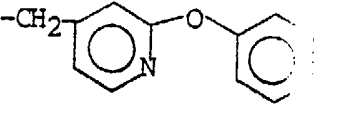
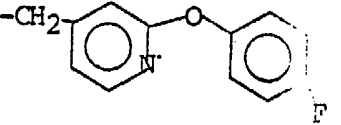
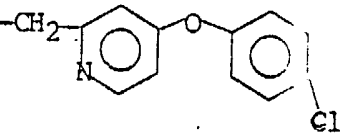
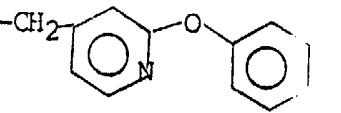
<u>Compd. No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>
502	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
503	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
504	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
505	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
506	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
507	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
508	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
509	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
510	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

<u>Compd. No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>
511	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
512	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
513	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
514	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
515	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
516	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
517	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
518	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
519	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

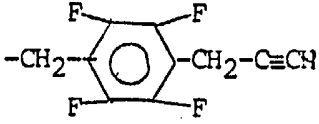
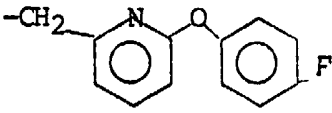
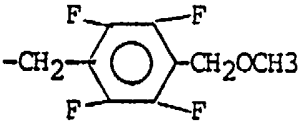
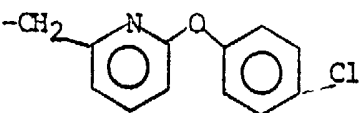
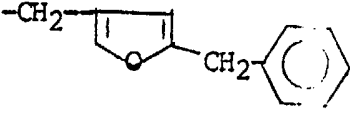
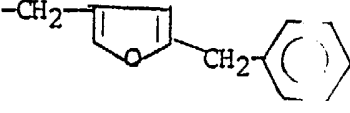
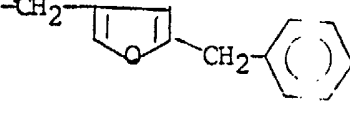
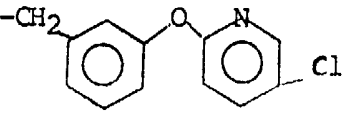
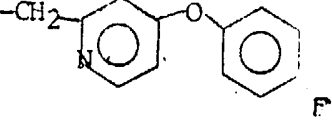
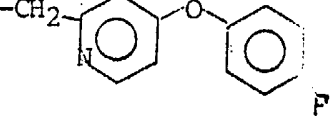
<u>Compd. No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>
520	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
521	2,4-F,3-Cl	i-C ₃ H ₇	
522	2,4-F,3-Cl	i-C ₃ H ₇	
523	3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
524	3,4-F	C ₂ H ₅	
525	3,4-F	t-C ₄ H ₉	
526	3,4-F	CH ₃	
527	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	
528	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
529	3-Cl,4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

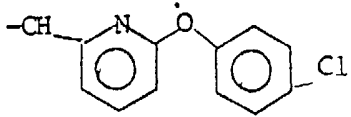
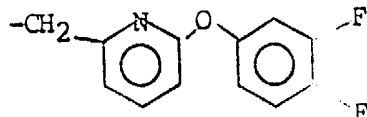
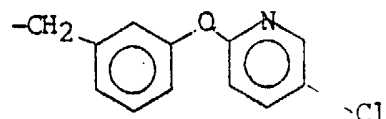
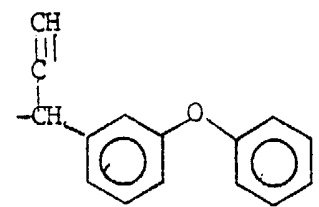
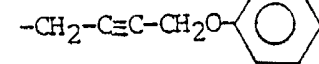
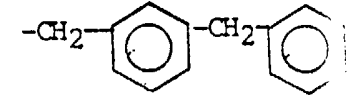
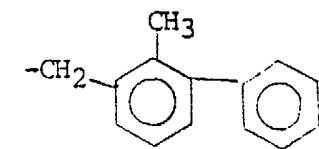
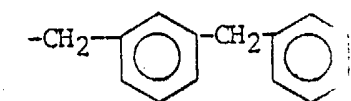
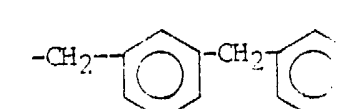
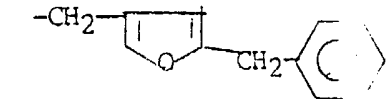
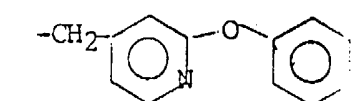
Compd. No.	Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
530	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
531	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
532	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
533	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
534	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
535	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
536	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	
537	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
538	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	
539	4-NO ₂	i-C ₃ H ₇	
540	3,4-(-OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

Cmpd. No.	Phenyl Subst.	R2	R3
541	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	
542	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	
543	4-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
544	4-(t-C ₄ H ₉)	i-C ₃ H ₇	
545	3-CH ₃	i-C ₃ H ₇	
546	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
547	3,4-(OCH ₂ O-)	i-C ₃ H ₇	
548	3-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
549	3-Cl, 4-F	i-C ₃ H ₇	

TABLE 2
(continued)

<u>Cmpd.</u> <u>No.</u>	<u>Phenyl Subst.</u>	<u>R₂</u>	<u>R₃</u>
550	4-OCF ₃	i-C ₃ H ₇	
551	3-F,4-Br	i-C ₃ H ₇	
552	4-C ₂ H ₅	i-C ₃ H ₇	
553	4-Cl	i-C ₃ H ₇	
554	4-Cl	i-C ₃ H ₇	
555	3-CF ₃ ,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
556	3,4-OCF ₂ O	i-C ₃ H ₇	
557	3-Br	i-C ₃ H ₇	
558	3-Br,4-F	i-C ₃ H ₇	
559	3,4-F	i-C ₃ H ₇	
560	4-CF ₃	-CH(CH ₃)=CH ₂	

Tabelle 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW,%						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CI%	LH%	MW%	µg
1	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
2	+	+	+	+	+	+	+	NT	NT
3	+	+	+	-	+	+	-	-	NT
4	+	-	+	-	+	+	-	NT	NT
5	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
6	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
7	+	+	NT	+	+	+	+	NT	NT
8	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
9	+	+	+	+	+	+	+	-	NT
10	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
11	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
12	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
13	-	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
14	+	+	NT	NT	+	+	+	+	NT
15	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
16	+	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
17	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
18	-	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
19	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
20	+	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
21	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
22	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
23	+	+	NT	+	+	+	NT	NT	NT
24	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
25	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
26	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
27	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
28	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
29	+	+	+	+	+	+	+	-	NT
30	-	-	+	-	NT	+	-	-	NT
31	-	+	+	-	+	+	-	-	NT
32	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
33	+	+	+	-	+	+	-	-	NT
34	-	-	+	-	+	+	NT	NT	NT
35	+	NT	NT	+	NT	+	-	-	NT
36	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
37	+	NT	+	+	NT	+	+	+	NT
38	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
39	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
40	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
41	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
42	+	-	-	-	-	-	-	-	NT
43	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
44	+	+	+	+	NT	NT	NT	NT	NT
45	+	+	+	+	+	+	-	NT	NT
46	+	+	NT	+	+	+	+	NT	NT
47	+	+	+	+	+	+	+	NT	NT
48	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
49	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
50	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
51	+	+	+	+	NT	+	+	NT	NT
52	+	+	+	-	+	+	+	NT	NT
53	+	+	+	+	+	+	NT	NT	NT
54	+	+	+	+	+	+	+	NT	NT
55	-	+	+	+	+	+	+	NT	-
56	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
57	-	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
58	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
59	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
60	+	NT	+	+	NT	+	+	+	NT
61	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
62	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
63	+	+	+	+	+	+	+	-	NT
64	+	+	+	+	+	+	-	-	NT
65	-	-	+	-	-	+	-	NT	NT
66	+	+	NT	+	+	+	+	NT	-

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW, %						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CL %	LH%	MW %	µg
67	+	+	NT	+	+	+	+	NT	NT
68	+	+	NT	+	NT	+	+	-	+
69	-	-	NT	-	NT	+	-	NT	NT
70	+	+	NT	+	+	+	+	NT	NT
71	+	+	+	+	+	+	+	NT	NT
72	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
73	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
74	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
75	+	+	+	+	NT	+	+	NT	NT
76	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
77	+	+	+	+	+	+	+	-	NT
78	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
79	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
80	+	+	+	+	+	+	+	NT	NT
81	+	+	+	+	+	+	+	+	-
82	+	+	+	+	+	+	+	NT	+
83	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
84	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
85	+	+	NT	-	NT	+	+	-	NT
86	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
87	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
88	-	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
89	+	+	+	+	+	+	+	+	-
90	-	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
91	+	+	NT	-	NT	+	+	NT	NT
92	-	-	NT	-	NT	+	-	NT	NT
93	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
94	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
95	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
96	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
97	+	+	+	+	+	+	NT	NT	NT
98	-	-	NT	+	NT	+	-	NT	NT
99	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
100	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
101	+	+	NT	-	NT	+	+	NT	NT
102	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
103	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
104	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
105	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
106	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
107	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
108	+	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
109	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
110	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
111	-	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
112	-	+	NT	-	NT	+	-	-	-
113	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
114	+	NT	NT	NT	NT	+	NT	NT	NT
115	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
116	+	NT	NT	+	NT	+	NT	-	NT
117	+	-	NT	-	NT	+	+	-	NT
118	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
119	+	-	NT	+	NT	+	+	-	NT
120	+	+	+	+	NT	+	+	-	NT
121	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
122	+	-	NT	+	+	+	-	NT	NT
123	-	NT	NT	-	NT	+	-	-	NT
124	+	-	NT	-	NT	+	-	-	-
125	+	+	NT	+	NT	+	-	-	-
126	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
127	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
128	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
129	-	+	NT	-	NT	+	+	NT	NT
130	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
131	+	+	NT	-	NT	+	+	NT	NT
132	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW,%						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CL %	LH %	MW %	µg
133	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
134	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
135	-	-	NT	-	NT	+	-	NT	NT
136	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
137	+	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
138	+	+	+	+	NT	+	-	-	NT
139	+	+	+	+	+	+	NT	NT	NT
140	-	+	-	-	NT	+	NT	NT	NT
141	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
142	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
143	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
144	+	+	+	+	-	+	+	-	NT
145	-	-	+	-	NT	+	-	NT	NT
146	+	+	+	-	NT	+	NT	NT	NT
147	+	+	+	-	NT	+	NT	NT	NT
148	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
149	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
150	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
151	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
152	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
153	-	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
154	+	+	NT	+	NT	+	-	NT	NT
155	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
156	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
157	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
158	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
159	+	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
160	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
161	+	+	NT	+	NT	+	+	NT	NT
162	-	-	NT	-	NT	+	-	NT	NT
163	-	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
164	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
165	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
166	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
167	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
168	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
169	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
170	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
171	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
172	+	-	NT	+	NT	+	-	-	NT
173	+	-	-	-	-	+	NT	NT	NT
174	+	+	NT	-	+	+	NT	NT	NT
175	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
176	+	+	+	+	+	+	-	+	NT
177	+	+	NT	-	NT	+	-	+	NT
178	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
179	+	+	NT	-	NT	+	+	-	NT
180	+	+	+	+	+	+	+	-	NT
181	+	NT	+	+	+	+	+	+	-
182	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
183	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
184	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
185	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
186	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
187	+	+	NT	-	NT	+	+	NT	NT
188	+	NT	NT	-	NT	+	-	NT	NT
189	+	NT	NT	+	NT	+	+	-	NT
190	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
191	+	+	NT	+	NT	+	-	+	-
192	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
193	+	NT	NT	-	NT	+	+	-	NT
194	+	+	+	+	NT	+	+	-	NT
195	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
196	+	NT	+	-	NT	+	-	-	NT
197	-	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW,%						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW %	CL %	LH %	MW %	µg
198	+	NT	NT	-	NT	+	+	+	-
199	+	NT	+	-	NT	+	NT	-	NT
200	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
201	+	NT	NT	-	NT	+	+	NT	NT
202	+	+	+	-	NT	+	NT	-	NT
203	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
204	-	NT	+	-	NT	+	NT	NT	NT
205	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
206	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
207	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
208	+	+	NT	-	NT	+	+	-	NT
209	+	+	+	+	NT	+	NT	-	NT
210	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
211	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
212	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
213	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
214	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
215	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	+
216	+	+	+	+	+	+	-	+	NT
217	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
218	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
219	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
220	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
221	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
222	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
223	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
224	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
225	-	+	NT	-	NT	+	+	+	NT
226	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
227	+	+	NT	+	NT	+	-	NT	NT
228	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
229	+	+	NT	-	NT	+	NT	+	-
230	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
231	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
232	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
233	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
234	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
235	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
236	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
237	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
238	+	+	+	+	NT	+	+	+	-
239	+	+	+	+	NT	+	-	-	NT
240	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
241	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
242	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
243	+	+	NT	-	NT	+	NT	+	+
244	+	+	+	-	+	+	NT	+	-
245	+	+	+	+	NT	+	NT	NT	NT
246	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
247	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
248	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
249	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
250	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
251	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
252	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
253	+	+	+	-	NT	+	NT	NT	-
254	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
255	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
256	-	+	NT	+	NT	+	-	NT	NT
257	-	+	NT	-	NT	+	-	NT	NT
258	-	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
259	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
260	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
261	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	-
262	+	+	NT	-	NT	+	NT	+	-

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW,%							RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CL%	LH%	MW%	µg	
263	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
264	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
265	+	-	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
266	+	-	+	+	NT	+	NT	NT	NT	
267	+	+	+	+	+	+	+	+	+	
268	+	-	+	+	+	+	+	+	NT	
269	+	-	+	+	+	+	+	-	-	
270	+	-	-	-	+	+	+	-	NT	
271	+	-	NT	+	NT	+	-	-	NT	
272	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
273	+	+	+	+	+	+	+	+	-	
274	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
275	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
276	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
277	+	+	+	+	+	+	+	-	+	
278	+	+	+	+	+	+	+	+	+	
279	+	+	+	+	+	+	+	-	NT	
280	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
281	+	+	+	+	+	+	NT	+	-	
282	+	NT	+	+	+	+	NT	+	NT	
283	+	NT	+	+	+	+	NT	-	NT	
284	+	+	+	NT	+	+	+	+	NT	
285	+	NT	+	+	+	+	NT	+	+	
286	+	+	+	+	+	+	+	+	+	
287	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
288	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
289	+	+	NT	+	NT	+	+	-	+	
290	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
291	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
292	+	NT	NT	+	NT	+	NT	-	NT	
293	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT	
294	-	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT	
295	+	+	+	+	NT	+	+	+	-	
296	+	+	+	+	NT	+	+	NT	+	
297	+	NT	+	+	NT	+	+	+	NT	
298	+	NT	+	+	NT	+	+	+	-	
299	+	NT	NT	+	NT	+	NT	-	NT	
300	+	+	+	+	NT	+	+	+	+	
301	-	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT	
302	+	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT	
303	-	NT	NT	-	NT	+	+	NT	NT	
304	-	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT	
305	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
306	-	NT	NT	+	NT	+	NT	-	NT	
307	-	NT	NT	+	NT	+	NT	-	NT	
308	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
309	-	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
310	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	-	
311	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
312	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
313	-	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
314	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	+	
315	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT	
316	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT	
317	-	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT	
318	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
319	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
320	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
321	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
322	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
323	-	-	+	+	+	+	+	+	+	
324	-	+	+	+	+	+	NT	NT	+	
325	+	+	+	+	+	+	NT	NT	NT	
326	+	-	+	+	+	+	NT	NT	NT	
327	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	
328	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT	

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW, %						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW %	CL %	LH %	MW %	µg
329	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
330	+	+	+	+	NT	+	+	+	+
331	+	-	+	+	+	+	NT	NT	-
332	+	-	+	+	+	+	NT	NT	NT
333	+	+	+	+	-	+	NT	-	NT
334	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
335	+	+	+	+	-	+	NT	+	-
336	+	+	+	+	+	+	NT	+	+
337	+	+	+	+	+	+	NT	+	+
338	+	+	+	+	NT	+	NT	-	+
339	-	+	NT	-	NT	+	NT	+	NT
340	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
341	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
342	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
343	+	+	+	-	-	+	NT	-	NT
344	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
345	-	+	N	-	NT	+	NT	-	NT
346	+	+	+	-	-	-	+	-	NT
347	+	+	+	-	+	+	+	-	NT
348	+	+	+	-	-	+	NT	-	-
349	+	-	+	-	-	+	-	-	NT
350	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
351	+	+	NT	-	NT	+	+	+	NT
352	+	+	+	-	-	+	-	-	NT
353	+	+	NT	-	NT	-	+	+	NT
354	+	+	NT	+	NT	-	+	+	NT
355	+	+	NT	-	NT	-	+	-	NT
356	+	+	NT	+	NT	-	+	+	NT
357	+	+	NT	-	NT	-	+	-	NT
358	+	+	NT	-	NT	-	+	-	NT
359	+	+	NT	+	NT	-	+	-	NT
360	+	+	NT	-	NT	+	+	-	NT
361	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
362	+	+	NT	-	NT	-	-	-	NT
363	+	+	NT	-	NT	-	+	-	NT
364	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
365	-	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
366	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
367	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
368	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
369	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	-
370	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
371	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
372	-	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
373	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
374	+	+	NT	+	NT	-	NT	-	-
375	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	+
376	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	-
377	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
378	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
379	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	-
380	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
381	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
382	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
383	+	+	NT	+	NT	-	NT	-	NT
384	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
385	+	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
386	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	-
387	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
388	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
389	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
390	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	-
391	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
392	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
393	+	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
394	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW, %						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CL%	LH%	MW%	µg
395	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	NT
396	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
397	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
398	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
399	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
400	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
401	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
402	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
403	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
404	+	+	NT	+	NT	-	NT	-	NT
405	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
406	+	+	NT	+	NT	-	NT	-	NT
407	-	+	NT	+	NT	-	NT	-	NT
408	+	+	NT	+	NT	-	NT	-	NT
409	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
410	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
411	+	-	NT	-	NT	-	NT	-	NT
412	+	+	NT	-	NT	-	NT	-	NT
413	+	-	NT	+	NT	+	NT	-	NT
414	+	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
415	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
416	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
417	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
418*	-	-	NT	-	NT	-	NT	-	NT
419*	-	-	NT	-	NT	-	NT	-	NT
420	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
421	-	-	NT	+	NT	+	NT	-	NT
422	+	-	NT	+	NT	+	NT	-	NT
423	-	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
424	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
425	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
426	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
427	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
428	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
429	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
430	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
431	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	NT
432	+	+	+	+	NT	+	NT	-	+
433	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	+
434	+	+	NT	-	NT	+	NT	+	NT
435	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
436	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
437	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
438	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
439	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
440	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
441	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	NT
442	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
443	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	NT
444	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
445	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
446	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
447	+	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
448	+	-	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
449	+	NT	NT	+	NT	+	NT	+	NT
450	+	NT	+	+	+	+	NT	+	NT
451	+	+	+	-	NT	+	+	+	+
452	-	+	NT	+	NT	+	NT	+	+
453	-	-	NT	NT	NT	+	NT	NT	NT
454	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
455	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
456	-	+	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
457	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
458	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
459	-	-	NT	+	NT	+	NT	-	NT
460	-	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT

Table 3 (LC₅₀)

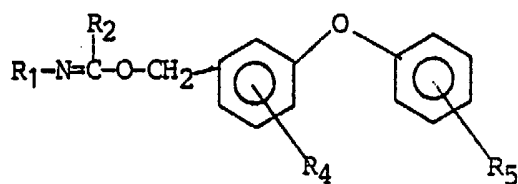
Cmpd.	HF	BBA	TBW,%						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW%	CL%	LH%	MW%	µg
461	+	+	NT	+	+	+	NT	+	NT
462	+	+	+	+	NT	+	+	-	NT
463	+	+	NT	+	+	+	+	+	NT
464	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
465	+	NT	NT	+	NT	+	+	+	NT
466	+	NT	NT	-	NT	+	-	NT	NT
467	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
468	+	+	NT	-	NT	-	NT	NT	NT
469	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
470	+	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
471	+	+	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
472	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
473	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
474	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
475	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
476	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
477	+	N	NT	-	NT	+	NT	+	NT
478	+	NT	NT	-	NT	+	-	-	NT
479	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
480	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
481	-	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT
482	+	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT
483	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
484	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
485	+	NT	NT	-	NT	-	NT	-	NT
486	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
487	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
488	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
489	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
490	-	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
491	+	NT	NT	+	NT	+	-	-	NT
492	+	-	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
493	+	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
494	+	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
495	-	NT	NT	+	NT	+	NT	NT	NT
496	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
497	-	NT	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
498	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
499	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
500	+	-	+	+	+	+	NT	NT	NT
501	+	-	NT	-	NT	+	NT	NT	NT
502	+	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT	NT
503	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
504	+	+	NT	+	NT	+	NT	+	NT
505	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
506	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
507	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
508	-	NT	NT	-	NT	+	NT	-	NT
509	+	-	NT	-	NT	+	NT	-	NT
510	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
511	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
512	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
513	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
514	-	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
515	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
516	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
517	+	-	NT	+	NT	+	-	-	NT
518	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
519	+	-	NT	-	NT	-	+	-	+
520	+	+	+	-	NT	+	+	-	+
521	+	+	NT	-	NT	-	+	-	NT
522	+	+	+	-	NT	+	-	-	NT
523	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
524	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
525	-	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
526	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT

Table 3 (LC₅₀)

Cmpd.	HF	BBA	TBW, %						RWW
No.	µg	%	C	E	BAW %	CL %	LH %	MW %	µg
527	+	+	NT	+	NT	+	-	-	NT
528	+	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
529	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
530	+	+	+	+	NT	+	+	-	NT
531	+	-	+	-	NT	-	-	-	NT
532	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
533	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
534	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
535	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
536	-	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
537	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
538	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
539	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
540	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
541	+	+	NT	-	NT	+	-	-	NT
542*	-	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
543	+	+	NT	-	NT	+	+	-	NT
544	-	+	NT	-	NT	-	-	-	NT
545	+	+	NT	-	NT	-	-	-	NT
546	+	+	NT	-	NT	+	+	+	NT
547	+	+	NT	+	NT	+	+	-	NT
548	-	-	NT	-	NT	+	-	-	NT
549	+	-	NT	-	NT	-	-	-	NT
550	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
551	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
552	-	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
553	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
554	-	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
555	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
556	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
557	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
558	+	+	NT	-	NT	+	NT	-	NT
559	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT
600	+	+	NT	+	NT	+	NT	-	NT

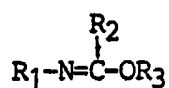
* Compound demonstrated activity in tests against two-spotted mite. (see below)

TABLE 4



Phenyl Subst.	R ₂	R ₄	R ₅
3-Cl,4-F	CHCl ₂	H	4-F
4-i-C ₃ H ₇	sec.-C ₄ H ₉	H	4-F
4-i-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	H
4-i-C ₃ H ₇	CHBrCH ₃	H	4-F
4-i-C ₃ H ₇	CHBrCH ₃	H	H
4-CF ₃	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-F
4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	H	H
4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H
3,4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	H	H
3,4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
3,4-F	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H
3,4-(-OCH ₂ O-)	CH(CH ₃)=CH ₂	H	H
3,4-(-OCH ₂ O-)	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
3,4-(-OCH ₂ O-)	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H
4-OCF ₃	CH(CH ₃)=CH ₂	H	H
4-OCF ₃	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	4-Cl
4-OCF ₃	CH(CH ₃)=CH ₂	4-F	H

TABLE 5



Phenyl Subst.	R ₂	R ₃
4-Cl	CHCl ₂	
4-OCF ₃	CHClCH ₂ CH ₂ Cl	
2,3-Cl	i-C ₃ H ₇	
H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	
3,5-CF ₃	i-C ₃ H ₇	
3-Cl	i-C ₃ H ₇	
3,5-Cl	i-C ₃ H ₇	
2,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
3,4-Cl	i-C ₃ H ₇	
3-Cl	t-C ₄ H ₉	
3,4-OCH ₃	i-C ₃ H ₇	
4-Cl	-CH=C(CH ₃) ₂	

Die Verbindungen in den Tabellen 1 und 2 wurden auch hinsichtlich ihrer Aktivität gegen die Zweipunktmilbe (*Tetranychus urticae* [Koch]) und gegen Larven des westlichen gepunkteten Gurkenkäfers (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata* [Mannerheim]) getestet. Die anfänglichen Test-Konzentrationen betrugen 0,05% (in Lösung) gegen die Milbe und 25 ppm (im Boden) gegen den Käfer. Einige Verbindungen zeigten 50% und größere Sterblichkeit gegen das eine oder andere Insekt bei der Anfangstestkonzentration, die meisten jedoch nicht.

Die anderen Verbindungen aus dem Gebiet dieser Erfindung, die dargestellt wurden und eine Sterblichkeit von 50% oder mehr gegen wenigstens ein Insekt in den oben beschriebenen Tests haben, sind unten aufgelistet. Die meisten dieser Verbindungen sind analog einer Verbindung in Tabelle 1 oder 2, das heißt, sie haben die gleichen Gruppen, die für R₂ und R₃ (oder R₄ und R₅ der Tabelle 1) angegeben sind, sie unterscheiden sich nur darin, daß sie unterschiedliche Substituenten im Phenyl-Ring haben, von den angegebenen Verbindungen. Es sind:

Analoge von Verbindung 81, in denen die Substituenten im Phenyl-Ring sind: 3-Cl,4-Br; 3-CF₃,4-Br; 4-SO₂CH₃; 2-Cl,4-CF₃; 3-F,4-O-CH₂-CH₃; 3-O-CH₃,4-Br; 3-Br,4-OCH₃; 3-F,4-O-CH₃; 3-Cl,4-CH₂-CH₃; 2-Cl,5-CH₂-CH₃; 3-F,4-O-CH₂-CH₃; 4-n-C₃H₇; 2,3,4-F; 3-Cl,4-O-CH₂-CH₃; 3-O-CH₂-CH₃,4-Br; 3-Br,4-O-CH₂-CH₃; 3-OCH₃,4-Cl; 3-OCH₃,4-CF₃; 3-O-CH₂-CH₃,4-Cl; 2-NO₂,4-CF₃; 3-F,4-I; 3-Cl,4-OCHF₂; 3-Br,4-CH₂-CH₃; 2,3-F.

Analoge von Verbindung 82 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 4-CH₃; 4-OCH₃; 2,3-CH₃; 2,4-CH₃; 3,4-CH₃; 3,4-OCH₃; 3-CH₂-CH₃; 3-CH₃; 3-Cl; 4-Br; 3-CF₃,4-Br; 4-I; 3-F; 3-Cl,4-Br; 3-Cl,4-I; 3-I; 4-CN; 3-OCH₃; 4-SO₂-CH₃; 3-O-CH₂-CH₃; 3-OCH₃,4-Br; 3-Br,4-OCH₃; 3-Cl,4-CH₂-CH₃; 3-OCH₃,4-Cl; 3-OCH₃,4-CF₃; 3-OCH₃,4-Br; 3-F,4-Cl; 3-Br,4-O-CH₂-CH₃; 3-Cl,4-OCHF₂; 3-F,4-I und 2,3-F.

Analoge von Verbindung 89 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 4-OCF₃; 3-Cl,4-Br; 3-F,4-Br; 3-NO₂,4-F; 3-CF₃; 3-F,4-CH₃; 2-Cl,5-F; 2,5-F; 3-CF₃,4-NO₂; 4-tert-C₄H₉; 3-CF₃,4-Br; 2-Br,4-tert-C₄H₉; 2-Br,4-iso-C₃H₇; 3,5-CH₃; 3-CH₃; 2,4-CH₃; 3,4-CH₃; 3-CH₃,4-Br; 2,3-CH₃; 4-OCH₃; 4-S-CH₃; 3,4-OCH₃; 3-O-C₂H₅; 3-OCH₃,4-Br; 4-O-C₂H₅; 3-Cl,4-O-C₂H₅; 3-Br,4-OCH₃; 3-F,4-OCH₃; 3-OCF₃; 2-Cl,5-O-C₂H₅; 3-F,4-O-C₂H₅; 4-n-C₃H₇; 3-OCH₃,4-Cl; 3-OCH₃,4-CF₃; 3-O-C₂H₅,4-Cl; 3-OCH₃,4-Br; 3-Br,4-O-C₂H₅; 3-Cl,4-OCHF₂; 3-F,4-I; 3-Br,4-C₂H₅.

Analoge von Verbindung 191 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 4-F; 2,3,4-F und 2,4-F,3-Cl.

Analoge von Verbindung 216 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3,4-(O-CH₂-O); 3-Br; 4-Cl; 4-F; 4-CH₃; 2,4-CH₃; 4-OCH₃; 2,3-CH₃; 3,4-CH₃; 3-CH₂-CH₃; 3-S-CH₃; 3-CH₃; 3-Cl,4-I; 3-OCH₃; 4-S-CH₃; 2-Cl,4-CF₃; 3-OCH₃,4-Br; 3-F,4-OCH₃; 3-Br,4-OCH₃; 3-O-CF₃; 3-Cl,4-CH₂-CH₃; 3-F,4-O-CH₂-CH₃; 3-OCH₃,4-Cl; 3-CF₃,4-OCH₃; 3-O-CH₂-CH₃,4-Cl; 3-O-C₂H₅,4-Br; 3-Br,4-O-C₂H₅; 3-F,4-I und 3-Br,4-CH₂-CH₃.

Analoge von Verbindung 238 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3-CF₃; 3-F; 3-I; 3-F,4-CF₃ und 4-Br.

Analoge von Verbindung 239 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3-CF₃; 3,4-F; 3-OCH₃; 3-CH₃; 4-O-C₂H₅; 2-Cl; 2-CH₃; 3-NO₂,4-F; 3,4-Cl; 3-F,4-CF₃; 4-tert-C₄H₉; 3-Cl; 3-F; 3-CF₃,4-Br; 4-Br; 4-I; 4-CH₂-CH₃; 3-F,4-Br; 3,4-Br; 3-CF₃,4-Cl; 4-OCF₃; 3-S-CH₃; 4-F; 2,4-CH₃; 4-CH₃; 3,4-CH₃; 3-CH₃,4-Br; 3-Cl,4-OCH₃; 2,3-CH₃; 4-OCH₃; 4-S-CH₃; 3-Cl,4-O-CH₂-CF₃; 2-Cl,4-CF₃; 3-OCH₃,4-Br; 3-Br,4-OCH₃; 3-O-CF₃; 3-Cl,4-CH₂-CH₃; 3-F,4-O-C₂H₅; 2,3,4-F; 3-F,4-CH₃; 3-CF₃,4-OCH₃; 3-O-CH₂-CH₃,4-Cl; 3-O-CH₂-CH₃,4-Br; 3-Br,4-O-CH₂-CH₃; 3-Cl,4-O-CHF₂; 3-F,4-I und 3-Br,4-CH₂-CH₃.

Analoge von Verbindung 267 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 4-I; 4-CH₂-CH₃; 3,4-Br; 3-Cl,4-I; 3-I; 3-S-CH₃; 2,4-CH₃; 2-CH₂-CH₃; 3-OCH₃; 4-SO₂-CH₃; 2-Cl,4-CF₃; 3,4-OCH₃; 3-O-CH₂-CH₃; 3-OCH₃,4-Br; 3-Br,4-OCH₃; 3-F,4-OCH₃; 4-O-CH₂-CF₃; 3-Cl,4-OCH₃; 3-F,4-CH₃; 3-OCH₃,4-Cl; 3-CF₃,4-OCH₃; 3-O-CH₂-CH₃,4-Cl; 3-O-CH₂-CH₃,4-Br; 3-F,4-Cl; 2-NO₂,4-CF₃; 3-Br,4-O-CH₂-CH₃; 3-F,4-I; 3-Br,4-CH₂-CH₃; 2,3-F.

Analoge von Verbindung 274 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3-Cl,4-F.

Analogon von Verbindung 447 mit folgendem Substituenten im Phenyl-Ring: 4-I.

Analogon von Verbindung 461 mit folgendem Substituenten im Phenyl-Ring: 4-CF₃.

Analoge von Verbindung 462 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3-Cl,4-O-CHF₂; 3-Cl,4-CH₃; 2,3-CH₃; 3-CF₃,4-Br; 3,4-(O-CH₂-O); 3-NO₂; 2-Cl; 2-CH₃; 3-CF₃,4-F; 3-F,4-CH₃; 3-Cl,4-OCH₃; 3,4-OCH₃; 4-Br; 4-CF₃; 2,4-F,3-Cl; 4-CN; 3-F,4-Br; 4-CH₂-CH₃; 3-CH₃; 3-OCH₃; 3-CH₃,4-F; 3-Br; 4-I; 2-Cl,4-CF₃; 3,4-F; 3-Cl; 3-CH₂-CH₃; 4-F; 4-CH₃; 3-Cl,4-OCH₃; 3-F; 4-O-CH₂-CF₃; 4-O-C₂H₅; 3,4-O-C₂H₅; 3,4-CH₃; 3-Cl,4-I; 2,4-Cl und 3,4-Cl.

Analogon von Verbindung 510 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3-Cl,4-F.

Analoge von Verbindung 516 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 3,4-(O-CH₂-O); 2,4-F,3-Cl.

Analogon von Verbindung 517 mit folgendem Substituenten im Phenyl-Ring: 3,4-(O-CH₂-O).

Analogon zu Verbindung 518 mit folgenden Substituenten im Phenyl-Ring: 2,4-F,3-Cl.

Analogon zu Verbindung 520 mit folgendem Substituenten im Phenyl-Ring: 3-CF₃.

Und die in Tabelle 4 beschriebenen Verbindungen.

Zur Information sind in Tabelle 5 eine sehr kleine Anzahl Verbindungen mit der Definition der Klasse dieser Erfindung aufgeführt, die weniger als 50% Sterblichkeit bei einem insektiziden Bewertungstest ergeben.

Die insektizide Aktivität, und damit der Einschluß einer hier nicht speziell erwähnten Verbindung in die Klasse der Verbindungen dieser Erfindung, wie sie durch die allgemeine Formel (I) repräsentiert wird, kann bestimmt werden durch Prüfung solch einer Verbindung mit Hilfe einer oder mehrerer oder oben beschriebenen Verfahren. Wenn eine Testverbindung Wirksamkeit gegen eines oder mehrere der erwähnten Insekten zeigt und eine Sterblichkeit von 50% oder mehr bewirkt bei der Anfangskonzentration, wird sie als „insektizid“ im Sinne dieser Erfindung angesehen.

In der Praxis kann eine reine Verbindung (aktive Verbindung) als Insektizid benutzt werden. Im allgemeinen werden die Verbindungen jedoch mit einem oder mehreren inerten (das heißt chemisch nicht reagierenden, pflanzenverträglichen oder herbizid inerten) Trägern oder Verdünnern, die für eine insektizide Verwendung geeignet sind, vermischt, bevor sie aufgebracht werden.

Die Zusammensetzungen oder Formulierungen, einschließlich einer der hier beschriebenen Verbindungen, können zahlreiche feste oder flüssige Formen annehmen. Beispiele fester Formen sind Stäube, Granuli, Tabletten, Pulver und ähnliches. Beispiele flüssiger Formen sind Emulsionen, Lösungen, Suspensionen, fließfähige emulgierbare Konzentrate und Pasten. Solche Zusammensetzungen können, zusätzlich zu der oder den aktiven Verbindungen, verschiedene Träger oder Verdünnern enthalten, sowie auch oberflächenaktive Stoffe (Netz-, Dispergier- und/oder Emulgiermittel), Lösungsmittel (Wasser oder organische Lösungsmittel wie aromatische oder chlorierte aliphatische Lösungsmittel), Adhäsive, Dickungsmittel, Bindemittel, Antischäummittel und andere hier schon erwähnte Substanzen. Feste Träger oder Verdünnern, die in solchen Zusammensetzungen oder Formulierungen enthalten sind, können zum Beispiel gemahlene Naturminerale wie Kaolin,

Aluminiumoxid, kalziierte Diatomeenerde, Calciumcarbonat, Siliciumdioxid, Kieselgur, Ton usw. sein, sowie gemahlene synthetische Mineralien wie verschiedene Silikate und Alumosilikate und gemahlene pflanzliche Produkte wie Rinde, Getreidemehl, Sägespäne, Cellulosepulver und ähnliches. Zusammensetzungen, die sorptive Tonarten enthalten, enthalten gewöhnlich auch einen Stabilisator wie einen Glycol, um einen Abbau des Wirkstoffes zu verhindern oder zu minimieren.

Um feste Zusammensetzungen herzustellen, werden die aktiven Verbindungen mit festen Trägern oder Verdünnern wie jenen, die oben erwähnt wurden, gemischt, und das Gemisch wurde bis zu einer geeigneten Größe vermahlen. Granuli können hergestellt werden durch Auflösen der aktiven Verbindung in einem organischen Lösungsmittel und Aufbringen des Gemisches, zum Beispiel durch Zerstäuben, auf ein adsorbierendes granuliertes, inertes Material wie Siliciumoxid. Adhäsive können verwendet werden, um das Haften der Verbindung auf den festen Partikeln zu unterstützen.

Netzable Pulver und Pasten werden erhalten durch Mischen und Verreiben einer aktiven Verbindung mit einem oder mehreren Dispersionsmitteln und/oder festen Trägern oder Verdünnern. Ebenfalls einbezogen werden können Netzmittel und/oder Dispersionsmittel, zum Beispiel Lignine, Methylzellulose, Naphthalensulfonsäure-Derivate, Fettalkoholsulfate und verschiedene Arten von Alkali- und Erdalkalisalzen von Fettsäuren.

Emulgierbare Konzentrate werden allgemein erhalten durch Auflösung der aktiven Verbindung in einem organischen Lösungsmittel, zum Beispiel Butanol, Cyclohexanon, Xylene oder höher siedende aromatische Kohlenwasserstoffe. Um Suspensionen oder Emulsionen in Wasser zu erhalten, können auch Netzmittel zugegeben werden.

Fließfähige Zusammensetzungen werden dargestellt durch Mischen einer aktiven Verbindung mit einem oder mehreren Dispersionsmitteln und/oder festen Additiven und einer Flüssigkeit (die Wasser oder ein organisches Lösungsmittel sein kann), in der die aktive Verbindung relativ unlöslich ist, und Vermahlen des Gemisches.

Sowohl flüssige als auch feste Zusammensetzungen können in Mikrokapseln oder eingekapselter Form vorliegen, wodurch erreicht wird, daß die eingeschlossene aktive Verbindung mit kontrollierter Geschwindigkeit über einen bestimmten Zeitraum freigesetzt wird. Flüssige Zusammensetzungen dieses Typs enthalten eingekapselte Tröpfchen von etwa 1–50 Mikron Durchmesser, die die aktive Verbindung und wahlweise ein Lösungsmittel enthalten. Das Kapselmateriale ist eine inerte, poröse Membran aus einem polymeren Material.

Feste eingekapselte Zusammensetzungen haben allgemein die Form von Granuli, in denen die aktive Verbindung enthaltende Flüssigkeit in den Poren eines granulierten Trägers eingefangen ist, wobei der Wirkstoff mit kontrollierter Geschwindigkeit durch eine poröse polymere Membran abgegeben werden kann, oder die Membran bricht mit kontrollierter Geschwindigkeit zusammen, wodurch der Wirkstoff freigesetzt wird.

Typische Einkapselungsmaterialien sind natürliche und synthetische Gummis, Zellulosematerialien, Styren-Butadien-Copolymere, Polyacrylonitrile, Polyacrylate, Polyamide, Polyisocyanate, Polyurethane, gemischte Copolymere daraus und Stärkexanthogenate.

Es ist möglich, hoch konzentrierte, flüssige Zusammensetzungen, die bis zu etwa 98 % (Gewicht) der aktiven Verbindung enthalten, oder auch die 100 % aktive Verbindung allein zu verwenden, wenn die Verbindung in Form einer fein verteilten Flüssigkeit unter Verwendung verschiedener Zerstäubungsgeräte, zum Beispiel durch Flugzeugversprühtechniken, ausgebracht wird. Für die anderen Zwecke jedoch werden die verschiedenen Arten der Zusammensetzungen, die für diese Verbindungen benutzt werden können, variierende Mengen der Verbindung entsprechend der Art der Zusammensetzung und der beabsichtigten Verwendungen enthalten.

Im allgemeinen können insektizide Zusammensetzung 5–95 % der aktiven Verbindung, vorzugsweise 10–85 %, enthalten. Einige typische Zusammensetzungen enthalten folgende Mengen aktiver Verbindung: Benetzbare Pulver: 25–80 % aktive Verbindung; Ölsuspensionen, Emulsionen, Lösungen, fließfähige und emulgierbare Konzentrate: 5–85 % aktive Verbindung; wäßrige Suspensionen: 20–50 % aktive Verbindungen; Stäube und Pulver: 5–20 % aktive Verbindung; Granuli und Pellets: 5–20 % aktive Verbindung.

Zusätzlich zur aktiven Verbindung und den verschiedenen, bei der Herstellung der erwähnten Zusammensetzungen und Formulierungen verwendeten Mittel können solche Zusammensetzungen auch eine oder mehrere andere aktive Verbindungen sowohl der hier erwähnten Art als auch andere aktive Mittel wie Herbizide, Fungizide, Insektizide, Acarizide, Nematizide, Bakterizide und Pflanzenwachstumsregulatoren enthalten. Das spezielle Pestizid, das in das Gemisch einbezogen wird, hängt von der beabsichtigten Verwendung und der Art der Ergänzung zur geforderten Wirkung ab. Beispiele geeigneter Insektizide sind folgende:

- (a) Natürliche Pyrethrine oder Pyrethroide wie Permethrin, Fenvalerat, Deltamethrin, Cyhalothrin, Biphenthrin, Fenpropathrin, Cyfluthrin, Tefluthrin, Empenthrin, Ethofenprox, Tetramethrin, Bioallethrin, Fenfluthrin, Prallethrin, 5-Benzyl-β-furfuryl-(E)-(1R,S)-2,2-dimethyl-3-(2-oxo-thiolan-3-ylidenmethyl)cyclopropancarboxylat, cis-3-(2-Fluor-2-methoxycarbonyl-ethenyl)-2,2-dimethyl-cyclopropancarbonsäure-pentafluorphenylester;
- (b) Organophosphate wie Propenofos, Sulprofos, Phosmet, Dichlorvos, Methyl-parathion, Azinphos-methyl, Monocrotophos, Dimeton-S-methyl, Heptenophos, Thiometon, Fenamiphos, Triazophos, Methamidophos, Dimethoat, Phosphamidon, Malathion, Chlorpyrifos, Phosalon, Fensulfothion, Fonofos, Phorat, Phoxim, Pyrimiphos-methyl, Fenitrothion und Diazinon;
- (c) Carbamate (einschließlich Aryl-carbamate) wie Pirimicarb, Cloethocarb, Carbofuran, Ethiofencarb, Aldicarb, Thiofurox, Carbosulfan, Bendiocarb, Fenobucarb, Propoxur und Oxamyl;
- (d) Benzoylharnstoffe wie Triflumuron, Chlorofluazuron;
- (e) Organische Zinnverbindungen wie Cyhexatin, Fenbutatin-oxid und Azocyclotin;
- (f) Macrolide wie Avermectine oder Milbemycine, zum Beispiel Abamectin, Avermectin und Milbemycin;
- (g) Hormone und synthetische Analoga davon wie Jugendhormon, Juvabion, Ecdysone, Methopren und Hydropren;
- (h) Pheromone;
- (i) Organochlor-Verbindungen wie Benzenhexachlorid, DDT, Chlordan oder Dieldrin.

Zusätzlich zu den chemischen Hauptklassen der Insektizide, wie sie oben aufgeführt sind, können andere Insektizide, die sich gegen spezielle Ziele richten, im Gemisch verwendet werden, wenn es für die beabsichtigte Verwendung der Mischung geeignet ist. Zum Beispiel können selektive Insektizide für spezielle Pflanzen, zum Beispiel Stielbohrer-spezifische Insektizide zur Verwendung bei Reis wie Cartap oder Buprofesin, angewendet werden. Andererseits können auch Insektizide, die spezifisch für spezielle Insekten-Arten/Entwicklungsstufen sind; zum Beispiel Ovolarvizide wie Clofentezin, Amitraz, Chlordimeformflubenzimmin, Hexythiazox und Tetradifon, Motilizide wie Dicofol oder Propargit, Adultizide wie Bromopropylat, Chlorobenzilat, oder Insekten-Wachstumsregulatoren wie Hydramethylen, Cyromazin, Methopren, Chlorofluazuron und

Diflubenzuron, in die Zusammensetzungen einbezogen werden. Solche Verbindungen können auch Bodendesinfektionsmittel oder Fumigantien enthalten, weiter können sie Düngemittel enthalten, dadurch wird es möglich gemacht, Vielzweckzusammensetzungen zu liefern, die sowohl eine oder mehrere der hier beschriebenen aktiven Verbindungen enthalten als auch, wahlweise, andere Pestizide und auch Dünger, alles beabsichtigt und zusammengestellt zur Verwendung am gleichen Ort. Eine Bekämpfung der Insektenplagen wird erreicht durch Aufbringen einer Zusammensetzung, die eine insektizid wirksame Menge einer hier beschriebenen aktiven Verbindung enthält, auf das Insekt, auf den Ort, an dem die Insektenbekämpfung gewünscht wird, oder auf die Nahrungsquellen (einschließlich Samen), auf denen die Insekten fressen. Zur Verwendung in der zuletzt erwähnten Weise wird eine nicht flüchtige Verbindung bevorzugt. So kann die Bekämpfung erreicht werden durch direktes Aufbringen der aktiven Verbindungen auf die Insekten und indirekt durch Aufbringen der Verbindungen auf den zu schützenden Ort (wie Gemüseland, Grasflächen und Wälder), auf die Nahrungsflächen der Insekten oder auf andere Insektenaufenthaltssorte (zum Beispiel Brut- und Schwarmgebiete). Die Aufbringungsmengen der aktiven Verbindung und die angewendete Konzentration variiert, je nachdem, ob die Verbindung oder Zusammensetzung direkt auf das Insekt oder indirekt auf Orte oder Nahrung aufgebracht werden soll. Im letzteren Fall variiert die Aufbringungsmenge in Abhängigkeit von den zu bekämpfenden Insekten und von der umgebenden Flora im allgemeinen von etwa 0,01 bis etwa 100 Pfund pro acre (etwa 0,01 bis etwa 111 kg/ha).

Es sollte bemerkt werden, daß die aktive Verbindung nicht an und für sich insektizid wirksam sein muß, um eine Insektenbekämpfung zu bewirken. Die Zwecke dieser Erfindung sind voll erfüllt, wenn solche Verbindungen durch äußere Einflüsse wie Licht oder Wärme oder durch eine physiologische Wirkung, die auftritt, wenn die Verbindung in den Körper des Insekts gelangt, aktiv wird.

Verbindungen dieser Erfindung können zur Bekämpfung einer Vielzahl von Insektenarten benutzt werden wie:

Myzus persicae (Blattlaus)
 Aphis gossypii (Blattlaus)
 Aphis fabae (Blattlaus)
 Megoura viciae (Blattlaus)
 Aedes aegypti (Moskitos)
 Anopheles spp. (Moskitos)
 Culex spp. (Moskito)
 Dysdercus fasciatus (Capsid)
 Musca domestica (Hausfliege)
 Pieris brassicae (Kohlweißling)
 Plutella maculipennis (Diamantfliegenmotte)
 Phaenocarpa coelestis (Senfkäfer)
 Aonidiella spp. (Schildläuse)
 Trialeurodes spp. (Weiße Fliegen)
 Bemisia tabaci (Weiße Fliege)
 Blattella germanica (Küchenschabe)
 Periplaneta americana (Küchenschabe)
 Blatta orientalis (Küchenschabe)
 Spodoptera littoralis (Baumwollblattwurm)
 Heliothis virescens (Tabakblütenstecher)
 Chortiocetes terminifera (Heuschrecke)
 Diabrotica spp. (Wurzelwürmer)
 Agrotis spp. (Eulenlarven)
 Chilo suppressalis (Stielbohrer)
 Chilo partellus (Maisstielbohrer)
 Nilaparvata lugens (Pflanzenhüpfer)
 Nephotettix virescens (Blatthüpfer)
 Panonychus ulmi (Europäische rote Milbe)
 Nephotettix cincticeps (Blatthüpfer)
 Panonychus citri (Rote Zitronenmilbe)
 Tetranychus urticae (Zweifpunktspinnmilbe)
 Tetranychus cinnabarinus (Karminspinnmilbe)
 Phyllocoptruta oleivora (Zitronenrostmilbe)
 Polyphagotarsonemus latus (Breitmilbe)
 Brevipalpus spp. (Milben)

Zusammenstellung, die eine oder mehrere der beschriebenen aktiven Verbindungen in einer insektizid wirkenden Menge enthalten, können in jeder konventionellen Weise auf Pflanzen, Orte und Insektenaufenthalte aufgebracht werden.

Wenn in Verbindung mit Gemüse- oder anderem Pflanzenschutz verwendet, sollte die Aufbringung in präventiver (das heißt vor dem Befall) oder ausrottender (das heißt nach dem Befall) Weise erfolgen. So können Pulver und verschiedene flüssige Zusammenstellungen, die die aktive Verbindung enthalten, durch Verwendung eines Pulverzerstäubers, von Baum- und Handzerstäubern und Sprüherstäubern sowie von Flugzeugen als Stäube oder Sprays aufgebracht werden. Wenn nach der letzteren Methode aufgebracht wird, können schon sehr geringe Dosierungen wirksam sein.

Zusammensetzungen mit den aktiven Verbindungen können auch als Zusatz zu Bewässerungswasser, das zu dem zu behandelnden Feld gebracht wird, verwendet werden. Diese Methode gestattet das Eindringen der Verbindungen in den Boden mit Hilfe des darin adsorbierten Wassers.

Die Zusammensetzungen mit den aktiven Verbindungen können zusätzlich verwendet werden, um Pflanzensamen vor dem Befall durch im Boden geborene Insekten nach der Aussaat und während des Keimens zu schützen, und zwar durch Aufbringen der Zusammensetzung auf den Samen. Dies wird im allgemeinen durch Mischen des Samens mit einer aktiven Zusammensetzung in fester oder flüssiger Form (vorzugsweise flüssig) in einer geeigneten Mischapparatur ausgeführt. Flüssige

Zusammensetzungen für diesen Zweck können die Adhäsiv oder Klebemittel enthalten wie Methyl-zellulose, Ethyl-zellulose usw., um das Haften der Zusammensetzung auf dem Samen zu unterstützen. Wenn eine feste Zusammensetzung für diesen Zweck benutzt wird, kann ein Haftmittel während oder nach dem Mischen auf die Samen gesprüht werden. Für die Verwendung als Bodeninsektizid, kann die aktive Verbindung oder die sie enthaltende Zusammensetzung auf konventionelle Weise mit dem Boden gemischt werden, und zwar vor, während oder nach dem Aussäen des Samens. Flüssige Zusammensetzungen können durch Sprühen auf die Oberfläche oder durch Inkorporieren in Berieselungs- oder Sprühwasser aufgebracht werden. Feste oder flüssige Zusammensetzungen, die eine aktive Verbindung enthalten, können durch Eggen, Pflügen oder andere Mischoperationen vor oder während des Aussäens in den Boden inkorporiert werden, um den Wirkstoff unterhalb der Bodenoberfläche zu lokalisieren, wo er am wirksamsten bei der Bekämpfung unerwünschter Larven ist. Beispiele von Zusammensetzungen mit den aktiven Verbindungen dieser Erfindung sind:

Zusammensetzung A: Feste Granulat

Komponente	Gew.-%
Aktive Verbindung	10
Attapulgit-Ton-Granuli	85
Triethylenglycol	5
Gesamt	100 %

Zusammensetzung B: Benetzbares Pulver

Komponente	Gew.-%
Aktive Verbindung	80
Netzmittel (Natrium-dialkyl-naphthalensulfonat)	1
Dispersionsmittel (Natriumlignosulfonat)	4
Verdüner (Aluminium-magnesiumsilicat)	15
Gesamt	100 %

Zusammensetzung C: Verdünnte Lösung

Komponente	Gew.-%
Aktive Verbindung	5
Lösungsmittel (Xylen)	95
Gesamt	100 %

Zusammensetzung D: Emulgierbares Konzentrat

Komponente	Gew.-%
Aktive Verbindung	50
Emulgator (Gemisch von Metallsulfonaten und Polyoxyethylenethern)	10
Lösungsmittel (Xylen)	40
Gesamt	100 %

Zusammensetzung E: Konzentrierte Lösung

Komponente	Gew.-%
Aktive Verbindung	90
Lösungsmittel (Xylen)	10
Gesamt	100 %