



MD 4157 B1 2012.03.31

REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat
pentru Proprietatea Intelectuală

(11) **4157** ⁽¹³⁾ **B1**
(51) Int.Cl: **C07D 261/04** (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01P 7/00 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

(12) BREVET DE INVENȚIE

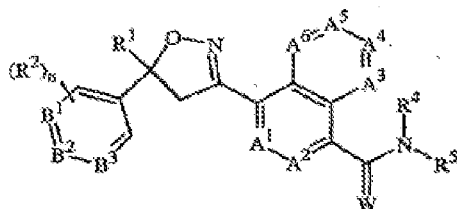
Hotărârea de acordare a brevetului de invenție poate fi revocată în termen de 6 luni de la data publicării	
(21) Nr. depozit: a 2008 0171 (22) Data depozit: 2006.12.28 (31) Nr.: 60/755,247; 60/839,988; 60/857,307 (32) Data: 2005.12.30; 2006.08.23; 2006.11.07 (33) Țara: US; US; US (41) Data publicării cererii: 2009.07.31, BOPI nr. 7/2009	(45) Data publicării hotărârii de acordare a brevetului: 2012.03.31, BOPI nr. 3/2012 (85) 2008.06.24 (86) PCT/US2006/049459, 2006.12.28 (87) WO 2007/079162 A1, 2007.07.12
(71) Solicitant: E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, US (72) Inventatori: LAHM George Philip, US; SHOOP Wesley Lawrence, US; XU Ming, US (73) Titular: E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, US (74) Mandatar autorizat: SOKOLOVA Sofia	

(54) Iloxazoline pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați

(57) Rezumat:

1
Invenția se referă la iloxazoline și compozițiile lor și poate fi utilizată pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați, cum sunt artropodele.

Invenția se referă la compuși noi cu formula (1), care includ toți izomerii geometrici și stereoizomerii, N-oxizii, și sărurile lor:



1
in care A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ sunt selectați independent din grupa constituită din CR³ și N, totodată cel mult trei din A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ reprezintă N; B¹, B² și B³ sunt selectați

2
independent din grupa constituită din CR² și N; fiecare R³ reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, -CN sau -NO₂; R¹, R², R⁴ și R⁵ sunt definiți în descriere; W reprezintă O sau S și n este egal cu 0, 1 sau 2.

5
10
15
Invenția de asemenea se referă la compoziții, ce conțin compuși cu formula (1) și la procedee de combatere a dăunătorilor nevertebrați ce cuprind contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului său cu o cantitate biologic efectivă a unui compus sau compoziții conform invenției.

Revendicări: 28

MD 4157 B1 2012.03.31

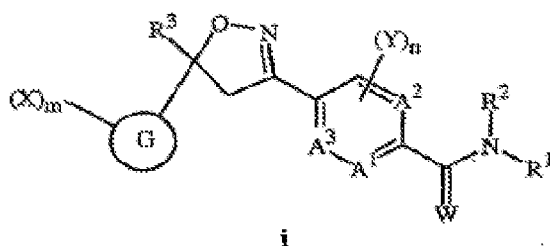
П. формулы: 28

Descriere:

Prezenta invenție se referă la izoxazoline și compozițiile lor și poate fi utilizată pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați, cum sunt artropodele.

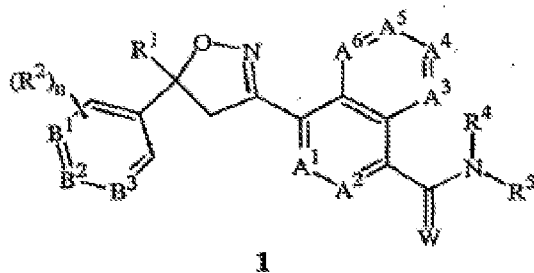
5 Combaterea dăunătorilor nevertebrați este extrem de importantă în atingerea productivității înalte a culturilor. Paguba pricinuită de dăunătorii nevertebrați culturilor agricole depozitate și celor de pe câmp poate cauza o reducere considerabilă a productivității lor, ceea ce ar putea majora prețul de livrare către consumator. Combaterea dăunătorilor nevertebrați este importantă, de asemenea, în silvicultură, pentru culturile de seră, plantele decorative, culturile pentru răsădit, produsele fibroase și produsele alimentare depozitate, în gospodărie, pentru gazon, materiale lemnoase, precum și pentru sănătatea publică a oamenilor și a animalelor. Multe produse sunt disponibile comercial pentru aceste scopuri, dar persistă necesitatea pentru noi compuși mai eficienți, mai puțin costisitori, mai puțin toxici, ecologic puri sau care au diferite moduri de acțiune.

15 Publicarea cererii internaționale PCT WO 05/085216 dezvăluie derivați ai izoxazolinelor cu Formula i în calitate de insecticide



20 in care, *inter alia*, fiecare din A¹, A² și A³ reprezintă independent C sau N; G – ciclul benzenic; W – O sau S; și X – halogen sau C₁-C₆ haloalchil.

Prezenta invenție se referă la compușii cu Formula 1, inclusiv toți izomerii geometrice și stereoizomerii, N-oxizii, și sărurile sale, și compozițiile ce conțin acestea și aplicarea lor pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați:



25 in care

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ sunt selectați independent din grupa constituită din CR³ și N, cu condiția că cel mult 3 din A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ reprezintă N;

30 B¹, B² și B³ sunt selectați independent din grupa constituită din CR² și N; W reprezintă O sau S;

R¹ reprezintă C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁶;

35 fiecare R² reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonyl, C₁-C₆ haloalchilsulfonyl, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, C₂-C₄ alcoxycarbonil, -CN sau -NO₂;

40 fiecare R³ reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonyl, C₁-C₆ haloalchilsulfonyl, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, -CN sau -NO₂;

R^4 reprezintă H, C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil, C_4-C_7 cicloalchilalchil, C_2-C_7 alchilcarbonil sau C_2-C_7 alcocarbonil;

R^5 reprezintă H, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 , sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;

R^4 și R^5 sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați independent din grupa constituită din C_1-C_2 alchil, halogen, -CN, - NO_2 și C_1-C_2 alcoxi;

fiecare R^6 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, -CN sau - NO_2 ;

fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_3-C_6 cicloalchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_8 dialchilamino, C_3-C_6 cicloalchilamino, C_2-C_7 alchilcarbonil, C_2-C_7 alcocarbonil, C_2-C_7 alchilaminocarbonil, C_3-C_9 dialchilaminocarbonil, C_2-C_7 haloalchilcarbonil, C_2-C_7 haloalcoxycarbonil, C_2-C_7 haloalchilaminocarbonil, C_3-C_9 halodialchilaminocarbonil, hidroxi, - NH_2 , -CN sau - NO_2 , sau Q^2 ;

fiecare R^8 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 haloalchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 haloalchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 haloalchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_6 dialchilamino, C_2-C_4 alcocarbonil, -CN sau - NO_2 ;

fiecare R^9 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 haloalchil, C_3-C_6 cicloalchil, C_3-C_6 halocicloalchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 haloalchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 haloalchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 haloalchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_6 dialchilamino, -CN, - NO_2 , fenil sau piridinil;

R^{10} reprezintă H, sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți halogeni;

R^{11} reprezintă H, C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil, C_4-C_7 cicloalchilalchil, C_2-C_7 alchilcarbonil sau C_2-C_7 alcocarbonil;

R^{12} reprezintă H, Q^3 , sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;

R^{11} și R^{12} sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați independent din grupa constituită din C_1-C_2 alchil, halogen, -CN, - NO_2 și C_1-C_2 alcoxi;

Q^1 reprezintă un ciclu fenil, un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, sau un sistem biciclic condensat cu 8, 9 sau 10 membri ce conține opțional de la unu până la trei heteroatomi selectați din până la 1 O, până la 1 S și până la 3 N, fiecare ciclu sau sistem ciclic substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^8 ;

fiecare Q^2 reprezintă independent un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 ;

Q^3 reprezintă un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 ; n reprezintă 0, 1 sau 2.

Prezenta invenție se mai referă la o compoziție ce conține un compus cu Formula 1, un N-oxid sau o sare a sa și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid.

Prezenta invenție de asemenea se referă la o compoziție pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un N-oxid sau o sare a sa și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid,

această compoziție mai conține opțional o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ.

Prezenta invenție se mai referă la o compoziție de pulverizare pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa sau o compoziție descrisă mai sus și o substanță explozivă. Invenția se mai referă la o compoziție de momeală pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa sau o compoziție descrisă mai sus, una sau mai multe substanțe nutritive, opțional un atrăcant, și opțional un umectant.

Prezenta invenție se mai referă la o compoziție pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care cuprinde componentele susmenționate într-un raport potrivit pentru utilizare un dispozitivul-capcană pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care conține un corp prevăzut pentru amplasarea compoziției de momeală, în care corpul are cel puțin un orificiu executat de mărimea care să permită trecerea dăunătorilor nevertebrați prin el și accesul la compoziția de momeală dintr-un loc aflat în afara locașului și în care corpul este suplimentar prevăzut să fie amplasat în sau aproape de locul activității posibile sau cunoscute a dăunătorilor nevertebrați.

Prezenta invenție se mai referă la un procedeu de combatere a dăunătorilor nevertebrați care cuprinde contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului său cu o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa (de exemplu compoziția descrisă aici).

Prezenta invenție de asemenea se referă la un procedeu de combatere a dăunătorilor prin care dăunătorul nevertebrat sau habitatul lui este contactat cu o compoziție ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa, și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid, această compoziție mai conține opțional o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ.

DESCRIEREA DETALIATĂ A INVENȚIEI

Termenii folosiți aici „cuprinde”, „cuprinzând”, „include”, „incluzând”, „are”, „având”, „conține”, „conținând” sau orice altă variație a lor sunt destinați să semnifice includere neexclusivă. De exemplu, o compoziție, un amestec, un procedeu, o metodă, un articol sau un aparat ce conține o listă de elemente nu se limitează în mod obligator numai la aceste elemente, dar pot conține și alte elemente ce nu au fost enumerate în mod expres sau nu sunt inerente acestei compoziții, amestec, procedeu, metode, articol sau aparat. Ulterior, cu excepția cazului când se menționează în mod expres altfel, „sau” se referă la un sau inclusiv și nu la un sau exclusiv. De exemplu, o condiție A sau B corespunde uneia din următoarele: A este adevărată (sau prezentă) și B este falsă (sau nu este prezentă), A este falsă (sau nu este prezentă) și B este adevărată (sau prezentă), și ambele A și B sunt adevărate (sau prezente).

De asemenea articolele nehotărâte „un” sau „o” înainte de un element sau component al invenției sunt destinate să fie nerestrictive în ce privește numărul de exemple (adică apariții) ale elementului sau componentului. De aceea „un” sau „o” trebuie citite pentru a include unul sau cel puțin unul, iar forma singulară a cuvântului care definește elementul sau componentul de asemenea include și pluralul, chiar și atunci când numărul în mod evident este singular.

După cum se menționează în prezenta descriere, termenul „dăunător nevertebrat” include artropodele, gasteropodele și nematozii de importanță economică ca dăunători. Termenul „artropod” include insectele, căpușele, păianjenii, scorpionii, chilopodele, miriapodele, cainele-babei (mâța popii) și scolopendrele. Termenul „gastropod” include melcii, limacii și alte *Stylommatophora*. Termenul „helminți” include viermii de tipul *Nemathelminth*, *Platyhelminth* și *Acanthocephala* cum ar fi: limbricii, viermii intestinali, nematozii fitofagi (Nematoda), trematode (Trematoda), viermii paraziți în formă de panglică (Cestoda) și viermii paraziți cu cap țepos.

În contextul acestei descrieri „combaterea dăunătorilor nevertebrați” înseamnă inhibiția dezvoltării dăunătorilor nevertebrați (inclusiv moartea, reducerea hrănirii și/sau împiedicarea împerecherii), iar expresiile inrudite sunt definite similar.

Termenul „agronic” se referă la producția culturilor de câmp, cum ar fi cele alimentare și pentru fibre, și include creșterea grânelor, culturilor de soia, altor leguminoase, orezului, cerealelor (în special grâul, ovăzul, orzul, secara, orezul,

porumbul), legumelor frunzoase (ex. lăptuca, varza și alte culturi de varză), legumelor fructifere (ex. roșiile, ardeii, vinetele, cruciferele și dovlecii), cartofilor, batăților, poamei, bumbacului și fructelor (ex., poamele semincere, fructele cu sămburi și fructele citrice), fructe mici (pomușoare, vișine) și alte culturi de specialitate (ex., canola, floarea-soarelui, măsline). Termenul „neagronomic” se referă la alte culturi horticoale (ex. plante de seră, pepinieră sau ornamentale, care nu sunt crescute în câmp), structuri rezidențiale și comerciale în localități urbane și industriale, gazoane (ex. gazoanele gospodăriilor, izlazurile, terenurile de golf, terenurile rezidențiale, terenurile recreaționale sportive etc.), produse lemnoase, produse depozitate, aplicațiile din domeniul managementului agroforestier și vegetal, sănătății publice (umane) și sănătății animalelor (ex., animalelor domestice, cum ar fi animalele de casă, inventarul viu și păsările de curte, animale nedomestice, cum ar fi animalele sălbatice).

În enumerările de mai sus, termenul „alchil”, utilizat fie singur, fie în cuvinte compuse, cum ar fi „alchiltio” sau „haloalchil” include alchil cu catenă liniară sau ramificată, cum ar fi metil, etil, *n*-propil, *i*-propil, sau diverși izomeri butil, pentil sau hexil. „Alchenil” include alchene cu catenă liniară sau ramificată, cum ar fi etenil, 1-propenil, 2-propenil, și diverși izomeri butenil, pentenil și hexenil. „Alchenil” de asemenea include poliene, cum ar fi 1,2-propadienil și 2,4-hexadienil. „Alchinil” include alchine cu catenă liniară sau ramificată, cum ar fi etinil, 1-propinil, 2-propinil și diverși izomeri butinil, pentinil și hexinil. „Alchinil” de asemenea poate include catene conținând multiple legături triple, cum ar fi 2,5-hexadiinil.

„Alcoxi” include, de exemplu, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, izopropiloxi și diverși izomeri butoxi, pentoxi și hexiloxi. „Alchiltio” include catene alchiltio ramificate sau liniare, cum ar fi metiltio, etiltio, și diverși izomeri propiltio, butiltio, pentiltio și hexiltio. „Alchilsulfonil” include ambii enantiomeri dintr-o grupă alchilsulfonil. Exemplele de „alchilsulfonil” includ $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ și diverși izomeri butilsulfonil, pentilsulfonil și hexilsulfonil. Exemplele de „alchilsulfonil” includ $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ și diverși izomeri butilsulfonil, pentilsulfonil și hexilsulfonil. „Alchilamino”, „dialchilamino” și cele similare, sunt definite în mod analogic cu exemplele de mai sus. „Cicloalchil” include, de exemplu, ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil și ciclohexil. Termenul „alchilcicloalchil” înseamnă substituirea alchilului în catena cicloalchil și include, de exemplu, etilciclopropil, *i*-propilciclobutil, 3-metilciclopentil și 4-metilciclohexil. Termenul „cicloalchilalchil” înseamnă substituirea cicloalchilului în catena alchil. Exemplele de „cicloalchilalchil” includ ciclopropilmetil, ciclopentiletil și alte catene cicloalchil, legate de grupele alchil liniare sau ramificate.

Termenul „halogen”, fie singur, fie în cuvinte compuse, cum ar fi „haloalchil”, sau folosit în descrierile, cum ar fi „alchil substituit cu halogen” include fluor, clor, brom sau iod. Suplimentar, când este utilizat în cuvinte compuse, cum ar fi „haloalchil”, sau folosit în descrierile, cum ar fi „alchil substituit cu halogen”, alchilul menționat poate fi substituit parțial sau complet cu atomi ai halogenului care pot fi aceiași sau diferiți. Exemplele de „haloalchil” „alchil substituit cu halogen” includ $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- și CF_3CCl_2- . Termenii „halocicloalchil”, „haloalcoxi”, „haloalchiltio” și cei similari acestora sunt definiți în mod analogic cu termenul „haloalchil”. Exemplele de „haloalcoxi” includ $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ și $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Exemplele de „haloalchiltio” includ $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ și $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Exemplele de „haloalchilsulfonil” includ $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ și $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Exemplele de „haloalchilsulfonil” includ $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ și $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$.

„Alchilcarbonil” înseamnă catene alchil liniare sau ramificate legate de catena $\text{C}(=\text{O})$. Exemplele de „alchilcarbonil” includ $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ și $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Exemplele de „alcoxycarbonil” includ $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ și diverși izomeri butoxi- sau pentoxycarbonil.

Numărul total al atomilor de carbon în grupa de substituie este indicat de prefixul „C_i-C_j”, în care *i* și *j* sunt numere de la 1 până la 8. De exemplu, C₂-C₄ alchilsulfonil înseamnă metilsulfonil până la butilsulfonil; C₂ alcoxialchil înseamnă CH_3OCH_2 ; C₃ alcoxialchil înseamnă, de exemplu, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ sau $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; și C₄ alcoxialchil înseamnă diverși izomeri ai unei grupe alchil substituiți cu o grupă

alcoxi ce conține în total patru atomi de carbon, exemplele incluzând $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ sau $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

Când un compus este substituit cu un substituent ce are un indice inferior ce indică că numărul substituenților menționați poate depăși 1, substituenții menționați (când depășesc 1) sunt selectați independent din grupa substituenților definiți, ex. $(\text{R}^2)_n$, n reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5. Când o grupă conține un substituent care poate fi hidrogen, de exemplu R^2 , atunci când acest substituent este luat ca hidrogen, se va recunoaște că acesta este echivalent grupei menționate care nu este substituită.

Termenul „nucleu heterociclic”, „heterociclu” sau „sistem heterociclic” înseamnă cicluri sau sisteme, în care cel puțin un atom nu este carbon, ex. nitrogen, oxigen sau sulf. În mod obișnuit nucleul heterociclic conține cel mult 4 nitrogeni, cel mult 2 atomi de oxigen și cel mult 2 atomi de sulf. Nucleul heterociclic poate fi legat prin intermediul oricărui carbon sau nitrogen disponibil prin înlocuirea hidrogenului cu carbonul sau nitrogenul menționat. Nucleul heterociclic poate fi un nucleu saturat, parțial nesaturat sau deplin nesaturat. Când un nucleu heterociclic deplin nesaturat corespunde regulii lui Hückel, atunci nucleul menționat se mai numește „nucleu heteroaromatic” sau „nucleu heterociclic aromatic”.

Termenul „nucleu aromatic” sau „sistem ciclic aromatic” înseamnă carbocicluri și heterocicluri deplin nesaturate în care cel puțin un nucleu din sistemul de nucleee policiclice este aromatic (în care aromatic indică că regula lui Hückel este adevărată pentru sistemul ciclic). Termenul „sistem biciclic condensat” include un sistem ciclic compus din două nucleee condensate, în care oricare din nucleee poate fi saturat, parțial nesaturat sau deplin nesaturat. Termenul „sistem heterobiciclic condensat” include un sistem ciclic compus din două nucleee condensate, în care cel puțin un atom al nucleului nu este carbon și poate fi aromatic sau nearomatic, după cum a fost definit mai sus.

Termenul „substituit opțional” în legătură cu nucleee heterociclice se referă la grupele care sunt nesubstituite sau au cel puțin un substituent non-hidrogen care nu extinde activitatea biologică posedată de analogul nesubstituit. Dacă se folosesc aici, următoarele definiții se vor aplica, cu excepția cazului când se indică altfel. Termenul „substituit opțional” este folosit înlocuindu-se reciproc cu fraza „substituit sau nesubstituit” sau cu termenul „(ne)substituit”. Dacă nu se indică altfel, o grupă substituită opțional poate avea un substituent pe fiecare poziție a grupei și fiecare substituție este independentă de alta.

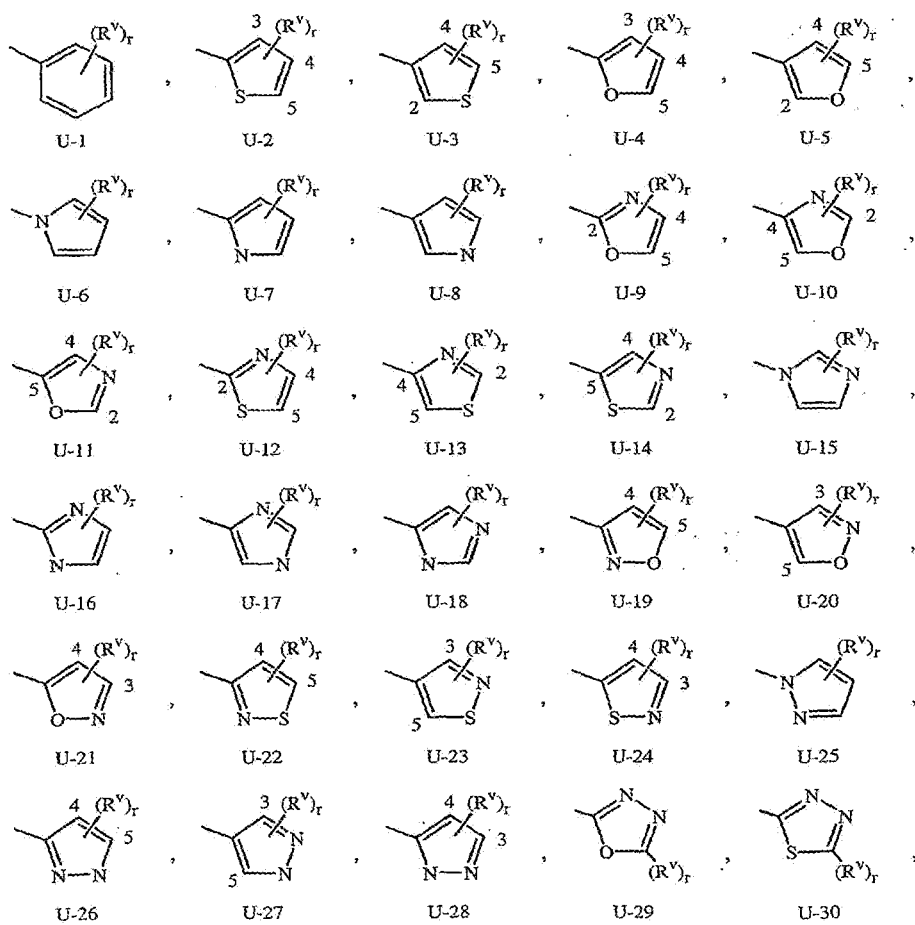
Când Q^1 reprezintă un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri ce conține nitrogen, acesta poate fi legat de restul Formulei 1 prin orice atom disponibil de carbon sau nitrogen al nucleului, cu excepția cazului când se indică altfel. În mod similar, când Q^2 sau Q^3 reprezintă un heterociclu cu 5 sau 6 membri ce conține nitrogen, acesta poate fi legat prin orice atom disponibil de carbon sau nitrogen al nucleului, cu excepția cazului când se indică altfel.

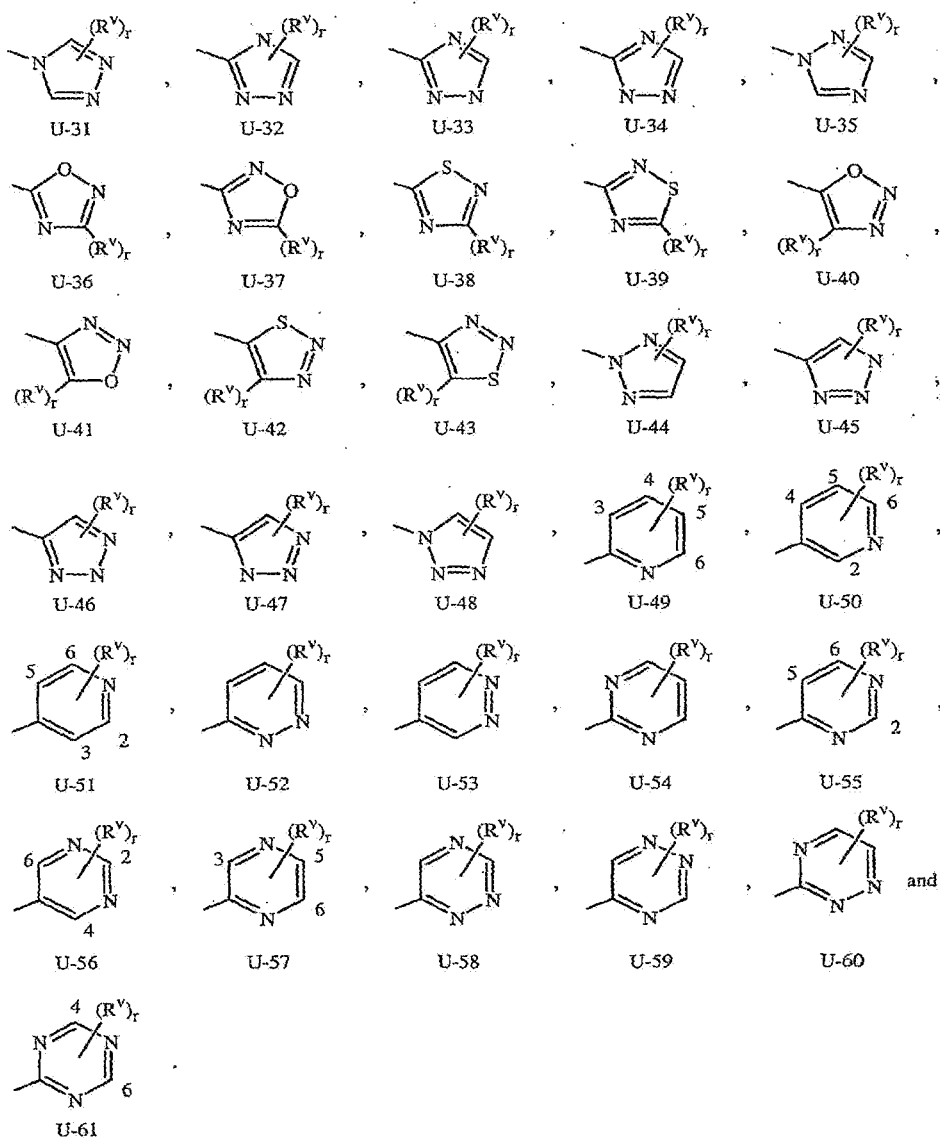
După cum se menționează mai sus, Q^1 , Q^2 sau Q^3 pot reprezenta (printre altele) fenil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați dintr-o grupă de substituenți definiți în esența invenției. Un exemplu de fenil substituit opțional cu unul până la cinci substituenți este nucleul ilustrat ca U-1 în Schema 1, în care R^v reprezintă R^8 sau R^9 definiți în esența invenției pentru Q^1 , Q^2 sau Q^3 , iar r este un număr întreg de la 0 până la 5.

După cum se menționează mai sus, Q^1 , Q^2 sau Q^3 pot reprezenta (printre altele) un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, care poate fi saturat sau nesaturat, substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați dintr-o grupă de substituenți definiți în esența invenției.

Exemplele de nucleee heterociclice aromatice cu 5 sau 6 membri substituiți opțional cu unul sau mai mulți substituenți includ nucleeele U-2 până la U-61 ilustrate în Schema 1, în care R^v reprezintă orice substituent definit în esența invenției pentru Q^1 , Q^2 sau Q^3 (ex. R^8 sau R^9), iar r este un număr întreg de la 0 până la 4.

Schema 1



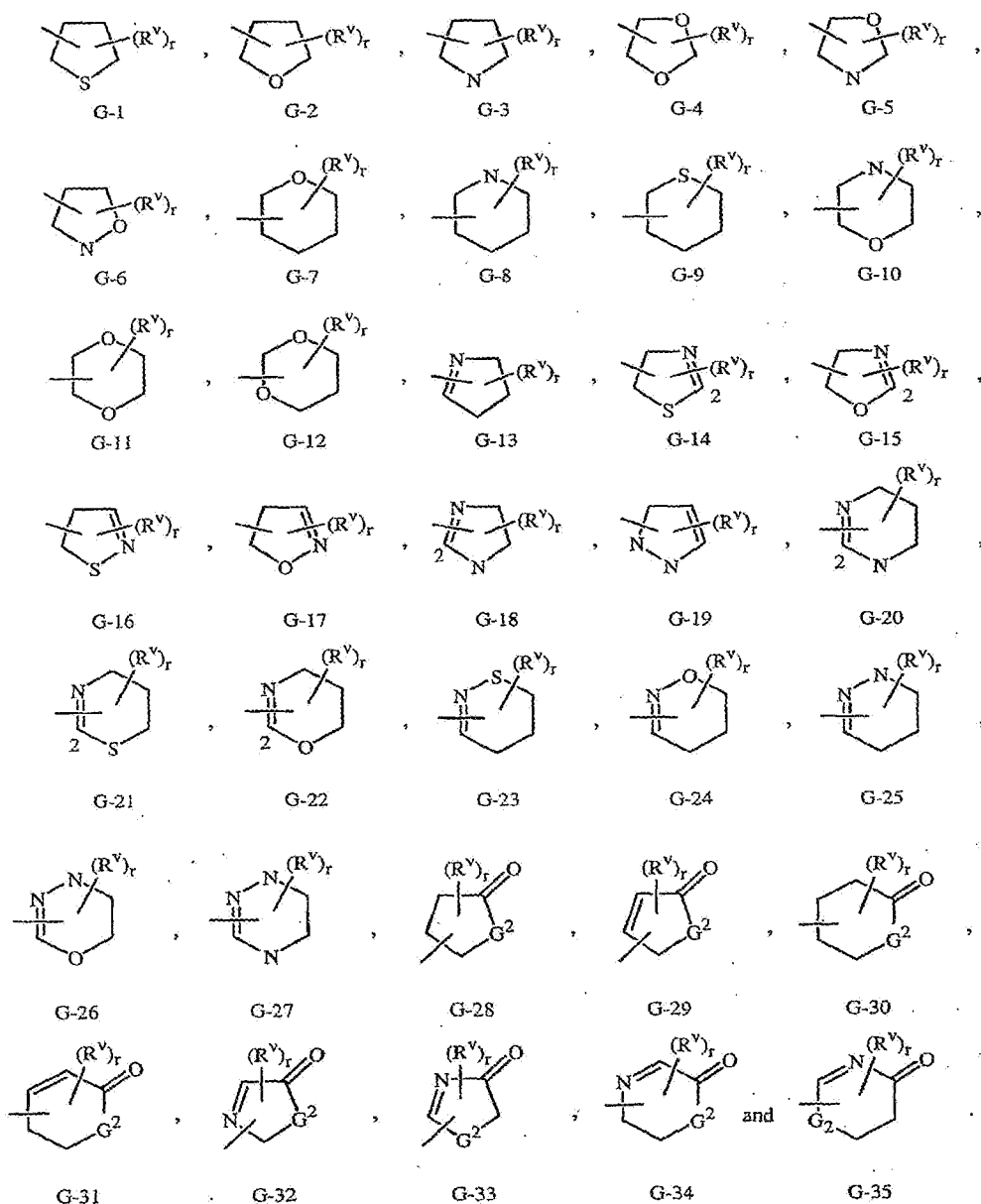


De menționat că atunci când Q^1 , Q^2 sau Q^3 reprezintă un nucleu heterociclic nearomatic saturat sau nesaturat cu 5 sau 6 membri substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați dintr-o grupă de substituenți definiți în esența invenției pentru Q^1 , Q^2 sau Q^3 , unul sau doi membri ai nucleului carbonic din heterociclu pot fi opțional în formă oxidată de catena carbonil.

Exemplele de nucleu heterociclic nearomatic saturat sau nesaturat cu 5 sau 6 membri includ nucleele G-I - G-35 ilustrate în Schema 2. De menționat că în cazul în care punctul de legătură în grupa G este ilustrat ca flotant, grupa G poate fi legată de restul Formulei 1 prin intermediul oricărui carbon sau nitrogen disponibil al grupei G prin înlocuirea atomului de hidrogen. Substituenții opționali pot fi legați de orice carbon disponibil prin înlocuirea atomului de hidrogen.

De menționat că atunci când Q^1 , Q^2 sau Q^3 conțin un nucleu selectat de la G-28 până la G-35, G^2 este selectat din O, S sau N. De menționat că în cazul în care G^2 reprezintă N, atomul de nitrogen poate completa valența sa prin substituție fie cu H, fie cu substituenți definiți în esența invenției pentru Q^1 , Q^2 sau Q^3 (ex. R^8 sau R^9).

Schema 2

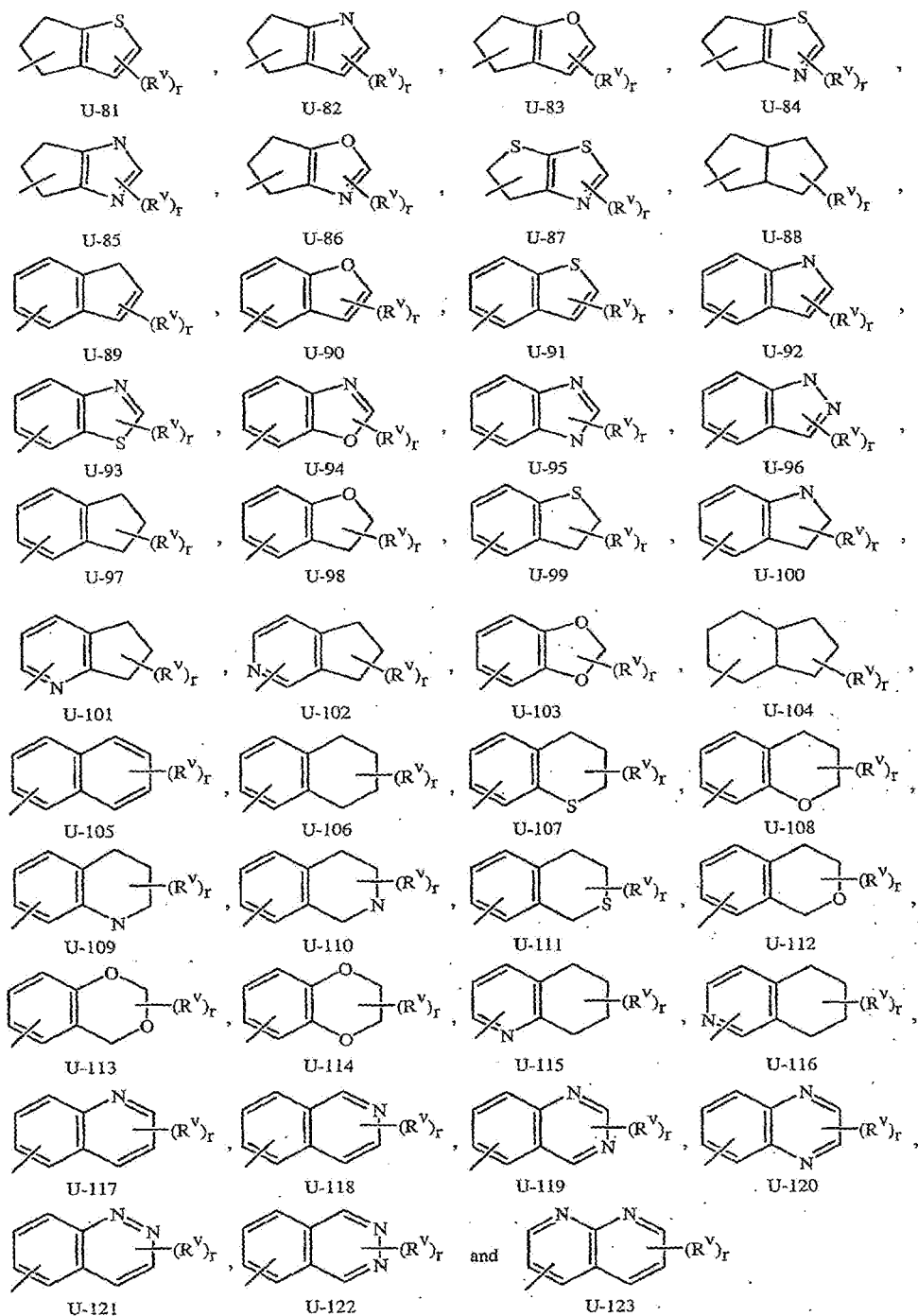


5

După cum se menționează mai sus, Q^1 poate fi (printre altele) un sistem biciclic condensat cu 8, 9 sau 10 membri substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați dintr-o grupă de substituenți definiți în esența invenției (ex. R^8). Exemplele de sistem biciclic condensat cu 8, 9 sau 10 membri substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți includ nucleele U-81 până la U-123 ilustrate în Schema 3, în care R^v reprezintă orice substituent definit în esența invenției pentru Q^1 (ex. R^8), iar r reprezintă un număr întreg de la 0 până la 4.

10

Schema 3



5

10

Cu toate că grupele R^V sunt arătate în structurile U-1 - U-123, e de menționat că prezența lor nu este obligatorie, deoarece ele reprezintă substituenți opționali. De menționat că în cazul în care R^V reprezintă H legat de un atom, este același lucru ca și în cazul când acest atom nu este substituit. Atomii de nitrogen care necesită substituție pentru a-și completa valența sunt substituiți cu H sau R^V . De menționat că atunci când punctul de legătură între $(R^V)_r$ și grupa U este ilustrat ca flotant, $(R^V)_r$ poate fi legat de orice atom de carbon sau de atom de nitrogen disponibil al grupei U. De menționat că în cazul în care punctul de legătură în grupa U este ilustrat ca flotant, grupa U poate fi legată

de restul Formulei 1 prin intermediul oricărui carbon sau nitrogen disponibil al grupei U prin înlocuirea atomului de hidrogen. De menționat că unele grupe U pot fi substituite numai cu cel mult de 4 grupe R^v (ex. de la U-2 până la U-5, de la U-7 până la U-48, de la U-52 până la U-61).

5 Compușii prezentei invenții pot exista ca unul sau mai mulți stereoizomeri. Diverși stereoizomeri includ enantiomeri, diastereomeri, atropizomeri și izomeri geometrici. Un specialist în domeniu va recunoaște că un stereoizomer poate fi mai activ și/sau poate manifesta efecte pozitive când este îmbogățit relativ la un alt (alți) stereoizomer(i) sau când este separat de la alt (alți) stereoizomer(i). Suplimentar, un specialist știe cum să
10 separe, îmbogățească și/sau să prepare selectiv stereoizomerii menționați. Compușii invenției pot fi prezenți ca un amestec de stereoizomeri, stereoizomeri individuali sau ca o formă optic activă.

Un specialist în domeniu va recunoaște că nu toate nuclee heterociclice cu conținut de nitrogen pot forma N-oxizi, deoarece nitrogenul necesită un cuplu solitar disponibil
15 pentru oxidarea oxidului; un specialist în domeniu va recunoaște acele nuclee heterociclice cu conținut de nitrogen care pot forma N-oxizi. Un specialist în domeniu, de asemenea, va recunoaște că aminele terțiare pot forma N-oxizi. Procedeele sintetice pentru prepararea N-oxizilor heterociclicurilor și aminelor terțiare sunt foarte bine cunoscute unui specialist din domeniu, inclusiv oxidarea heterociclicurilor și aminelor
20 terțiare cu acizi peroxi, cum ar fi acidul peracetic și m-cloroperbenzoic (AMCPB), peroxidul de hidrogen, alchil hidroperoxizii, cum ar fi t-butil hidroperoxidul, perboratul de sodiu și dioxirane, cum ar fi dimetildioxiranul. Aceste procedee de preparare a N-oxizilor au fost descrise pe larg și revizuite în literatură, vezi de exemplu: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler și B. Stanovnik în *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton și A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett și B. R. T. Keene în *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler și B. Stanovnik în *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky și A. J. Boulton, Eds., Academic Press; și G. W. H. Cheeseman și E. S. G. Werstiuk în *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky și A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Sărurile compușilor invenției includ săruri de acid-adiție cu acizi anorganici sau organici, cum ar fi acizii hidrobromic, hidrocloric, nitric, fosforic, sulfuric, acetic, butiric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salicilic, tartaric, 4-toluensulfonic sau valeric. In compozițiile și procedeele prezentei invenții, sărurile compușilor invenției sunt
35 favorabile de preferință pentru utilizările agronomice și neagronomice descrise aici. Sărurile compușilor invenției de asemenea includ săruri formate cu baze organice (ex. piridina sau trietilamina) sau cu baze anorganice (ex. hidroxizi sau carbonați de sodiu, potasiu, litiu, calciu, magneziu sau bariu), când compusul conține o parte acidă, cum ar fi cand R⁴ reprezintă alchilcarbonil și R⁵ reprezintă H. Respectiv prezenta invenție cuprinde compușii selectați din Formula 1, N-oxizi și sărurile sale potrivite din punct de vedere agricol.

Variantele de realizare a prezentei invenții descrise în esența invenției:

45 Varianta de realizare 1. Un compus cu Formula 1 în care R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁶.

Varianta de realizare 2. Un compus al Variantei de realizare 1, în care R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit opțional cu halogen.

Varianta de realizare 3. Un compus al Variantei de realizare 2, în care R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit cu halogen.

50 Varianta de realizare 4. Un compus al Variantei de realizare 3, în care R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit cu F.

Varianta de realizare 5. Un compus al Variantei de realizare 4, în care R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit în întregime cu F.

55 Varianta de realizare 6. Un compus al Variantei de realizare 5, în care R¹ reprezintă CF₃.

Varianta de realizare 7. Un compus cu Formula 1, în care fiecare R² reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ haloalchil, C₁-C₆ haloalcoxi sau -CN.

Varianta de realizare 8. Un compus al Variantei de realizare 7, in care fiecare R^2 reprezintă independent H, CF_3 , OCF_3 , halogen sau -CN.

Varianta de realizare 9. Un compus al Variantei de realizare 7, in care fiecare R^2 reprezintă independent halogen sau C_1-C_3 haloalchil.

5 Varianta de realizare 10. Un compus cu Formula 1, in care fiecare R^3 reprezintă independent H, halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 haloalchil, C_3-C_6 cicloalchil, C_3-C_6 halocicloalchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, -CN sau $-NO_2$.

10 Varianta de realizare 11. Un compus al Variantei de realizare 10, in care fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1-C_4 alchil, C_1-C_4 haloalchil, C_3-C_6 cicloalchil, C_1-C_4 alcoxi sau -CN.

Varianta de realizare 12. Un compus al Variantei de realizare 11, in care fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1-C_4 alchil sau -CN.

Varianta de realizare 13. Un compus al Variantei de realizare 12, in care fiecare R^3 reprezintă H.

15 Varianta de realizare 14. Un compus cu Formula 1, in care R^4 reprezintă H, C_1-C_6 alchil, C_2-C_7 alchilcarbonil sau C_2-C_7 alcoxycarbonil.

Varianta de realizare 15. Un compus al Variantei de realizare 14, in care R^4 reprezintă H.

20 Varianta de realizare 16. Un compus cu Formula 1, in care R^5 reprezintă H, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 , sau C_1-C_4 alchil, C_2-C_4 alchenil, C_2-C_4 alchinil, C_3-C_4 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

25 Varianta de realizare 17. Un compus al Variantei de realizare 16, in care R^5 reprezintă H, sau C_1-C_4 alchil, C_2-C_4 alchenil, C_2-C_4 alchinil, C_3-C_4 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

Varianta de realizare 18. Un compus al Variantei de realizare 17, in care R^5 reprezintă H, sau C_1-C_4 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

30 Varianta de realizare 19. Un compus al Variantei de realizare 18, in care R^5 reprezintă C_1-C_4 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

Varianta de realizare 20. Un compus al Variantei de realizare 19, in care R^5 reprezintă CH_2CF_3 .

35 Varianta de realizare 21. Un compus al Variantei de realizare 19, in care R^5 reprezintă CH_2 -2-piridinil.

Varianta de realizare 22. Un compus al Variantei de realizare 16, in care R^5 reprezintă OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 .

40 Varianta de realizare 23. Un compus al Variantei de realizare 22, in care R^5 reprezintă $NR^{11}R^{12}$.

Varianta de realizare 24. Un compus al Variantei de realizare 22, in care R^5 reprezintă Q^1 .

Varianta de realizare 25. Un compus cu Formula 1, in care R^6 reprezintă halogen.

45 Varianta de realizare 26. Un compus cu Formula 1, in care fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_1-C_4 alchil, C_1-C_4 alcoxi, C_1-C_4 alchiltio, C_1-C_4 alchilsulfinil, C_1-C_4 alchilsulfonil, C_2-C_4 alchil carbonil, C_2-C_4 alcoxycarbonil, C_2-C_5 alchilaminocarbonil, C_2-C_5 haloalchilcarbonil, C_2-C_5 haloalcoxycarbonil, C_2-C_5 haloalchilaminocarbonil, $-NH_2$, -CN sau $-NO_2$ sau Q^2 .

50 Varianta de realizare 27. Un compus al Variantei de realizare 26, in care fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_2-C_4 alcoxycarbonil, C_2-C_5 alchilaminocarbonil, C_2-C_5 haloalcoxycarbonil, C_2-C_5 haloalchilaminocarbonil, $-NH_2$, -CN sau $-NO_2$; sau Q^2 .

Varianta de realizare 28. Un compus al Variantei de realizare 27, in care fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_2-C_5 alchilaminocarbonil, C_2-C_5 haloalchilaminocarbonil sau Q^2 .

55 Varianta de realizare 29. Un compus al Variantei de realizare 28, in care fiecare R^7 reprezintă independent halogen sau Q^2 .

Varianta de realizare 30. Un compus al Variantei de realizare 29, in care fiecare R^7 reprezintă independent F, Cl sau Br.

Varianta de realizare 31. Un compus al Variantei de realizare 30, in care fiecare R^7 reprezintă F.

5 Varianta de realizare 32. Un compus al Variantei de realizare 29, in care fiecare R^7 reprezintă Q^2 .

Varianta de realizare 33. Un compus cu Formula 1, in care fiecare R^8 reprezintă independent halogen, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 haloalchil sau -CN.

10 Varianta de realizare 34. Un compus cu Formula 1, in care fiecare R^9 reprezintă halogen, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 haloalchil, -CN, fenil sau piridinil.

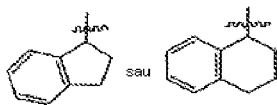
Varianta de realizare 35. Un compus cu Formula 1, in care R^{10} reprezintă H; sau C_1 - C_6 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți halogeni.

Varianta de realizare 36. Un compus cu Formula 1, in care R^{11} reprezintă H, C_1 - C_6 alchil, C_2 - C_7 alchilcarbonil sau C_2 - C_7 alcoxycarbonil.

15 Varianta de realizare 37. Un compus al Variantei de realizare 34, in care R^{11} reprezintă H.

Varianta de realizare 38. Un compus cu Formula 1, in care R^{12} reprezintă H sau Q^3 ; sau C_1 - C_4 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

20 Varianta de realizare 39. Un compus cu Formula 1, in care Q^1 reprezintă fenil, piridinil, tiazolil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^8 .



25 Varianta de realizare 40. Un compus cu Formula 1, in care fiecare Q^2 reprezintă independent fenil, piridinil sau tiazolil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 .

Varianta de realizare 41. Un compus al Variantei de realizare 34, in care fiecare Q^2 reprezintă independent fenil, piridinil sau tiazolil.

30 Varianta de realizare 42. Un compus cu Formula 1, in care Q^3 reprezintă fenil, piridinil sau tiazolil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 .

Varianta de realizare 43. Un compus cu Formula 1, in care A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă fiecare CR^3 .

35 Varianta de realizare 44. Un compus cu Formula 1, in care A^1 reprezintă N; iar A^2 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă fiecare CR^3 .

Varianta de realizare 45. Un compus cu Formula 1, in care A^2 reprezintă N; iar A^1 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă fiecare CR^3 .

Varianta de realizare 46. Un compus cu Formula 1 in care A^4 reprezintă N; și A^1 , A^2 , A^3 , A^5 sau A^6 are fiecare CR^3 .

40 Varianta de realizare 47. Un compus cu Formula 1, in care A^6 reprezintă N; iar A^1 , A^2 , A^3 , A^4 și A^5 reprezintă fiecare CR^3 .

Varianta de realizare 48. Un compus cu Formula 1, in care B^1 , B^2 și B^3 reprezintă independent CR^2 .

45 Varianta de realizare 49. Un compus al Variantei de realizare 48, in care B^2 reprezintă CH.

Varianta de realizare 50. Un compus cu Formula 1, in care B^1 reprezintă N; iar B^2 și B^3 reprezintă independent CR^2 .

Varianta de realizare 51. Un compus cu Formula 1, in care B^2 reprezintă N; iar B^1 și B^3 reprezintă independent CR^2 .

50 Varianta de realizare 52. Un compus cu Formula 1, in care B^2 reprezintă CR^2 ; iar B^1 și B^3 reprezintă N.

Varianta de realizare 53. Un compus cu Formula 1, în care W reprezintă O.

Varianta de realizare 54. Un compus cu Formula 1, în care n reprezintă 0.

Variantele de realizare a prezentei invenții, inclusiv Variantele de realizare 1-54 de mai sus, precum și orice alte variante de realizare descrise aici, pot fi combinate în orice mod, iar descrierile variabilelor în variantele de realizare a invenției se referă nu numai la compușii cu Formula 1, ci și la compușii inițiali și compușii intermediari. Suplimentar, variantele de realizare a prezentei invenții, inclusiv Variantele de realizare 1-54 de mai sus, precum și orice alte variante de realizare descrise în prezenta invenție și orice combinații ale lor, se referă la compozițiile și procedeele prezentei invenții.

10 Combinațiile Variantelor de realizare 1-54.

Varianta de realizare A. Un compus cu Formula 1, în care

R^1 reprezintă C_1 - C_3 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^6 ;

15 fiecare R^2 reprezintă independent H, halogen, C_1 - C_6 haloalchil, C_1 - C_6 haloalcoxi sau -CN; iar fiecare R^3 reprezintă independent H, halogen, C_1 - C_6 alchil, C_1 - C_6 haloalchil, C_3 - C_6 cicloalchil, C_3 - C_6 halocicloalchil, C_1 - C_6 alcoxi, C_1 - C_6 haloalcoxi, -CN sau $-NO_2$.

Varianta de realizare B. Un compus al Variantei de realizare A, în care B^1 , B^2 și B^3 reprezintă independent CR^2 ;

W reprezintă O;

20 R^4 reprezintă H, C_1 - C_6 alchil, C_2 - C_7 alchilcarbonil sau C_2 - C_7 alcoxycarbonil; iar R^5 reprezintă H, $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 ; sau C_1 - C_4 alchil, C_2 - C_4 alchenil, C_2 - C_4 alchinil, C_3 - C_4 cicloalchil, C_4 - C_7 alchilcicloalchil sau C_4 - C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .

Varianta de realizare C. Un compus al Variantei de realizare B, în care

25 R^1 reprezintă C_1 - C_4 alchil substituit opțional cu halogen;

fiecare R^2 reprezintă independent H, CF_3 , OCF_3 , halogen sau -CN;

fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 haloalchil, C_3 - C_6 ciclopropil, C_1 - C_4 alcoxi sau -CN;

30 fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 alcoxi, C_1 - C_4 alchiltio, C_1 - C_4 alchilsulfinil, C_1 - C_4 alchilsulfonil, C_2 - C_4 alchilcarbonil, C_2 - C_4 alcoxycarbonil, C_2 - C_5 alchilaminocarbonil, C_2 - C_5 haloalchilcarbonil, C_2 - C_5 haloalcoxycarbonil, C_2 - C_5 haloalchilaminocarbonil, $-NH_2$, -CN sau $-NO_2$; sau Q^2 .

Varianta de realizare D. Un compus al Variantei de realizare C, în care:

R^4 reprezintă H;

35 R^5 reprezintă C_1 - C_4 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;

fiecare R^7 reprezintă independent halogen sau Q^2 ;

fiecare Q^2 reprezintă independent fenil, piridinil sau tiazolil.

Varianta de realizare E. A Un compus al Variantei de realizare D, în care:

40 R^1 reprezintă CF_3 ;

A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă fiecare CR^3 ;

B^2 reprezintă CR^2 ;

fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1 - C_4 alchil sau -CN.

Varianta de realizare F. Un compus al Variantei de realizare E, în care:

45 B^2 reprezintă CH;

fiecare R^2 reprezintă independent halogen sau C_1 - C_3 haloalchil;

R^3 reprezintă H;

R^5 reprezintă CH_2CF_3 sau CH_2 -2-piridinil;

n reprezintă 0.

50 Variante de realizare a invenției specifice includ compușii cu Formula 1 selectați din grupa constituită din:

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-

N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamidă,

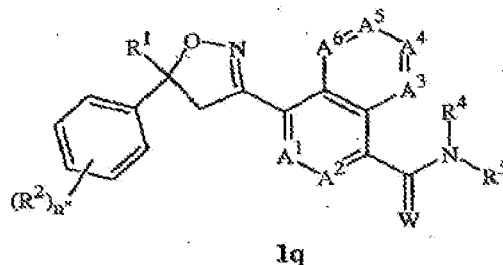
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-

55 N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidă,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-

N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarbotioamidă,

- 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-etil-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-metoxietil)-1-naftalencarboxamidă,
5 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-[2-(2,2,2-trifluoroetil)-2-oxoetil]-1-naftalencarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-chinolinăcarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-izochinolinăcarboxamidă,
10 1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-4-izochinolinăcarboxamidă.
De menționat că variantele specifice de realizare a invenției includ compuși cu
Formula 1 selectați din grupa constituită din:
15 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
20 N-(2-piridinilmetil)-8-1-naftalencarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-chinolinăcarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-izochinolinăcarboxamidă,
25 1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-4-izochinolinăcarboxamidă.
În continuare variantele specifice de realizare a invenției includ orice combinație a
compușilor cu Formula 1 selectați din grupa de mai sus.
Variantele de realizare a prezentei invenții.
30 Varianta de realizare AA. Un compus cu Formula 1q, un N-oxid, sau o sare a sa



în care

- A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ sunt selectați independent din grupa constituită din CR³ și N,
cu condiția că cel **mult** 3 din A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ reprezintă N;
35 W reprezintă O sau S;
R¹ reprezintă C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇
alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai
mulți substituenți selectați independent din R⁶;
fiecare R² reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₁-C₆
40 alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆
haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆
dialchilamino, C₂-C₄ alcocarbonil, -CN sau -NO₂;
fiecare R³ reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆
cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆
45 haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆
haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, -CN sau -NO₂;
R⁴ reprezintă H, C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇
alchilcicloalchil, C₄-C₇ cicloalchilalchil, C₂-C₇ alchilcarbonil sau C₂-C₇ alcocarbonil;

R^5 reprezintă H, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 ; sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;

5 sau R^4 și R^5 sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați din grupa constituită din C_1-C_2 alchil, halogen, -CN, -NO₂ și C_1-C_2 alcoxi;

fiecare R^6 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, -CN sau -NO₂;

10 fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_8 dialchilamino, C_3-C_6 cicloalchilamino, C_2-C_7 alchilcarbonil, C_2-C_7 alcocixarbonil, C_2-C_7 alchilaminocarbonil, C_3-C_9 dialchilaminocarbonil, C_2-C_7 haloalchilcarbonil, C_2-C_7 haloalcocixarbonil, C_2-C_7 haloalchilaminocarbonil, C_3-C_9 haloalchilaminocarbonil, hidroxi, -NH₂, -CN sau -NO₂;

15 sau Q^2 ;

fiecare R^8 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 haloalchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 haloalchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 haloalchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_6 dialchilamino, C_2-C_4 alcocixarbonil, -CN sau -NO₂;

20 fiecare R^9 reprezintă independent halogen, C_1-C_6 alchil, C_1-C_6 haloalchil, C_3-C_6 cicloalchil, C_3-C_6 halocicloalchil, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_1-C_6 alchiltio, C_1-C_6 haloalchiltio, C_1-C_6 alchilsulfinil, C_1-C_6 haloalchilsulfinil, C_1-C_6 alchilsulfonil, C_1-C_6 haloalchilsulfonil, C_1-C_6 alchilamino, C_2-C_6 dialchilamino, -CN, -NO₂, fenil sau piridinil;

25 R^{10} reprezintă H; sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți halogeni;

R^{11} reprezintă H, C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil, C_4-C_7 cicloalchilalchil, C_2-C_7 alchilcarbonil sau C_2-C_7 alcocixarbonil;

30 R^{12} reprezintă H; Q^3 ; sau C_1-C_6 alchil, C_2-C_6 alchenil, C_2-C_6 alchinil, C_3-C_6 cicloalchil, C_4-C_7 alchilcicloalchil sau C_4-C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;

35 sau R^{11} și R^{12} sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați independent din grupa constituită din C_1-C_2 alchil, halogen, -CN, -NO₂ și C_1-C_2 alcoxi;

Q^1 reprezintă un ciclu fenil, un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri sau un sistem biciclic condensat cu 8, 9 sau 10 membri ce conține opțional de la unu până la trei heteroatomi selectați din până la 1 O, până la 1 S și până la 3 N, fiecare ciclu sau sistem

40 ciclic substituiți opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^8 ;

fiecare Q^2 reprezintă independent un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 ;

45 Q^3 reprezintă un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^9 ; n reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5.

De menționat că compușii conform prezentei invenții se caracterizează prin caracterele reziduale favorabile ale metabolismului și/sau solului și manifestă activitate de combatere a unor dăunători nevertebrați agronomici și neagronomici.

50 În particular, e necesar de menționat că din motivele spectrului de combatere a dăunătorilor nevertebrați și importanței economice, protecția culturilor agricole de pagubele și prejudiciul cauzate de dăunătorii nevertebrați prin combaterea dăunătorilor nevertebrați reprezintă variante de realizare a prezentei invenții. Compușii conform prezentei invenții datorită proprietăților de translocare favorabile sau sistemicității în

55 plante de asemenea protejează partea foliară sau alte părți ale plantelor care nu intră în contact direct cu compusul cu Formula 1 sau cu o compoziție ce conține compusul.

De asemenea e necesar de menționat că variante de realizare a prezentei invenții sunt compozițiile ce conțin un compus conform oricărei Variante de realizare anterioare, precum și orice alte variante de realizare descrise aici, orice îmbinări ale lor și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un
 5 diluant solid și un diluant lichid, aceste compoziții mai conțin opțional cel puțin un compus sau agent biologic activ.

De asemenea e necesar de menționat că variante de realizare a prezentei invenții sunt compozițiile pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conțin o cantitate biologic efectivă de un compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente, precum și
 10 orice alte variante de realizare descrise aici, orice îmbinări ale lor și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid, aceste compoziții mai conțin opțional o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional. Variantele de realizare a prezentei invenții se mai referă la procedee de combatere a dăunătorilor nevertebrați
 15 care cuprind contactul dăunătorului nevertebrat sau a habitatului lui cu o cantitate biologic efectivă de un compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente (de exemplu compoziția descrisă aici).

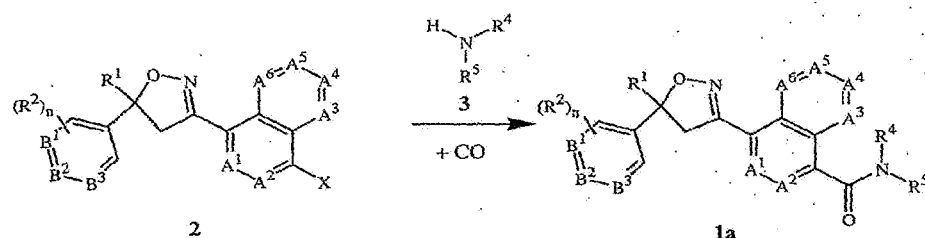
Variantele de realizare ale prezentei invenții de asemenea se referă la o compoziție ce conține un compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente aplicată prin
 20 impregnarea solului cu o soluție lichidă. Variantele de realizare a prezentei invenții de asemenea se referă la procedee de combatere a dăunătorilor care constau în contactul cu solul impregnat cu o compoziție lichidă ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente.

Variantele de realizare a prezentei invenții de asemenea se referă la o compoziție de
 25 pulverizare pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente și o substanță explozivă. Variantele de realizare a prezentei invenții se mai referă la o compoziție de momeală pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați ce conține o cantitate biologic efectivă de compus conform oricărei din Variantele de realizare precedente, una
 30 sau mai multe substanțe nutritive, opțional un atractant, și opțional un umectant. Variantele de realizare ale prezentei invenții se mai referă la un dispozitiv pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care conține compoziția de momeală menționată și un corp prevăzut pentru plasarea compoziției de momeală, în care corpul are cel puțin un orificiu executat de mărimea care să permită trecerea dăunătorilor nevertebrați prin el și
 35 accesul la compoziția de momeală menționată dintr-un loc aflat în afara corpului și în care corpul este suplimentar prevăzut să fie amplasat în sau aproape de locul activității posibile sau cunoscute a dăunătorilor nevertebrați.

Una sau mai multe din următoarele procedee sau diversități descrise în Schemele 1-12 pot fi folosite pentru prepararea compușilor cu Formula 1. Definițiile pentru R^1 , R^2 , R^4 ,
 40 R^5 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , A^6 , B^1 , B^2 , B^3 , n și W în compușii cu Formulele 1-15 de mai jos sunt cele prezentate mai sus în Esența Invenției, cu excepția cazului când se indică altfel. Compuși cu Formulele **1a** și **1b** sunt subgrupe ale compușilor cu Formula **1**, compuși cu Formulele **12a** – **12c** sunt subgrupe ale compușilor cu Formula **12**, și compusul cu Formula **15a** este subgrupă a compusului cu Formula **15**.

45 Compușii cu Formula **1a** (Formula **1** în care W reprezintă O) pot fi preparați prin aminocarbonilare a bromurilor sau iodurilor de aril cu Formula 2, în care X reprezintă Br sau I , cu amino compuși substituiți în mod corespunzător cu Formula 3 după cum este arătat în Schema 1.

Schema 1



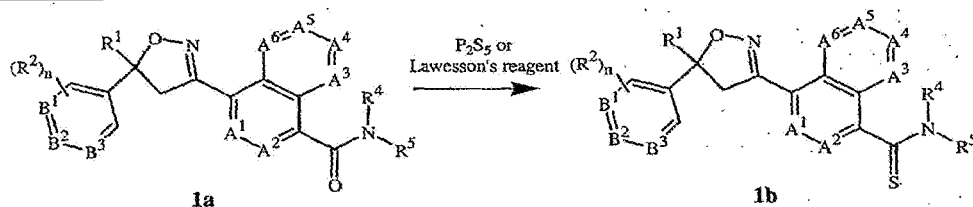
5 X reprezintă halogenuri

Această reacție de obicei este realizată cu o bromură de aril cu Formula 2, în care X reprezintă Br în prezența catalizatorului de paladiu sub atmosferă CO. Catalizatorul de paladiu folosit pentru prezentul procedeu de obicei conține paladiu în stare de oxidare formală fie de 0 (ex. Pd(O)) sau 2 (ex. Pd(II)). O mare varietate de compuși și combinații complexe cu conținut de paladiu sunt utili în calitate de catalizatori pentru prezentul procedeu. Exemple de compuși și combinații complexe cu conținut de paladiu utili în calitate de catalizatori în procedeu cu Schema 1 includ PdCl₂(PPh₃)₂ (bis(trifenilfosfină)paladiu (II) biclorură), Pd(PPh₃)₄ (tetrakis(trifenilfosfină)paladiu(0)), Pd(C₅H₇O₂)₂ (palladium(II) acetil-acetonat), Pd₂(dba)₃ (tris(dibenzilidenacetonă)dipaladiu(0)), și [1,1'-bis(difenilfosfino)ferocen]dicloropaladiu(II). Procedeu cu Schema 1 în general se realizează în fază lichidă, de aceea pentru a fi mai efectivă catalizatorul de paladiu de preferință are o solubilitate bună în fază lichidă. Solvenții utili includ, de exemplu, eteri, cum ar fi 1,2-dimetoxietan, amide, cum ar fi N,N-dimetilacetamida, și hidrocarburi aromatice nehalogenate, cum ar fi toluen.

Procedeu cu Schema 1 poate fi realizat la o mare varietate de temperaturi, cuprinse între de la aproximativ 25 până la aproximativ 150 °C. De menționat sunt temperaturile de la aproximativ 60 și aproximativ 110 °C, care de obicei asigură viteze de reacție rapide și randamente ale produselor sporite. Metodele și procedeele generale de aminocarbonilare cu o bromură de aril și o amină sunt bine cunoscute din literatură; vezi, de exemplu, H. Honno și alții, *Synthesis* **1989**, 715; și J. J. Li, G. W. Gribble, editori, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, **2000**. Procedeu cu Schema 1 este ilustrat în Pasul C al Exemplului 2 și Pasul E al Exemplului 4.

După cum este arătat în Schema 2, compușii cu Formula 1b (Formula 1 în care W reprezintă S) pot fi preparați prin tratarea compușilor corespunzători de amide cu Formula 1a cu un reactiv de tio transfer, cum ar fi P₂S₅ (vezi, de exemplu, E. Klingsberg și alții, *J. Am. Chem. Soc.* **1951**, 72, 4988; E. C. Taylor Jr. și alții, *J. Am. Chem. Soc.* **1953**, 75, 1904; R. Crossley și alții, *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1* **1976**, 977) sau reactivul lui Lawesson (2,5-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetan-2,4-disulfid; vezi, de exemplu, S. Prabhakar și alții *Synthesis*, **1984**, 829).

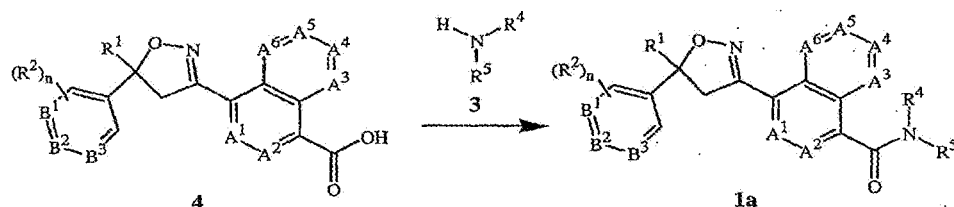
Schema 2



40 Procedeu cu Schema 2 poate fi realizat la o mare varietate de temperaturi, inclusiv de la aproximativ 50 până la aproximativ 150 °C. De menționat sunt temperaturile de la aproximativ 70 și aproximativ 120 °C, care de obicei asigură viteze de reacție rapide și randamente ale produselor sporite. Procedeu cu Schema 2 este ilustrat în Exemplul 3.

Compuși cu Formula **1a** pot fi de asemenea preparați prin cuplarea acizilor carboxilici cu **4** cu compuși amino cu Formula **3** substituiți în modul corespunzător după cum este arătat în Schema 3.

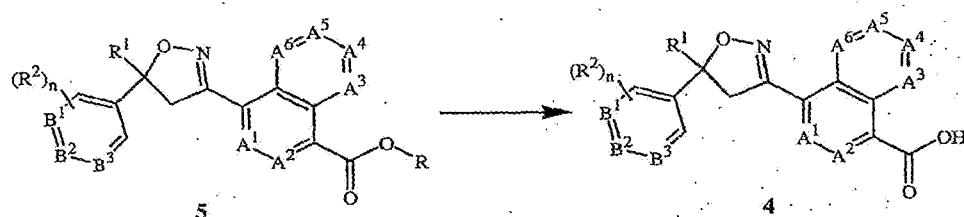
5 Schema 3



Această reacție în general este realizată în prezența unui reactiv de cuplare deshidratant, cum ar fi dicitohexil carbodiimidă, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimidă, anhidridă 1-propanfosfonică ciclică acidă sau carbonil diimidazol în prezența unei baze cum ar fi trietilamină, piridină, 4-(dimetilamino)piridină sau *N,N*-diizopropiletilamină într-un solvent aprotic anhidru, cum ar fi diclorometan sau tetrahydrofuran la temperaturi de obicei cuprinse între temperatura camerei și 70 °C. Procedul cu Schema 3 este ilustrat în Pasul E al Exemplului 1.

Compuși cu Formula **4** pot fi preparați prin hidroliza esterului cu Formula **5**, în care R reprezintă metil sau etil, după cum este arătat în Schema 4.

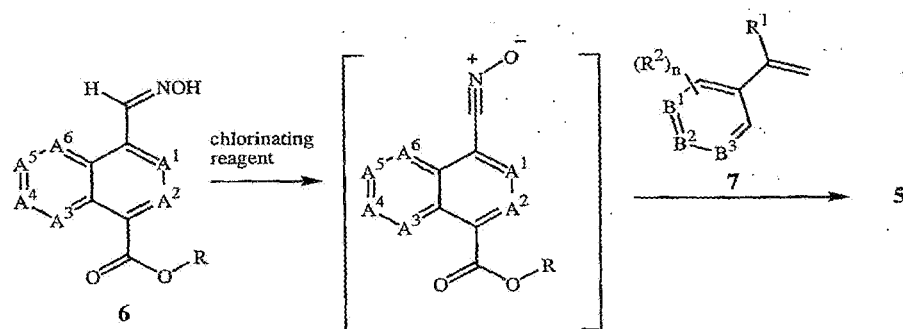
Schema 4



În acest procedeu compusul ester cu Formula **5** este convertit în acid carboxilic corespunzător cu Formula **4** prin procedee bine cunoscute în acest domeniu. De exemplu, tratarea esterului de metil sau etil cu Formula **5** cu soluție apoasă de hidroxid de litiu în tetrahydrofuran, urmat de acidificare generează acidul carboxilic corespunzător cu Formula **4**. Procedul cu Schema 4 este ilustrat în Pasul D al Exemplului 1.

Compuși cu Formula **5** pot fi preparați prin cicloadiție 1,3-dipolară a stirenilor cu Formula **7** cu nitril oxizi derivați din oxime cu Formula **6**, după cum este arătat în Schema 5.

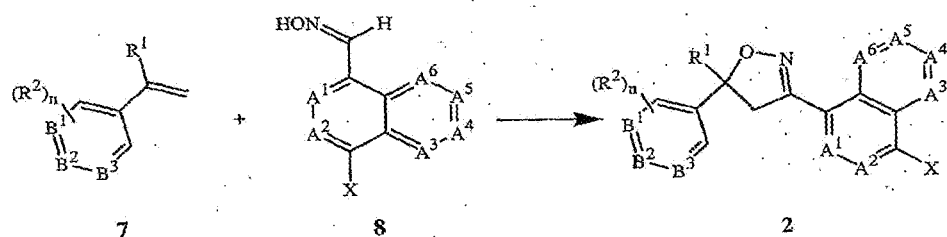
Schema 5



Această reacție de obicei are loc prin intermediul clorurii de hidroxamil generată *in situ*, care este dehidroclorurată în nitril oxid, care apoi este supusă cicloadiției 1,3-dipolare cu stireni **7** pentru obținerea compușilor cu Formula **5**. Într-un procedeu tipic, reactivul de clorurare, cum ar fi hipoclorura de sodiu, *N*-clorosuccinimida, sau cloramina-

- T este combinat cu oximă în prezența stirenului. În dependență de condiții, bazele aminice, cum ar fi piridina sau trietilamina, pot fi necesare pentru a facilita reacția de dehidroclorurare. Reacția poate fi realizată într-o mare varietate de solvenți, inclusiv în tetrahidrofuran, dietil eter, clorură de metilenă, dioxan și toluen cu temperaturi cuprinse între temperatura camerei până la temperatura de reflux a solventului. Procedeele generale de cicloadiție a nitril oxizilor cu olefine sunt bine documentate în literatura chimică ; de exemplu, vezi Lee, *Synthesis*, **1982**, 6, 508-509; Kanemasa și alții, *Tetrahedron*, **2000**, 56, 1057-1064; EP 1,538,138-A1, precum și referințele citate în acestea. Procedul cu Schema 4 este ilustrat în Pasul C al Exemplului 1.
- Compușii cu Formula 2 pot fi de asemenea preparați prin cicloadiție 1,3-dipolară a stirenilor cu Formula 7 cu nitril oxizi derivați din oxime cu Formula 8, după cum este arătat în Schema 6.

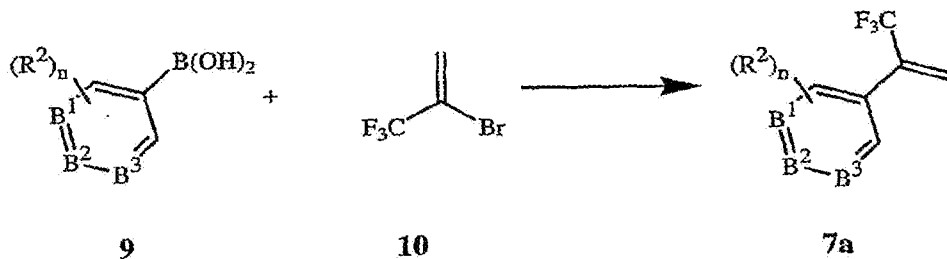
Schema 6



- În procedeul cu Schema 6, compușii cu Formula 2 în care X este atom de halogen sunt obținuți prin contactul compusului cu Formula 8 cu un reactiv de clorurare urmat de adăugarea compusului cu Formula 7. Procedeul cu Schema 6 este realizat în mod similar procedurii cu Schema 5 descris anterior. Procedeul cu Schema 6 este ilustrat în Pasul B al Exemplului 2, Pasul D al Exemplului 4 și Pasul C al Exemplului 5.

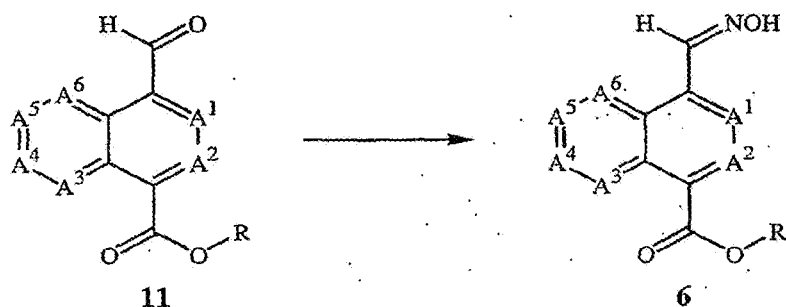
- O grupă de stireni îndeosebi de utilă pentru sinteza compușilor cu Formula 1 este reprezentată de Formula 7a, după cum este arătat în Schema 7. Acești intermediari pot fi preparați prin cuplare catalizată de paladiu a acizilor aril borici cu Formula 9 cu 2-bromo-3,3,3-trifluoropropilenă disponibilă în vânzare (Formula 10). Procedeele generale pentru această reacție sunt documentate în literatura chimică; vezi Pan și alții, *J. Fluorine Chemistry*, **1999**, 95, 167-170. Procedeul cu Schema 7 este ilustrat în Pasul B al Exemplului 1.

Schema 7



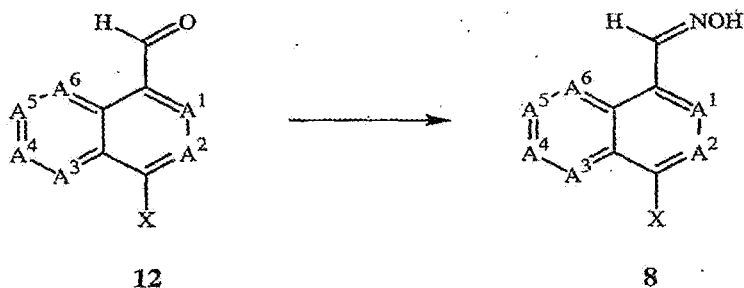
- Oximele cu Formula 6 pot fi preparate prin reacția aldehydelor 11 cu hidroxilamină după cum este arătat în Schema 8. De exemplu, vezi H. K. Jung și alții, *Bioorg. Med. Chem.* **2004**, 12, 3965.
- Aldehydele cu Formula 11 pot fi preparate printr-o varietate mare de procedee cunoscute în acest domeniu; unele aldehyde sunt compuși cunoscuți sau disponibili în vânzare. De exemplu, prepararea compusului cu Formula 11, în care A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă CH și R^9 reprezintă Me, este dezvăluită de către P. Madenson și alții, *J. Med. Chem.* **2002**, 45, 5755. Procedeul cu Schema 8 este ilustrat în Pasul A al Exemplului 1.

Schema 8



- 5 După cum este arătat în Schema 9, oximele cu Formula 8, în care X reprezintă un atom de halogen, pot fi preparate din aldehyde corespunzătoare cu Formula 12 în mod similar cu procedeul din Schema 8. Procedeul cu Schema 9 este ilustrat în Pasul A al Exemplului 2, Pasul C al Exemplului 4 și Pasul B al Exemplului 5.

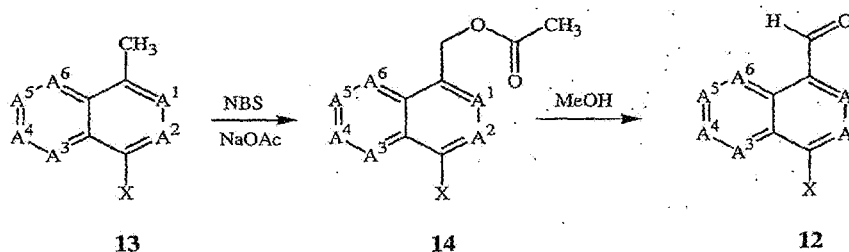
10 Schema 9



- Compușii cu Formula 12 sunt compuși disponibili în vânzare sau cunoscuți, sau pot fi preparați printr-o varietate mare de procedee cunoscute în domeniu. De exemplu, un compus cu Formula 12 poate fi preparat prin formilarea directă a halogenurilor corespunzătoare, vezi G. E. Boswell și alții, *J. Org. Chem.* **1995**, 65, 6592; sau prin reducerea aril esterilor corespunzători, vezi referințele P. R. Bernstein și alții, *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2001**, 2769 și L. W. Deady și alții, *Aust. J. Chem.* **1989**, 42, 1029.

- Pentru un exemplu specific, după cum este arătat în Schema 10, aldehydele cu Formula 12 pot fi preparate din compușii corespunzători substituiți cu metil cu Formula 13 (în care X reprezintă halogen) prin reacția cu *N*-bromosuccinimidă (NBS) în prezența 2,2'-azobis(2- metilpropionitril) (AIBN) și acetat de sodiu pentru a primi acetati cu Formula 14, care apoi sunt convertiți în aldehyde cu Formula 12 prin esterificare și oxidare. Procedeul cu Schema 10 este ilustrat în Exemplul 4, Pașii A și B.

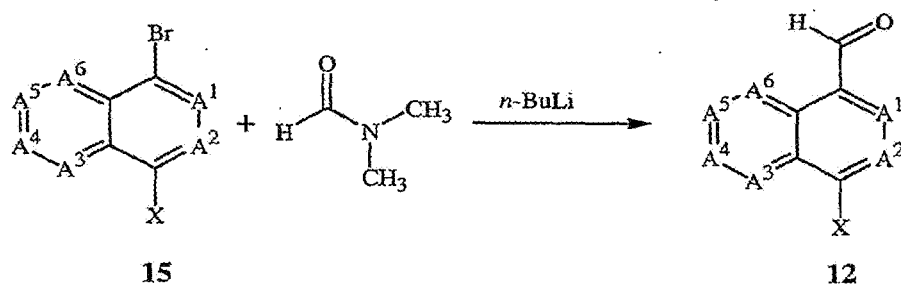
25 Schema 10



- Compușii cu Formula 13 sunt compuși cunoscuți disponibili în vânzare, sau pot fi preparați printr-o varietate mare de procedee cunoscute în domeniu. De exemplu, un compus cu Formula 13, unde A³ reprezintă N, A¹, A², A⁴, A⁵ și A⁶ reprezintă CH, poate fi preparat conform dezvoltării din *Molecules*, **2004**, 9, 178.

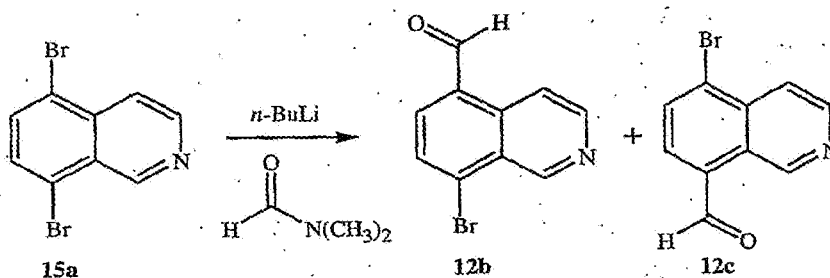
- Un procedeu alternativ de preparare a alchidelor cu Formula **12** (în care X reprezintă atom de halogen) este arătat în Schema 11. Grupa formil cu Formula **12** poate fi introdusă în sistemul ciclic aromatic cu 10 membri prin înlocuirea brom substituentului al compusului cu Formula **15**. Pentru referințe la acest procedeu general vezi *Synthesis*, **2006**, 293 și *Bioorg. Med. Chem.* **2004**, 12, 715. Procedul cu Schema 11 este ilustrat în Pasul A al Exemplului 5.

Schema 11



- După cum este arătat în Schema 12, alchidele cu Formulele **12b** și **12c** pot fi preparate din 5,8-dibromoizochinolină (Formula **15a**) prin tratarea compusului cu Formula **15a** cu *n*-BuLi la -78 °C și stingerea cu *N,N*-dimetilformamidă.

Schema 12



- Compusul cu Formula **15a** poate fi preparat prin procedul dezvăluit în *Synthesis*, **2002**, 83; vezi, de exemplu, sau prin procedul lui G. E. Boswell și alții, *J. Org. Chem.* **1995**, 65, 6592. Ca alternativă aril alchidele cu Formula **12** pot fi preparate printr-o mare varietate de procedee cunoscute în domeniu, de exemplu prin reducerea aril esterilor corespunzători, vezi referințele P. R. Bernstein și alții, *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2001**, 2769 și L. W. Deady și alții, *Aust. J. Chem.* **1989**, 42, 1029.

- Se cunoaște că unii reactivi în condițiile reacției descrise mai sus pentru prepararea compușilor cu Formula **1** pot să nu fie compatibili cu anumite funcționalități prezente în intermediari. În aceste cazuri, încorporarea secvențelor de protecție/deprotecție sau a interconversiilor grupei funcționale în sinteză va ajuta la obținerea produselor dorite. Utilizarea și alegerea grupelor de protecție vor fi aparente pentru un specialist în domeniul sintezei chimice (vezi, de exemplu, T. W. Greene și P. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Sythesis*, ed. a 2-a; Wiley: New York, 1991). Un specialist în domeniu va recunoaște că, în unele cazuri, după introducerea unui reactiv dat, așa cum este descris în fiecare schemă individuală, poate fi necesară efectuarea pașilor sintetici reguțați adiționali, nedescrși detaliat, pentru a completa sinteza compușilor cu Formula **1**. Un specialist în domeniu va recunoaște de asemenea că poate fi necesară combinarea pașilor ilustrați în schemele de mai sus într-o ordine diferită de cea sugerată de secvența particulară prezentată pentru prepararea compușilor cu Formula **1**.

- Un specialist în domeniu va recunoaște de asemenea că compușii cu Formula **1** și intermediarii descrși în prezenta invenție pot fi supuși diverselor reacții electrolilice, nucleofilice, prin radicali liberi, organometalice, de oxidare și de reducere pentru adăugarea substituenților sau modificarea substituenților existenți.

Fără elaborare suplimentară se consideră că un specialist în domeniu, folosind descrierea precedentă, poate realiza prezenta invenție în întregime. Exemplele ce urmează trebuie, prin urmare, să fie interpretate pur și simplu ca ilustrative, și nici într-un caz să nu limiteze descrierea.

- 5 Spectrele ^1H RMN sunt raportate în ppm față de tetrametilsilan; „s” înseamnă singlet, „d” înseamnă dublet, „t” înseamnă triplet, „m” înseamnă „multiplet”, „dd” înseamnă dublet de dubleți, iar „br s” înseamnă singlet larg.

EXEMPLUL 1

- 10 Prepararea 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamidei

Pasul A: Prepararea metil 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalencarboxilatului

- 15 La o soluție agitată de metil 4-formil-1-naftalencarboxilat (2.2 g, 10.3 mmol) în metanol (50 mL) s-a adăugat o soluție de hidroxilamină (1.33 mL, 50% în apă). După agitare la temperatura camerei timp de 2 ore, amestecul reactant a fost concentrat sub presiune redusă pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de o substanță solidă galbenă pală (2.55 g).

^1H RMN (CDCl_3): 8.93 (d, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.63 (m, 2H), 4.02 (s, 3H).

Pasul B: Prepararea 1,3-dicloro-5-[1-(trimetilfluorometil)etenil]benzenului

- 20 La un amestec de tetrahidrofuran (33 mL), 1,2-dimetoxietan (33 mL) și soluție apoasă de 4 N hidroxid de potasiu (33 mL) într-un tub astupat Fisher-Porter de 200 mL s-a adăugat acid 3,5- diclorofenilboronic (8.72 g, 45.7 mmol) și 2-bromo-3,3,3-trifluoropropilenă (10.0 g, 57.2 mmol), după s-a adăugat etrakis(trifenilfosfină)paladiu (0) (264 mg, 0.229 mmol). Apoi amestecul a fost încălzit până la 75 °C timp de 3 ore.
- 25 Amestecul reactant a fost împărțit între dietil eter și apă. Extractul apos a fost spălat cu dietil eter (2 x 20 mL). Extractele organice au fost combinate, uscate (MgSO_4), și concentrate sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografiere cu silicagel folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de ulei pur (4.421 g).

- 30 ^1H RMN (CDCl_3): δ 7.41 (s, 2H), 7.33 (s, 1H), 6.04 (d, 1H), 5.82 (d, 1H).

Pasul C: Prepararea metil 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-1-naftalencarboxilatului

- 35 La o soluție agitată de metil 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalencarboxilat (în special produsul din Pasul A) (1.0 g, 4.36 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (5.0 mL) s-a adăugat *N*-clorosuccinimidă (1.16 g, 8.72 mmol). Amestecul a fost agitat timp de 1.5 ore la temperatura camerei, apoi s-a adăugat soluția de 1,3-dicloro-5-[1-(trimetilfluorometil)etenil]benzen (în special produsul din Pasul B) (3.20 g, 13.1 mmol) și trietilamină (6.1 mL, 43.6 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (4.0 mL). După agitare suplimentară timp de 2 ore la temperatura camerei, amestecul reactant a fost diluat cu apă și extras cu etil acetat. Stratul organic a fost spălat cu soluție de sare, uscat (Na_2SO_4) și concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografie cu silicagel folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de ulei galben pal (700 mg, 34% randament).

- 45 ^1H RMN (CDCl_3): 8.88 (d, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 7.68 (m, 2H), 7.55 (m, 3H), 7.46 (dd, 1H), 4.27 (d, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.91 (d, 1H).

Pasul D: Prepararea acidului 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-1-naftalencarboxilic

- 50 La o soluție agitată de metil 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-1-naftalencarboxilat (în special produsul din Pasul C) (650 mg, 1.39 mmol) în tetrahidrofuran (10 mL) s-a adăugat o soluție de hidroxid de litiu monohidrat (350 mg, 8.34 mmol) în apă (10 mL), urmat de metanol (10 mL). Amestecul rezultat a fost agitat timp de o noapte la temperatura camerei. Amestecul reactant a fost separat între apă și dietil eter. Apoi stratul apos a fost acidificat cu soluție apoasă de 6 N acid hidroclicoric până la pH 2 și extras cu etil acetat. Straturile organice combinate au fost spălate cu soluție de sare, uscate și concentrate pentru a obține compusul cu titlul sus-numit sub formă de substanță solidă albă (450 mg).

^1H NMR (CDCl_3): 9.08 (d, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.31 (d, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.57 (m, 3H), 7.46 (dd, 1H), 4.28 (d, 1H), 3.91 (d, 1H).

Pasul E: Prepararea 4[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamidei

5 Un amestec de acid 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-1-naftalencarboxilic (în special produsul din Pasul C) (190 mg, 0.42 mmol), 4-(dimetilamino)piridină (77 mg, 0.63 mmol), anhidridă propilfosfonică (0.38 mL, 0.63 mmol, 50% în etil acetat) și 2,2,2-trifluoroetilamină (0.033 mL, 0.42 mL) în diclorometan (5 mL) a fost agitat la temperatura camerei timp de o noapte. Amestecul reactant și
10 reziduul au fost purificate prin cromatografie pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă albă (71 mg).

^1H RMN (CDCl_3): 8.78 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.63 (m, 2H), 7.56 (m, 2H), 7.52 (d, 1H), 7.46 (m, 1H), 7.44 (d, 1H), 6.41 (t, 1H), 4.23 (d, 1H), 4.20 (m, 2H), 3.87 (d, 1H).

15 EXEMPLUL 2

Prepararea 4[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidei

Pasul A: Prepararea 4-bromo-1-naftalencarboxilat oximei

20 La o soluție agitată de 4-bromo-1-naftalencarboxilat (3.7 g, 15.7 mmol) în etanol (50 mL) s-a adăugat o soluție apoasă de hidroxilamină (1.25 mL, 50% în apă). După agitare la temperatura camerei timp de 3 ore, amestecul reactant a fost concentrat sub presiune redusă pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de o substanță solidă galbenă pală (3.8 g).

25 ^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$): 11.60 (s, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.74 (m, 3H).

Pasul B: Prepararea 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)izoxazolului

30 La o soluție agitată de 4-bromo-1-naftalencarboxilat oximă (în special produsul din Pasul A) (2.33 g, 9.3 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (6.0 mL) s-a adăugat *N*-clorosuccinimidă (1.70 g, 12.7 mmol). Amestecul reactant a fost agitat timp de 1 oră la temperatura camerei, iar apoi s-au adăugat o soluție de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzen (în special produsul din Pasul B al Exemplului 1) (2.70 g, 11.2 mmol) și trietilamină (4.5 mL, 32.0 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (9.0 mL). După agitare suplimentară timp de 2 ore la temperatura camerei, amestecul reactant a fost diluat
35 cu apă și extras cu etil acetat. Stratul organic a fost spălat cu soluție de sare, uscat (Na_2SO_4) și concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografie pe coloană cu silicagel folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă albă (2.9 g, 64% randament).

40 ^1H RMN (CDCl_3): 8.87 (m, 1H), 8.32 (m, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.55 (s, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.88 (d, 3H).

Pasul C: Prepararea 4[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidei

45 Un amestec de 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)izoxazol (în special produsul din Pasul B) (1.0 g, 2.04 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferocen]dicloropaladiu (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (0.22 g, 0.30 mmol), 2-(aminometil)piridină (0.86 g, 7.96 mmol) și trietilamină (5.6 mL, 40 mmol) în toluen (15 mL) a fost purificat cu monoxid de carbon timp de 15 minute. Apoi eprubeta pentru reacție a fost menținută cu monoxid de carbon folosind un balon. Amestecul reactant a
50 fost agitat la 70 °C sub atmosferă de monoxid de carbon timp de o noapte. Amestecul a fost răcit până la temperatura camerei, filtrat printr-un garnitură de filtrare ce conține material auxiliar de filtrare diatomic Celite® și spălat cu o cantitate mică de etil acetat. Filtratul a fost concentrat, iar reziduul a fost purificat prin cromatografie pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul
55 sus-menționat, compusul conform prezentei invenții, sub formă de substanță solidă albă (0.72 g, 65% randament).

^1H RMN (CDCl_3): 8.81 (d, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.38 (d, 1H), 7.80-7.27 (m, 10H), 4.89 (d, 2H), 4.22 (d, 1H), 3.86 (d, 1H).

EXEMPLUL 3

5 Prepararea 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidelor

Un amestec de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidă (în special produsul din Exemplul 2) (40 mg, 0.073 mmol) și 2,5-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditiazol-2,4-difosfetan-2,4-disulfid (reactivul lui Lawesson) (18 mg, 0.044 mmol) în toluen (2 mL) a fost încălzit la reflux timp de 2 ore. Amestecul reactant a fost răcit până la temperatura camerei și purificat direct prin cromatografie pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat, compusul conform prezentei invenții, sub formă de substanță solidă galbenă (29 mg, 71% randament).

15 ^1H RMN (CDCl_3): 9.41 (br s 1H), 8.91 (dd, 1H), 8.70 (dd, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.75 (dt, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.57 (s, 2H), 7.47 (dd, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 5.14 (d, 2H), 4.68 (d, 1H), 4.39 (d, 1H).

EXEMPLUL 4

20 Prepararea 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-8-chinolincarboxamidelor

Pasul A: Prepararea (8-bromo-5-chinolilmetil) acetatului

Un amestec de 8-bromo-5-metilchinolină (5.4 g, 24.3 mmol), N-bromosuccinimidă (5.2 g, 29.2 mmol) și 2,2'-azobis(2-metilpropionitril) (AIBN) (0.40 g, 24.3 mmol) în tetraclorură de carbon (80 mL) a fost încălzit la reflux timp de 3 ore sub atmosferă de azot. Amestecul reactant a fost răcit până la temperatura camerei și filtrat, folosind hexanul pentru spălare. Filtratul a fost concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost dizolvat în N,N-dimetilformamidă (50 mL), apoi s-a adăugat acetatul de sodiu (4.0 g, 48.8 mmol). Amestecul obținut a fost agitat la 100 °C timp de 2 ore sub atmosferă de azot. Amestecul reactant a fost răcit până la temperatura camerei, diluat cu apă și extras cu un amestec de etil acetat și hexan (3:7). Stratul organic a fost spălat cu soluție de sare, uscat (Na_2SO_4) și concentrat sub presiune redusă. Produsul brut a fost purificat prin cromatografie pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă galbenă pală (4.8 g).

35 Pasul B: Prepararea 8-bromo-5-chinolincarboxaldehidei

Un amestec de (8-bromo-5-chinolilmetil) acetat (în special produsul din Pasul A) și metanol (50 mL) a fost încălzit la reflux timp de 1 oră în prezența unei cantități infime de carbonat de potasiu (10 mg). Apoi amestecul reactant a fost răcit până la temperatura camerei și concentrat sub presiune redusă pentru a produce alcoolul respectiv cu randament cantitativ sub formă de substanță solidă galbenă pală.

40 La o soluție agitată de alcool brut (2.0 g, 8.3 mmol) în diclorometan (60 mL) s-a adăugat încet 1,1,1-tris(acetoxi)-1,1-dihidro-1,2-benziodoxol-3(1H)-unu (periodinan Dess-Martin) (4.0 g, 9.4 mmol) la temperatura camerei. După agitare timp de 0.5 ore, amestecul reactant a fost diluat cu diclorometan, spălat cu soluție apoasă saturată de bicarbonat de sodiu și soluție de sare, uscat (Na_2SO_4) și concentrat sub presiune redusă. Produsul brut a fost purificat prin cromatografie pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă albă (1.8 g).

50 ^1H RMN (CDCl_3): 10.31 (s, 1H), 9.65 (dd, 1H), 9.12 (dd, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.66 (dd, 1H).

Pasul C: Prepararea oximei de 8-bromo-5-chinolincarboxaldehidă

55 La o soluție agitată de 8-bromo-5-chinolincarboxaldehidă (în special produsul din Pasul B) (1.7 g, 7.1 mmol) în etanol (30 mL) s-a adăugat o soluție apoasă de hidroxilamină (0.7 mL, 50% în apă). După agitare la temperatura camerei timp de 2 ore, amestecul reactant a fost concentrat sub presiune redusă pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă galbenă pală (1.8 g).

¹H RMN (DMSO-*d*₆): 11.61 (s, 1H), 9.16 (dd, 1H), 9.07 (dd, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.72 (dd, 1H).

Pasul D: Prepararea 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]chinolinei

5 La o soluție agitată de oximă de 8-bromo-5-chinolinocarboxaldehidă (în special produsul din Pasul C) (1.7 g, 6.8 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (13.0 mL) s-a adăugat *N*-clorosuccinimidă (1.24 g, 9.3 mmol). Amestecul reactant a fost agitat timp de 1 oră la temperatura camerei, apoi s-a adăugat o soluție de 1,3-dicloro-5-[1-(trimetilfluorometil)etenil]benzen (în special produsul din Exemplul 1, Pasul B) (1.96 g, 8.1 mmol) și trietilamină (2.86 mL, 20.4 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (7.0 mL). După
10 agitare suplimentară timp de 12 ore la temperatura camerei, amestecul reactant a fost diluat cu apă și extras cu etil acetat. Stratul organic a fost spălat cu soluție de sare, uscat (Na₂SO₄) și concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografiere pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă albă (2.0 g, 61% randament).

¹H RMN (CDCl₃): 9.39 (dd, 1H), 9.08 (dd, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.59 (dd, 1H), 7.55 (s, 2H), 7.44 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 4.27 (d, 1H), 3.92 (d, 1H).

Pasul E: Prepararea 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8- chinolincarboxamidei

20 Un amestec de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]chinolină (în special produsul din Pasul D) (500 mg, 1.0 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferocen]dicloropaladiu (II) (PdCl₂(dppf)) (75 mg, 0.10 mmol), 2-(aminometil)piridină (0.43 mL, 4.0 mmol) și trietilamină (2.8 mL, 20 mmol) în toluen (10 mL) a fost purificat cu monoxid de carbon timp de 15 minute. Apoi eprubeta pentru reacție a fost menținută cu monoxid de carbon folosind un balon. Amestecul reactant a fost agitat la 70 °C sub atmosferă de monoxid de carbon timp de o noapte. Amestecul a fost răcit până la temperatura camerei, filtrat printr-un garnitură de filtrare ce conține material auxiliar de filtrare diatomic Celite® și spălat cu o cantitate mică de etil acetat.
25 Filtratul a fost concentrat, iar reziduul a fost purificat prin cromatografiere pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat, compusul conform prezentei invenții, sub formă de o substanță solidă poroasă cafenie (60 mg, 11% randament).

¹H RMN (CDCl₃): 12.02 (br s 1H), 9.52 (d, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.88 (d, 1H), 8.62 (d, 1H), 7.60-7.74 (m, 3H), 7.56 (s, 2H), 7.45 (br s 2H), 7.20 (dd, 1H), 4.96 (d, 2H), 4.32 (d, 1H), 3.98 (d, 1H).

EXEMPLUL 5

Prepararea 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8- izochinolincarboxamidei

40 Pasul A: Prepararea 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidei și 5-bromo-8-izochinolincarboxaldehidei

La un amestec agitat de 5,8-dibromoizochinolină (4.0 g, 13.9 mmol) în tetrahidrofuran (120 mL) la -78 °C sub atmosferă de azot s-a adăugat picătură cu picătură soluție de *n*-butilitiu (2.3 M în hexan, 7.3 mL, 16.8 mmol). Amestecul reactant s-a întunecat. După
45 agitare timp de 15 minute, amestecul reactant a fost stins prin adăugarea *N,N*-dimetilformamidei (4.0 mL). După agitare suplimentară la -78 °C timp de 1 oră, amestecul reactant a fost stins cu apă, extras cu amestec de etil acetat/hexan (2:8), spălat cu apă și soluție de sare, uscat (Na₂SO₄) și concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografiere pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidă (0.10 g), urmată de 5-bromo-8- izochinolincarboxaldehidă (1.0 g) sub formă de substanță solidă albă.

¹H RMN (CDCl₃) 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidă: 10.36 (s, 1H), 9.72 (s, 1H), 9.00 (d, 1H), 8.79 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.01 (dd, 1H); și

¹H RMN (CDCl₃) 5-bromo-8- izochinolincarboxaldehidă: 10.57 (s, 1H), 10.41 (s, 1H),
55 8.81 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.11 (d, 1H), 7.94 (d, 1H).

Pasul B: Prepararea oximei de 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidă

La o soluție agitată de 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidă (în special produsul din Pasul A) (75 mg, 0.3 mmol) în etanol (7 mL) s-a adăugat o soluție apoasă de hidroxil amină (0.5 mL, 50% în apă). După agitare la temperatura camerei timp de o noapte, amestecul reactant a fost concentrat sub presiune redusă pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat sub formă de substanță solidă galbenă (70 mg).

^1H NMR (DMSO- d_6): 11.75 (s, 1H), 9.55 (s, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.96 (d, 1H).

10 Pasul C: Prepararea 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolinizochinolinei

La o soluție agitată de oximă de 8-bromo-5-izochinolincarboxaldehidă (în special produsul din Pasul B) (70 mg, 0.28 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (2.0 mL) s-a adăugat *N*-clorosuccinimidă (64 g, 0.48 mmol). Amestecul reactant a fost agitat timp de 0.5 ore la temperatura camerei, apoi s-a adăugat soluția de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benzen (135 mg, 0.56 mmol) (în special produsul din Exemplul 1, Pasul B) și trietilamină (0.12 mL, 0.86 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (1.5 mL). După agitare suplimentară timp de 12 ore la temperatura camerei, amestecul reactant a fost diluat cu apă și extras cu etil acetat. Stratul organic a fost spălat cu soluție de sare, uscat (Na_2SO_4) și concentrat sub presiune redusă. Reziduul a fost purificat prin cromatografiere pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține compusul cu titlul sus-menționat (20 mg) conținând unele impurități.

20 Pasul D: Prepararea 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolidin]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-izochinolincarboxamidei

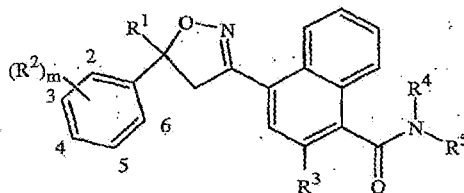
Un amestec de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolinizochinolînă (în special produsul din Pasul C) (20 mg, 0.04 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferocen]dicloropaladiu (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (6 mg, 0.008 mmol), 2-(aminometil)piridină (17 mg, 0.16 mmol) și trietilamină (0.1 mL, 0.7 mmol) în toluen (2 mL) a fost purificat cu monoxid de carbon timp de 15 minute. Apoi eprubeta pentru reacție a fost menținută cu monoxid de carbon folosind un balon. Amestecul reactant a fost agitat la 70 $^\circ\text{C}$ sub atmosferă de monoxid de carbon timp de o noapte. Amestecul a fost răcit până la temperatura camerei, filtrat printr-un garnitură de filtrare ce conține material auxiliar de filtrare diatomic Celite[®] și spălat cu o cantitate mică de etil acetat. Filtratul a fost concentrat, iar reziduul a fost purificat prin cromatografiere pe coloană cu silicagel, folosind hexani/etil acetat în calitate de eluant pentru a obține produsul cu titlul sus-menționat, compusul conform prezentei invenții, sub formă de o substanță solidă albă pală (15 mg).

^1H RMN (CDCl_3): 9.77 (s, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.81-7.23 (m, 9H), 4.88 (d, 2H), 4.28 (d, 1H), 3.92 (d, 1H).

40 Prin procedeele descrise în prezenta invenție împreună cu procedeele cunoscute în domeniu, pot fi preparați următorii compuși din Tabelele 1-9. În Tabele sunt folosite următoarele abrevieri, după cum urmează: -CN semnifică ciano, Ph semnifică fenil, Py semnifică piridinil, Me semnifică metil, Et semnifică etil și *i*-Pr semnifică izopropil.

45

Tabelul 1



în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

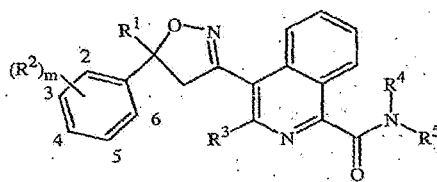
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_2CF_3	4-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-CN	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-Me	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	4-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-Me	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_2CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_2CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2-2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2-2-Py

Tabelul 2



in care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

5

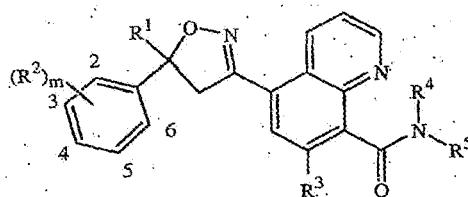
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 3



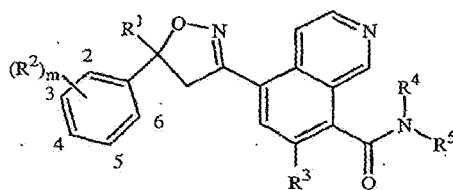
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 4



5

în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

10

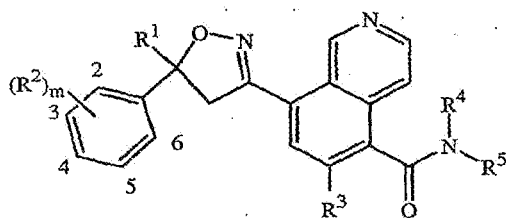
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 5



5

în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py

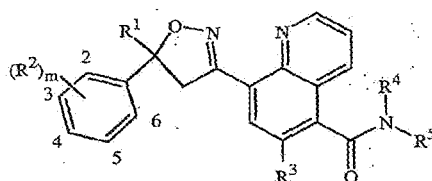
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 6



5

în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py

10

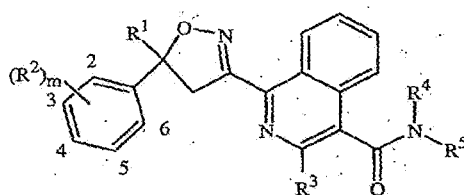
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 7



5

în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5

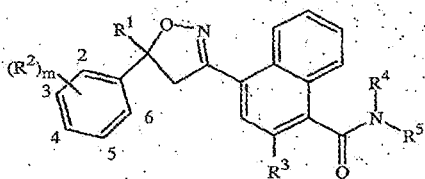
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Br	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-I	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-I	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-CN	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2-2-Py
CF_3	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Me	Me	H	CH_2-2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	H	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Tabelul 6



R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py

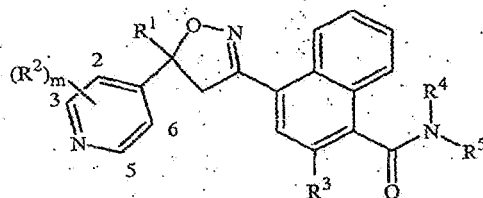
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2Ph
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CN
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2Ph
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CN
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2CF_3

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2Ph
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CN
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2Ph
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CO_2Me
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CN
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-2-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-4-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	$CH_2-5-thiazolyl$
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-3-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2-4-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2CF_3

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2CF_3
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py

Tabelul 9



5

in care m reprezintă 1, 2, 3 sau 4

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl	Me	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-thiazolyl
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Preparare/Utilitate

- 5 Compușii prezentei invenții vor fi utilizați în general ca un preparat sau o compoziție cu un purtător potrivit, ce conține cel puțin un diluant lichid, un diluant solid și un agent activ de suprafață. Ingredientele preparatului sau compoziției sunt selectate să corespundă proprietăților fizice ale ingredientului activ, modului de aplicare și factorilor mediului înconjurător, cum ar fi tipul solului, umiditatea și temperatura. Preparatele utile includ lichidele, cum ar fi soluțiile (inclusiv concentratele emulsionabile), suspensiile, emulsiile
- 10 (inclusiv microemulsiile și/sau suspoemulsiile) și altele asemenea care, opțional, pot fi îngroșate în geluri. Preparatele utile mai includ substanțele solide, cum ar fi pulberile, prafurile, granulele, tabletele, pilulele, peliculele (inclusiv învelișul semințelor) și altele asemenea care pot fi dispersabile în apă („umectabile”) sau solubile în apă. Ingredientul

activ poate fi (micro)capsulat și ulterior format într-o suspensie sau preparat solid; alternativ întregul preparat al ingredientului activ poate fi capsulat (sau „învelit”). Capsularea poate controla sau amana separarea ingredientului activ. Preparatele pulverizabile pot fi extinse la medii potrivite și utilizate la volume de pulverizare de la

5

aproximativ unul până la câteva sute de litri pe hectar. Compozițiile înalt rezistente sunt utilizate în primul rând în calitate de intermediari pentru prepararea ulterioară.

Preparatele vor conține tipic cantități efective de ingredient activ, diluant și agent activ de suprafață în următoarele limite aproximative care constituie până la 100% de masă.

10

	<u>Ingredient activ</u>	<u>Diluant</u>	<u>Agent activ de suprafață</u>
Granule, tablete și prafuri solubile în apă și dispersabile în apă	0,001-90	0-99,999	0-15
Suspensii, Emulsii, Soluții (inclusiv concentrate emulsionabile)	1-50	40-99	0-50
Pulberi	1-25	70-99	0-5
Granule și pilule	0,001-99	5-99,999	0-15
Compoziții înalt rezistente	90-99	0-10	0-2

Diluanții solizi tipici sunt descriși în Watkins și alții, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, Ed. a 2-a, Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Diluanții lichizi tipici sunt descriși în Marsden, *Solvents Guide*, Ed. a 2-a, Interscience, New York, 1950.

McCutcheon's *Detergents and Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, precum și Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, enumeră agenții activi de suprafață și utilizările recomandate. Toate preparatele pot conține cantități minore de adaosuri pentru a reduce spuma, sinterizarea, coroziunea, creșterea microbiologică și altele asemenea, sau îngroșători pentru a mări viscozitatea.

15

20

Agenții activi de suprafață includ, de exemplu, alcooli polietoxilați, alchilfenoli polietoxilați, esteri ai acizilor grași sorbitani polietoxilați, dialchil sulfosuccinat, alchil sulfati, alchilbenzen sulfonați, organosiliconi, *N,N*-dialchiltaurati, lignin sulfonați, condensate ale formaldehidei cu naftalensulfonați, policarboxilați, glicerol esteri și bloccopolimeri ai polioxietilenei/polioxipropilenei și alchilpoliglicozide, în care numărul unităților de glucoză înseamnă gradul de polimerizare (G.P.), poate varia de la 1 la 3, iar unitățile de alchil pot varia de la C_6 la C_{14} (vezi *Pure and Applied Chemistry* 72, 1255-1264).

25

Diluanții solizi includ, de exemplu, argilele cum ar fi bentonita, montmorilonitul, atapulgita și caolinul, amidonul, zahărul, silice, talcul, diatomitul, ureea, carbonatul de calciu, carbonatul și bicarbonatul de sodiu, și sulfatul de sodiu.

30

Diluanții lichizi includ, de exemplu, apa, *N,N*-dimetilformamida, dimetil sulfoxidul, *N*-alchilpirolidonul, etilen glicolul, polipropilen glicolul, polipropilen carbonatul, esterii dibazici, parafinele, alchilbenzenii, alchilnaftalinele, glicerina, triacetina, uleiurile de măsline, ricin, din semințe de in, tung, susan, porumb, arahide, semințe de bumbac, boabe de soia, semințe de rapiță și nuci de cocos, esterii acizilor grași, cetonele, cum ar fi ciclohexanona, 2-heptanona, izoforona și 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona; acetati, cum ar fi hexil acetatul, heptil acetatul și octil acetatul, și alcoolii, cum ar fi metanolul, ciclohexanolul, decanolul, alcoolul benzilic și tetrahidrofurfurilic.

35

Preparatele utile conform prezentei invenții pot de asemenea conține materiale bine cunoscute specialiștilor în domeniu, și anume aditivi, cum ar fi antispumanti, substanțe peliculogene și coloranți. Antispumanții pot include lichidele dispersabile în apă ce conțin poliorganosiloxani, cum ar fi Rhodorsil® 416. Substanțele peliculogene pot include acetati polivinilici, copolimeri ai acetatilor polivinilici, copolimerul polivinilpirolidon-

40

- vinil acetat, alcoolii polivinilici, copolimeri ai alcoolilor polivinilici și ceruri. Coloranții pot include compoziții colorante lichide dispersibile în apă, cum ar fi Pro-Ized® Colorant Red. Un specialist în domeniu va recunoaște că aceasta este o listă incompletă a aditivilor utilizați în preparate. Exemplele potrivite de aditivi în cazul dat vor include cele enumerate aici și cele enumerate în *McCutcheon's 2001, Volumul 2: Functional Materials* publicate de MC Publishing Company și Publicația PCT WO 03/024222.

- Soluțiile, inclusiv concentratele emulsionabile, pot fi preparate prin amestecarea simplă a ingredientelor. Pulberile și prafurile pot fi preparate prin cupajare și, de obicei, măcinare într-o moară cu ciocane sau o moară fluidizată. Suspensiile se prepară, de obicei, prin măcinare umedă; vezi, de exemplu, U.S. 3,060,084. Granulele și pilulele pot fi preparate prin pulverizarea materialului activ pe purtători granulari preformați sau prin tehnici de aglomerare. Vezi Browning „Agglomeration”, *Chemical Engineering*, 4 decembrie, 1967, paginile 147-148, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, ed. a 4-a, McGraw-Hill, New York, 1963, paginile 8-57 și publicația PCT WO 91/13546. Pilulele pot fi preparate așa cum este descris în U.S. 4,172,714. Granulele dispersabile în apă și solubile în apă pot fi preparate așa cum este descris în U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 și DE 3,246,493. Tabletele pot fi preparate așa cum este descris în U.S. 5,180,587, U.S. 5,232, 701 și U.S. 5,208,030. Peliculele pot fi preparate așa cum este descris în GB 2,095,558 și U.S. 3,299,566.

- Pentru informații suplimentare cu privire la domeniul de preparare vezi T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks și T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Vezi, de asemenea, U.S. 3,235,361, col. 6, rândul 16 din Col. 7, rândul 19 și exemplele 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167, 169-182; U.S. 2,891,855, col. 3, rândul 66 până la col. 5, rândul 17 și exemplele 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp. 81-96; și Hance și alții, *Weed Control Handbook*, ed. a 8-a, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

- În exemplele care urmează, toate procentele sunt masice cu excepția cazului când se indică altfel și toate produsele sunt preparate prin moduri tradiționale. Numerele compușilor se referă la compușii din Indexul Tabelelor A-C. Fără elaborare suplimentară se consideră că un specialist în domeniu folosind descrierea precedentă poate utiliza prezenta invenție în întregime. Exemplele ce urmează trebuie, prin urmare, să fie interpretate pur și simplu ca ilustrative și nici într-un caz ele nu limitează descrierea.

Exemplul A

Praf umectabil

Compusul 1	65,0
eterul dodecifenol polietilen glicol	2,0
ligninsulfonat de sodiu	4,0
silicoaluminat de sodiu	6,0
montmorilonit (calcinat)	23,0

Exemplul B

Granule

Compusul 2	10,0
granule de atapulgită (material slab volatil,	90,0

0,71/0,30 mm; U.S.S. Nr. 25-50 site)

40

Exemplul C

Pilulă extrudată

Compusul 8	25,0
sulfat de sodiu anhidru	10,0
ligninsulfat de sodiu brut	5,0
alchilnaftluinsulfonat de sodiu	1,0
bentonită de magneziu/calciu	59,0

Exemplul DConcentrat emulsionabil

Compusul 20	20,0
amestec de sulfonați solubili în ulei și eteri de polioxietilen	10,0
izoforon	70,0

Exemplul EMicroemulsie

Compusul 21	5,0
copolimer al acetatilor polivinilpirolidon-vinil	30,0
alchilpoliglicozidă	30,0
monooleat gliceril	15,0
apă	20,0

5

Exemplul FTratamentul semintelor

Compusul 101	20,0
copolimer al acetatilor polivinilpirolidon-vinil	5,0
ceară de acid montanic	5,0
ligninsulfonat de calciu	1,0
copolimeri bloc de polioxietilenă /polioxipropilenă	1,0
alcool stearic (POE 20)	2,0
poliorganosilan	0,20
colorant roșu	0,05
apă	65,75

Exemplul GBaston de fertilizator

Compusul 201	2,50
copolimer al pirolidon-stirenului	4,80
tristirilfenil 16-etoxilat	2,30
talc	0,80
amidon de porumb	5,00
îngrășăminte artificiale cu acțiune întârziată	36,00

Nitrophoska® Permanent 15-9-15

(BASF) caolin	38,00
apă	10,60

- 10 Compușii conform prezentei invenții manifestă activitate de combatere a unui spectru larg de dăunători nevertebrați. Acești dăunători includ nevertebrate ce locuiesc într-o mare varietate de medii, cum ar fi, de exemplu, frunzișul plantelor, rădăcinile, solul, recolta sau alte produse alimentare, clădirile sau tegumentul animalelor. Acești dăunători includ, de exemplu nevertebrate ce se hrănesc cu frunziș (inclusiv cu frunze, tulpină, flori și fructe), semințe, lemn, fibre textile, sânge sau țesut animal, și prin aceasta cauzează
- 15 pagube sau prejudicii, de exemplu, culturilor de pe câmp și celor depozitate, pădurilor, culturilor de seră, plantelor decorative, culturilor pentru răsadit, produselor alimentare depozitate sau produselor fibroase, sau caselor și altor clădiri și conținutului din ele, sau sunt periculoase pentru sănătatea animalelor sau sănătatea publică. Specialiștii în
- 20 domeniu vor recunoaște că nu toți compușii sunt la fel de efectivi în combaterea dăunătorilor în toate stadiile de creștere a lor.

- 25 Compușii și compozițiile conform prezentei invenții sunt utile din punct de vedere agronomic pentru protecția culturilor de câmp de dăunători nevertebrați fitofagi, precum și din punct de vedere neagronic pentru protecția altor culturi și plante horticoale de dăunători nevertebrați fitofagi. Această utilitate include protecția culturilor și altor plante

- (atât agronomice, cât și neagronomice) ce conțin material genetic introdus prin inginerie genetică (cum ar fi transgenic) sau modificat prin mutagenză pentru a obține caracteristici avantajoase. Exemple ale acestor caracteristici sunt toleranță la erbicide, rezistență la dăunători fitofagi (ex. insecte, căpușe, afide, păianjeni, nematozi, melci, fungi patogeni pentru plante, bacterii, viruși), creșterea îmbunătățită a plantelor, toleranță sporită la condiții de creștere nefavorabile, cum ar fi temperaturi înalte sau joase, umiditate joasă sau mare a solului și salinitate înaltă, înflorire sau fructificație sporită, recolte mai mari, coacere rapidă, calitate sau valoare nutritivă mai mare a produselor recoltate și proprietăți de depozitare sau prelucrare îmbunătățite ale produselor recoltate.
- 10 Plantele transgenice pot fi modificate pentru a demonstra caracteristici multiple.

- Exemplele de plante cu caracteristici obținute prin inginerie genetică sau mutagenză includ soiuri de porumb, bumbac, soia și cartofi, exprimând toxina insecticidă *Bacillus thuringiensis*, cum ar fi YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® și NEWLEAF®, și soiuri de porumb, bumbac, soia și semințe de rapiță tolerante la erbicide, cum ar fi ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, Evil®, STS® și CLEARFEELD®, precum și culturi exprimând *N*-acetiltransferază (GAT) pentru a asigura rezistență la erbicidul glifosat, sau culturile conținând gena HRA ce asigură rezistență la erbicidele ce inhibă acetolactat sintaza (ALS). Compușii și compozițiile conform prezentei invenții pot interacționa singergic cu caracteristicile introduse prin inginerie genetică sau modificate prin mutagenză, îmbunătățind astfel expresia fenotipică sau eficacitatea caracteristicilor sau sporind eficacitatea combaterii dăunătorilor nevertebrați. În special, compușii și compozițiile pot interacționa sinergic cu expresiile fenotipice ale proteinelor sau alte produse naturale toxice pentru dăunătorii nevertebrați pentru a asigura o combatere mai eficientă a acestor dăunători.

- 25 Utilizarea neagronomică se referă la combaterea dăunătorilor nevertebrați pe suprafețe altele decât câmpurile cu plante de cultură. Utilizarea neagronomică a compușilor și compozițiilor conform prezentei invenții include combaterea dăunătorilor nevertebrați în grăunți, boabe și alte produse alimentare depozitate, precum și în textile, cum ar fi îmbrăcămintea și covoarele. Utilizarea neagronomică a compușilor și compozițiilor conform prezentei invenții la fel include combaterea dăunătorilor nevertebrați în plantele decorative, păduri, curți, pe marginile drumurilor și pe gazoane, cum ar fi peluzele, terenurile de golf și izlazurile. Utilizarea neagronomică a compușilor și compozițiilor conform prezentei invenții la fel include combaterea dăunătorilor nevertebrați în case și alte clădiri, care pot fi ocupate de oameni și/sau asociații, gospodării, ferme, grădinile zoologice. Utilizarea neagronomică a compușilor și compozițiilor conform prezentei invenții la fel include combaterea dăunătorilor nevertebrați, cum ar fi termita care pot deteriora lemnul și alte materiale folosite la construcția clădirilor.

- Utilizarea neagronomică a compușilor și compozițiilor conform prezentei invenții de asemenea include protecția sănătății oamenilor și animalelor prin combaterea dăunătorilor nevertebrați care sunt parazitari sau transmit boli infecțioase. Combaterea paraziților animalelor include combaterea paraziților externi, care parazitează pe suprafața corpului animalului-gazdă (ex., umeri, axile, abdomen, partea interioară a coapselor) și paraziți interni care parazitează în interiorul corpului animalului-gazdă (ex., stomac, intestine, plămâni, vine, sub piele, în țesuturile limfatice). Dăunătorii ce parazitează în exterior sau cei transmitători de boli includ, de exemplu, puricii de nisip, căpușele, păduchii, țânțarii, muștele, cleștarii și puricii. Paraziții interni includ anchilostomii, limbricii și helminții. Compușii și compozițiile conform prezentei invenții sunt potrivite pentru combatere sistematică și/sau nesistematică a infestării sau infectării a animalelor cu paraziți. Compușii și compozițiile conform prezentei invenții sunt în special potrivite pentru combaterea dăunătorilor ce parazitează în exterior sau sunt transmitători de boli. Compușii și compozițiile conform prezentei invenții sunt potrivite pentru combaterea paraziților ce infestează animalele lucrătoare, cum ar fi bovinele, oile, caprele, caii, porcii, măgarii, cămilele, bivoli, iepurii, găinile, curcanii, rășile, găștele și albinele; animalele de casă și animalele domestice, cum ar fi câinii, mările, păsările de casă și peștii de acvariu; precum și așa-numitele animale de experiență, cum ar fi hârciogii, cobaii, șobolanii și șoarecii. Prin combaterea acestor paraziți, mortalitatea și scăderea productivității (în sens de carne, lapte, lână, piei, ouă, miere, etc.) se reduce, astfel încât aplicarea unei

compoziții ce conține un compus conform prezentei invenții permite o creștere a animalelor mai economică și mai simplă.

- Exemplele dăunătorilor nevertebrați agronomici și neagronomici includ ouăle, larvele și insectele adulte din ordinul Lepidopterenilor, cum ar fi buhele, fluturii-bufnițe, fluturii-cotari, și din familia fluturilor nocturni Noctuidae (ex., (*Sesamia inferens* Walker), (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), (*Spodoptera eridania* Cramer), (*Spodoptera fugipetra* J.E. Smith), buha-mică (*Spodoptera exigua* Hubner), (*Spodoptera littoralis* Boisduval), (*Spodoptera ornithogalli* Guenee), fluturilele epsilon (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), (*Anticarsia gemmatilis* Hubner), (*Lithophane antennata* Walker), (*Barathra brassicae* Linnaeus), (*Pseudoplusia includens* Walker), buha-varzei (*Trichoplusia ni* Hubner), omida-tutunului (*Heliothis virescens* Fabricius); tociarii, moliile-minere, omizile care lasă păienjeniș, viermii-varzei și vătămătorii care scheletizează frunzele din familia Piralidelor (ex., fluturilele-porumbului (*Ostrinia nubilalis* Hubner)), fluturilele lui Walker (*Amyelois transitella*), (*Crambus caliginosellus* Clemens), (Pyralidae: *Crambinae*), cum ar fi (*Herpetogramma licarsisalis* Walker)); (*Chilo inficiscatellus* Snellen), (*Neoleucinodes elegantalis* Guenee), (*Cnaphalocerus medinalis*), (*Desmia funeralis* Hubner), (*Diaphania nitidalis* Stoll), (*Helluala hydralis* Guenee), (*Scirpophaga incertulas* Walker), (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), (*Scirpophaga innotata* Walker), (*Scirpophaga nivella* Fabricius), (*Chilo polychrysus* Meyrick), (*Crocidolomia binotalis* English)); torticidele, țigărarii, viermii semințelor și viermii fructelor din familia Tortricidelor (ex., viermele-merelor (*Cydia pomonella* Linnaeus), piraia-viei (*Endopiza viteana* Clemens), omida-orientală-a-persicului (*Grapholita molesta* Busck), (*Cryptopklebia leucotreta* Meyrick), (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), (*Argyrotaenia velutinana* Walker), (*Choristoneura rosaceana* Harris), (*Epiphyas postvittana* Walker), (*Eupoecilia ambiguella* Hubner), (*Pandemis pyrusana* Kearfott), (*Platynota stultana* Walsingham), (*Pandemis cerasana* Hubner), (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); și multe alte lepidoptere cu impact economic important (ex., moliavarzei (*Plutella xylostella* Linnaeus), viermele-roz-al-bumbacului (*Pectinophora gossypiella* Saunders), omida-păroasă-a-stejarului (*Luantria dispar* Linnaeus), (*Carposina niponensis* Walsingham), (*Anarsia lineatella* Zeller), (*Phthorimaea operculella* Zeller), (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), (*Lerodea eufala* Edwards), (*Leucoptera scitella* Zeller)); ouăle, nimfele și insectele adulte din ordinul Blatidelor, inclusiv gândacii din familiile Blatidelor și Blatidelor (ex., gandacul-negru-de-bucătărie (*Blatta orientalis* Linnaeus), gandacul-asiatic (*Blatella asahinai* Mizukubo), gandacul-roșu-de-bucătărie (*Blatella germanica* Linnaeus), gandacul (*Supella longipalpa* Fabricius), gandacul-american (*Periplaneta americana* Linnaeus), gandacul-cafeniu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gandacul-de-Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), (*Periplaneta fuliginosa* Service), (*Periplaneta australasiae* Fabr.), (*Nauphoeta cinerea* Olivier) și (*Symploce pollens* Stephens)); ouăle, larvele și insectele adulte ce se hrănesc cu frunze, fructe, rădăcini, semințe și cu țesuturi veziculare din ordinul Coleopterenilor, inclusiv gărgărițele din familiile Antribidelor, Bruchidelor și Curculionidelor (ex., gărgărița-bumbacului (*Anthonomus grandis* Boheman)), gărgărița-orezului-de-apă (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gărgărița-graului (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gărgărița-orezului (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), (*Listronotus maculicollis* Dietz), (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), (*Sphenophorus venatus vestitus*), (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); puricii-de-pământ, gândacii-de-frunză, gândacii-de-Colorado, puricii-cartofilor și moliile-miner din familia Crisomelidelor (ex., gandacul-de-Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gandacul-părice-de-rădăcină (*Diabrotica virgileria virgifera* LeConte); cărăbușii și alți gândaci din familia Scarabaeidae (ex., cărăbușul-japonez (*Popillia japonica* Newman), cărăbușul-oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), (*Ciclocephala borealis* Arrow), (*Ciclocephala immaculata* Olivier sau *C. lurida* Bland), (*Aphodius* spp.), (*Ataenius spretulus* Haldeman), (*Cotinis nitida* Linnaeus), (*Maladera castanea* Arrow), (*Phyllophaga* spp.) și cărăbușul-european (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); gandacii-de-piele din familia Dermestidelor; viermii sarmă din familia Elateridelor; gandacii-de-scoarță din familia Scolitidelor și gândacii-morari din familia Tenebrionidelor. Pe lângă aceasta dăunătorii agronomici și neagronomici includ: ouăle,

- insectele adulte și larvele din ordinul Dermapterelor, inclusiv urechelnitele din familia Forficulidelor (ex., urechelnita-comună (*Forficula auricularia* Linnaeus)), urechelnita-neagră (*Chelisoches morio* Fabricius); ouăle, insectele imature, insectele adulte și nimfele din ordinele Hemipterelor și Homopterelor, cum ar fi: ploșnitele-de-plantă din familia Miridelor, cicadele din familia Cicadelor, cicorițele (ex., *Empoasca* spp.) din familia Cicadelidelor, stelnitele (ex., *Cimex lectularius* Linnaeus) din familia Cimicidelor, cicorițele din familiile Fulgoroidelor și Delfacidelor, cicoarele-mordele din familia Membracidelor, psilidele din familia Psilidelor, aleirodidele din familia Aleirodidelor, afidele din familia Afidelor, filoxerele din familia Filoxeridelor, păduchii-țestași din familia Pseudococcidelor, păduchii-țestași din familiile Coccidelor, Diaspididelor și Margarodidelor, ploșnitele din familia Tingidelor, ploșnitele-cerealelor din familia Pentatomidelor, ploșnitele-graului din America de Nord (ex., (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) și (*Blissus insularis* Barber)) și alte ploșnite ale semănăturilor din familia Ligaeididelor, ploșnitele din familia Cercopidelor, ploșnitele-romboidale din familia Coreidelor și ploșnitele-roșii și ploșnitele-roșii-ale-bumbacului din familia Pirrocoridelor. De asemenea sunt incluse ouăle, larvele, nimfele și insectele adulte din ordinul Acarienilor (acarienii), cum ar fi: păianjenii-comuni din familia Tetranicidelor (ex., păianjenul-roșu-al-pomilor (*Panonychus ulmi* Koch)), păianjenul-cu-două-pete (*Tetranychus urticae* Koch), căpușa McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor); cleștarii plăți din familia Tenuipalpidelor (ex., cleștarul-citricelor (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); cleștarii-viței și cliștarii-mugurilor din familia Eriofidelor și alți acarieni care se hrănesc cu frunze și acarieni importanți pentru sănătatea oamenilor și animalelor, adică cleștarii din familia Epidermopridelor, anghilulele din familia Demodicidelor, căpușele-grâului din familia Glycifagidelor, căpușele din ordinul Ixodidelor (ex., căpușa-ixodă-a-cerbului (*Ixode scapularis* Say)), căpușa-ixodă-a-paraliziei australiene (*Ixodes holocyclus* Neumann), căpușa-ixodă-a-cainelui (*Dermacentor variabilis* Say), căpușa-ixodă (*Amblyomma americanum* Linnaeus) și căpușele-de-raie din familiile Psoroptidelor, Piemotidelor și Sarcopitidelor; ouăle, insectele adulte și insectele imature din ordinul Ortopterelor, inclusiv căluții, lăcustele și greierii (ex., căluții-călători (ex., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), lăcustele-americeane (ex., *Schistocerca americana* Drury), lăcusta-de-pustiu (*Schistocerca gregaria* Forskal), lăcusta-călătoare (*Locusta migratoria* Linnaeus), lăcusta-de-arbuști (*Zonocerus* spp.), greerul-de-casă (*Acrida domestica* Linnaeus), coropișnițele (ex. (*Scapteriscus vicinus* Scudder) și (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); ouăle, insectele adulte și insectele imature din ordinul Dipterelor, inclusiv molile-miner (ex., *Liriomyza* spp., cum ar fi (*Liriomyza sativae* Blanchard)), bătanii, muștele-drosofile (Tefritidele), muștele-suedeze (ex. *Oscinella frit* Linnaeus), larvele-apode-de-sol, muștele-de-casă (ex., *Musca domestica* Linnaeus), muștele-mici-de-casă (ex., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), muștele obișnuite (ex., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), muștele-de-toamnă, muștele-albastre (ex., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) și alți dăunători zburători, strechea-cailor (ex., *Tabanus* spp.), larvele-de-streche-gastrică (ex., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), strechea-vitelor (ex., *Hypoderma* spp.), tăunii-renilor (ex., *Chrysops* spp.), căpușele-oilor (ex., *Melophagus ovinus* Linnaeus) și alte Brachicere, țânțarii (ex., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), musculițele (ex., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), batanii-mușcători, țânțarii, sciaridele și alte Nematocere; ouăle, insectele adulte și insectele imature din ordinul Tisanopterelor, inclusiv tripsii-tutunului (*Thrips tabaci* Lindeman), tripsii-graului (*Frankliniella* spp.) și alți tripsii care se hrănesc cu frunze; insectele dăunătoare din ordinul Himenopterelor, inclusiv furnicile din Familia Formicidelor, și anume (*Camponotus floridanus* Buckley), furnica-sfredelitoare-roșie-de-Pensilvania (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), furnica-sfredelitoare-de-Pensilvania (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), (*Pheidole* sp.), (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); furnica-de-casă (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), furnica-vasmania (*Wasmannia auropunctata* Roger), furnica-solenopsis (*Solenopsis geminata* Fabricius), furnica-roșie-a-lui-Richter (*Solenopsis invicta* Buren), furnica-argentiniană (*Iridomyrmex humilis* Mayr), furnica (*Paratrechina longicornis* Latreille), furnica-de-luncă (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), furnica americană (*Lasius alienus* Forster), furnica (*Tapinoma sessile* Say)). Alte Himenoptere, inclusiv albinele (inclusiv albinele-

- coside), viespile, gărgăunii și viespile-ferăstrău (*Neodiprion* spp., *Cephus* spp.); insectele dăunătoare din ordinul Izopterelor, inclusiv termitelile din familiile Termitidelor (ex., *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidelor (ex., *Cryptotermes* sp.), și Rinotermitidelor (ex., *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), (*Reticulitermes flavipes* Kollar), (*Reticulitermes hesperus* Banks), (*Coptotermes formosanus* Shiraki), (*Incisitermes immigrans* Snyder), (*Cryptotermes brevis* Walker), (*Incisitermes snyderi* Light), (*Reticulitermes virginicus* Banks), (*Incisitermes minor* Hagen), termitelile arboricole, cum ar fi *Nasutitermes* sp. și alte termite de importanță economică; insectele dăunătoare din ordinul Tizanurelor, cum ar fi (*Lepisma saccharina* Linnaeus) și (*Thermobia domestica* Packard); insectele dăunătoare din ordinul Malofagelor, inclusiv păduchele-de-cap (*Pediculus humanus capitis* De Geer), păduchele-de-corp (*Pediculus humanus* Linnaeus), malofagienul (*Menacanthus stramineus* Nitsch), păduchele-de-caine (*Trichodectes canis* De Geer), păduchele (*Goniocotes gallinae* De Geer), căpușa-oii (*Bovicola ovis* Schrank), păduchele (*Haematopinus eurystermus* Nitsch), păduchele-vitelor-cornute-cu-nasul-lung (*Linognathus vituli* Linnaeus) și alți păduchi paraziți sugători de sânge și rumegători care atacă oamenii și animalele; insectele dăunătoare din ordinul Sifonopterelor, inclusiv puricele-de-șobolan (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), puricele-de-pisică (*Ctenocephalides felis* Bouche), puricele-de-caine (*Ctenocephalides canis* Curtis), puricele-de-găină (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), păduchele-ventuză (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), puricele (*Pulex irritans* Linnaeus) și alți păduchi care afectează mamiferele și păsările. Dăunătorii antropozii cuprinși suplimentar includ: păianjenii din ordinul Araneae, cum ar fi păianjenul (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) și păienjenul-țesător-negru (*Latrodectus mactans* Fabricius), și centipelele din ordinul Scutigleromorfelor, cum ar fi muscarul-comun (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Compușii prezentei invenții posedă acțiune și asupra membrilor din clasele Nematozilor, Cestodelor, Trematodelor și Acantocefalilor, inclusiv membrilor de importanță economică din ordinele Strongilidelor, Ascarididelor, Oxiuridelor, Rabditidelor, Spiruridelor și Enoplidelor, cum ar fi, dar nu limitate la, dăunătorii agricoli de importanță economică (adică nematozii-galicole din genul *Meloidogyne*, nematozii vătămători din genul *Pratylenchus*, nematozii din genul *Trichodorus*, etc.) și dăunătorii care afectează sănătatea oamenilor și animalelor (adică toate trematodele, viermii-panglică și viermii-cilindrici, cum ar fi *Strongylus vulgaris* la cai, *Toxocara canis* la câini, *Haemonchus contortus* la oi, *Dirofilaria immitis* Leidy la câini, *Anoplocephala perfoliata* la cai; *Fadciola hepatica* Linnaeus la animalele rumegătoare, etc.). Compușii conform invenției posedă o activitate înaltă particulară împotriva dăunătorilor din ordinul Lipidopterelor (ex., *Alabama argillacea* Hubner (buhabumbacului-americană), *Archips argyrospila* Walker (fluturele-omidă-a-pomilor), *A. rosana* Linnaeus (omida europeană), și alte specii *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (paratoarea), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (buhă-orezului), *Crambus caliginosellus* Clemens (fluturele-molie), *Crambus teterrellus* Zincken (fluture), *Cydia pomonella* Linnaeus (viermele-merelor), *Earias insulana* Boisduval (omida-cu-spini), *Earias vitella* Fabricius (viermele-cu-pete), *Helicoverpa armigera* Hubner (viermele-american), *Helicoverpa zea* Boddie (buhă-bumbacului), *Heliothis virescens* Fabricius (moliatutunului), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (fluture), *Lobesia botrana* Denis & Schiffmuller (pirala-viei), *Pectinophora gossypiella* Saunders (viermele-roz-albumbacului), *Phyllocnistis citrella* Strainton (molia-miner-a-citricelor), *Pieris brassicae* Linnaeus (albița-varzei), *Pieris rapae* Linnaeus (albița-rapiței), *Plutella xylostella* Linnaeus (molia-varzei), *Spodoptera exigua* Hubner (buhă-mică), *Spodoptera litura* Fabricius (fluturele-porumbac, omida-ciorchinelor), *Spodoptera frugiperda* J.E. Smith (buhă-ierbii), *Trihoplusia ni* Hübner (buhă ni) și *Tuta absoluta*, Meyrick (minerul-roșiilor).
- Compușii conform invenției posedă de asemenea o activitate comercial importantă asupra membrilor din ordinul Homopterelor, inclusiv: *Acyrtisiphon pisum* Harris (afidamazării), *Aphis craccivora* Koch (păduchele-negru-al-sfeclei), *Aphis fabae* Scopolii (păduchele-negru-al-sfeclei), *Aphis gossypii* Glover (păduchele-bumbacului, păduchele-castraveților), *Aphis pomi* De Geer (păduchele-verde-al-mărului), *Aphis spiraeicola* Patch (păduchele-tavolgian), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (păduchele-volburii),

- Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (păduchele-fragului), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (păduchele-graului-de-Rusia), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (păduchele-verde-al-trandafirului), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (păduchele-ianos), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (păduchele-făinos-al-prunului), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (păduche), *Metopolophium dirrhodum* Walker (păduchele-cerealelor), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (păduchele-de-frunză-al-cartofului), *Myzus persicae* Sulzer (păduchele-de-frunză-al-cartofului-și-persicului, păduchele-verde-al-persicului), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (păduchele-frunzelor-de-salată), *Pemphigus* spp. (păduchii-de-rădăcină și păduchii-tuberculilor), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (păduchele-de-frunză-al-porumbului), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (păduche), *Schizaphis graminum* Rondani (păduchele-cerealelor), *Sitobion avenae* Fabricius (păduchele-graului), *Therioaphis maculata* Buckton (păduchele-cu-pete-al-lucernei), *Toxoptera aurantii* Bayer de Fonscolombe (puricele-negru-al-portocalului-amar), și *Toxoptera citricida* Kirkaldy (păduchele-citricelor; *Adelges* spp. (adelgide); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxeră), *Bemisia tabaci* Gennadius (aleroidida-tutunului, aleiroidida-batatului), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (albița-magnoliei), *Dialeurodes citri* Ashmead (albița-citricelor) și *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (albița-de-seră); *Empoasca fabae* Harris (cicorița-cartofului), *Laodelphax striatellus* Fallen (cicorița-mică-cafenie), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (cicorița-ochiului-boului), *Nephotettix cincticeps* Uhler (cicorița-verde), *Nephotettix nigropictus* Stal (cicorița-orezului), *Nilaparvata lugens* Stal, *Peregrinus maidis* Ashmead, *Sogatella furcifera* Horvath, *Sogatodes orizicola* Muir, *Typhlocyba pomaria* McAtee (cicorița-mărului), *Erythroneoura* spp. (cicorița-viei); *Magidada septendecim* Linnaeus (cicoarea-de-17-ani); *Icerya purchasi* Maskell (păduchele-țestos-in-formă-de-jgheab-de-Australia), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (păduchele-de-San-Jose); *Planococcus citri* Risso (păduchele-făinos-al-viței-de-vie); *Pseudococcus* spp. (alt complex de păduchi-țestoși); *Cacopsylla pyricola* Foerster (puricele-melifer-al-părului), *Trioza diospyri* Ashmead (puricele-melifer-al-hurmei).

- Compușii conform prezentei invenții de asemenea posedă acțiune asupra membrilor din ordinul Hemipterelor, inclusiv: *Acrosternum hilare* Say (ploșnița-scutar), *Anasa tristis* De Geer (ploșnița-romboidală), *Blissus leucopterus* Say (ploșnița-de-pământ), *Cimex lectularius* Linnaeus (ploșnița de pat), *Corythuca gossypii* Fabricius (ploșnița-roșiilor), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (ploșnița-roșiatică-a-bumbacului), *Euchistus servus* Say (ploșnița-scutar-brună), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (ploșnița-scutar-cu-o-pată), *Graptosthetus* spp. (complex al ploșnițelor-de-semințe), *Leptoglossus corculus* Say (ploșnița-semințelor-de-pin), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (ploșnița-de-luncă), *Nezara viridula* Linnaeus, *Oebalus pugnax* Fabricius (ploșnița-orezului), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (ploșnița lui Dallas), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (ploșnița-taun). Alte ordine de insecte nimicite prin intermediul compușilor conform invenției includ ordinul Tisanopterelor (ex., *Frankliniella occidentalis* Pergande (tripsul-florilor), *Scirtothrips citri* Moulton (tripsul-citricelor), *Sericothrips variabilis* Beach (tripsul-păstăilor-de-soia) și *Thrips tabaci* Lindeman (tripsul-cepei); și ordinul Coleopterelor (ex., *Leptinotarsa decemlineata* Say (gandacul-de-Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (gărgarița-mexicană-a-bobului) și viermii-sârmă din genul Agriotes, *Athous* sau *Limonius*).

De menționat că unele sisteme de clasificare contemporane plasează Homoptera ca subordin în ordinul Hemiptera.

- De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Bemisia argentifolii*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Frankliniella occidentalis*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Empoasca fabae*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Peregrinus maidis*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Aphis gossypii*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Myzus persicae*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Plutella xylostella*. De menționat este utilizarea compușilor conform prezentei invenții pentru combaterea *Spodoptera frugiperda*.

Compușii conform prezentei invenții pot fi amestecați de asemenea cu unul sau mai mulți alți compuși sau agenți biologic activi, inclusiv insecticide, nematocide, bactericide, acaricide, erbicide, regulatori de creștere, cum ar fi stimulatorii de înrădăcinare, chemosterilizatorii, semiochimicalele, repelenții, atractanții, feromonii, stimulatorii de alimentare entomopatogenice, virușii sau fungii pentru a forma o pesticidă multicomponentă care dă un spectru larg egal de utilitate agronomică și neagronomică. Astfel, prezenta invenție se referă de asemenea la o compoziție care conține o cantitate biologic efectivă a unui compus cu Formula 1, un N-oxid sau o sare a sa și o cantitate efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional, și mai poate conține cel puțin un agent activ de suprafață, un diluant solid sau un diluant lichid. Alți compuși sau agenți biologic activi pot fi preparați în compoziții ce conțin cel puțin un agent activ de suprafață, un diluant solid sau un diluant lichid. Pentru amestecuri conform prezentei invenții, alți compuși sau agenți biologic activi pot fi pot fi preparați împreună cu compușii conform prezentei invenții, inclusiv compușii cu Formula 1, pentru a forma un preamestec, sau alți compuși sau agenți biologic activi pot fi preparați separat de compușii conform prezentei invenții, inclusiv compușii cu Formula 1, și două preparate combinate împreună la aplicare (ex., în pulverizator) sau, ca alternativă, aplicate succesiv. Alți compuși sau agenți biologic activi utili pentru compozițiile conform prezentei invenții pot fi selectați din agenții de combatere a dăunătorilor nevertebrați cu diferite moduri de acțiune sau diferiți modulatori ai canalului de sodiu din diferite clase chimice, inhibitori de colinesterază, neonicotinoide, lactone macrociclice insecticide, blockeri ai canalului de clorură GABA-regulat (acid γ -aminobutiric), inhibitori ai sintezei de chitină, imitatori ai hormonului juvenil, liganzi receptori de octopamină, agoniști ai ecdizonelor, liganzi receptori de rianodină, analogi de nereistoxină, inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali, inhibitori ai biosintezei lipidice, insecticide ciclodiene, inhibitori ai năpârlirii și agenți biologici ce includ nucleopolihedrovirus (NPV), un membru al *Bacillus thuringiensis*, o delta-endotoxină încapsulată a *Bacillus ihuringiensis* și un insecticid viral apărut natural sau modificat genetic.

De menționat este compoziția conform prezentei invenții în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa de insecticide constituită din modulatori ai canalului de sodiu, inhibitori de colinesterază, neonicotinoide, lactone macrociclice insecticide, blockeri ai canalului de clorură GABA-regulat, inhibitori ai sintezei de chitină, imitatori ai hormonului juvenil, liganzi receptori de octopamină, agoniști ai ecdizonelor, liganzi receptori de rianodină, analogi de nereistoxină, inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali, inhibitori ai biosintezei lipidice, insecticide ciclodiene, inhibitori ai năpârlirii și agenți biologici ce includ nucleopolihedrovirus, un membru al *Bacillus thuringiensis*, o delta-endotoxină încapsulată a *Bacillus ihuringiensis* și un insecticid viral apărut natural sau modificat genetic.

În particular de menționat sunt compușii sau agenții biologic activi adiționali selectați din grupa de insecticide constituită din modulatori ai canalului de sodiu, inhibitori de colinesterază, neonicotinoide, lactone macrociclice insecticide, blockeri ai canalului de clorură GABA-regulat, inhibitori ai sintezei de chitină, imitatori ai hormonului juvenil, liganzi receptori de octopamină, agoniști ai ecdizonelor, liganzi receptori de rianodină, analogi de nereistoxină, inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali, inhibitori ai biosintezei lipidice, insecticide ciclodiene, nucleopolihedrovirus; un membru al *Bacillus thuringiensis*, o delta-endotoxină încapsulată a *Bacillus ihuringiensis* și un insecticid viral apărut natural sau modificat genetic.

Suplimentar de menționat sunt compușii sau agenții biologic activi adiționali selectați din grupa de insecticide constituită din piretroizi, carbamați, neonicotinoide, blockeri ai canalului de sodiu neuronal, lactone macrociclice insecticide, antagoniști ai acidului γ -aminobutiric, uree insecticidă, imitatori ai hormonului juvenil, un membru al *Bacillus thuringiensis*, o delta-endotoxină *Bacillus thruringiensis* și un insecticid viral apărut natural sau modificat genetic.

Exemple ale acestor compuși sau agenți biologic activi cu care compușii prezentei invenții pot fi preparați sunt: insecticidele, cum ar fi abamectinul, acefatul, acetamipridul, acetoprolul, amidoflometul (S-1955), avermectinul, azadiractinul, azinfos-metilul, bifentrilul, bifenazatul, buprofezina, bistrifluronul, buprofezina, carbofuranul, cartapul,

- clorfenapirul, clorfluazuronul, clorantiraniliprolul (DPX-E2Y45), clorpirifosul, clorpirifosmetilul, cromafenozida, clotianidina, ciflometofenul, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuronul, diazinona, dieldrinul, diflubenzuronul, dimeflutrina, dimetoatul, dinotefuranul, diofenolanul, emamectina, endosulfanul, esfenvaleratul, etiprolul, fenotiocarbul, fenoxicarbul, fenpropatrina, fenvaleratul, fipronilul, flonicamida, flubendiamida, flucitrinatul, tau-fluvalinatul, flufenexima (UR-50701), flufenoxuronul, fonofosul, halofenozida, hexaflumuronul, hidrametilnonul, imidaclopridul, indoxacarb, izofenfosul, lufenuronul, malationul, metaflumizona, metaldehida, metamidofosul, metidationul, metomilul, metoprenul, metoxiclorul, metoflutrina, monocrotofosul, metoxifenozida, monocrotofosul, nitenpiramul, nitiazina, novaluronul, noviflumuronul (XDE-007), oxamilul, parationul, paration-metilul, permetrina, foratul, fozalonul, fosmetul, fosamidonul, pirimicarbul, profenofosul, proflutrina, protrifenbutulul, pimezozina, pirafuprolul, piretrina, piridilul, pirifluchinazonul, piriprolul, piriproxifenul, rotenona, rianodina, spinetoramul, spinozadul, spirodiclofenul, spiromezifenul (BSN 2060), spirotetramatul, sulprofosul, tebufenozida, teflubenzuronul, teflutrina, terbufosul, tetraclovinfosul, tiaclopridul, tiametoxamul, tiocarb, tiostap-sodiul, tolfenpiradul, tralometrina, triazamatul, triclorfonul și triflumuronul; fungicidele, cum ar fi acibenzolarul, aldinorul, amisulbromul, azoxistrobinul, benalazi, benomilul, bentia-valicarbul, bentia-valicarb-izopropilul, binomialul, bifenilul, bitertanolul, blasticidin-S, amestecul Bordeaux (sulfatul de cupru tribazic), boscalidul/nicobifenul, bromuconazolul, bupirimatul, butiobatul, carboxina, carpropamidul, captafolul, captanul, carbendazimul, cloronebul, clorotalonilul, clozolinatul, clotrimazolul, oxiclora de cupru, sărurile de cupru, cum ar fi sulfatul de cupru și hidroxidul de cupru, ciazofamida, ciflunamida, cimoxanilul, ciproconazolul, ciprodinilul, diclofluanidul, diclocimetul, diclomezina, dicloranul, dietofencarb, defenoconazolul, dimetomorful, dimoxistrobinul, diniconazolul, diniconazolul-M, dinocapul, discostobinul, ditianonul, dodemorful, dodina, econazolul, etaconazolul, edifenfosul, epoxiconazolul, etaboxamul, etirimolul, etridiazolul, famoxadon, fenamidona, fenarimolul, fenbuconazolul; fencaramida, fenfuramul, fenhexamida, fenoxanilul fenpiclonilul, fenpropidinul, fenpropimorful, fentinacetatul, fentinhidroxidul, ferbamul, ferfurazoatul, ferimzona, fluazinamul, fludioxonilul, flumetoverul, flupicolida, fluoxastrobinul, fluchinconazolul, flurilazolul, flutolamilul, fluchinconazolul, fluzilazolul, flusulfamida, flutolanilul, flutriafolul, folpetul, fozetil-aluminiul, fuberidazolul, furalaxilul, furametapirul, hexaconazolul, himexazolul, guazatina, imazalilul, imibenconazolul, iminocadina, iodicarb, ipconazolul, iprobenfosul, iprodiona, iprovalicarbul, izoconazolul, izoprotolanul, kasugamicina, kresoxim-metilul, mancozebul, mandipropamida, manebul, mapanipirul, mefenoxamul, mepronilul, metalaxilul, metconazolul, metasulfocarb, metiramul, metominostrobina/fenominostrobina, mepanipirimul, metrafenona, miconazolul, miclobutanilul, neo-azozina(metanarzonatul feric), nuarimolul, octilinona, ofurace, orizastrobina, oxadixilul, acidul oxolinic, oxpoconazolul, oxicarboxina, paclobutrazolul, penconazolul, pencicuronul, pentiopiradul, perfurazoatul, acid fosfonic, ftalida, picobenzamida, picoxistrobina, polioxina, probenazolul, proclorazul, procimidona, propamocarbul, propamocarb-hidroclorură, propiconazolul, propinebul, prochinazida, protoconazolul, piraclostrobina, priazofosul, pirifenoxul, pirimetanilul, pirifenoxul, pirolnitrina, pirochilonul, chinconazolul, chinoxifenul, chintozena, siltiofamul, simeconazolul, spiroxamina, streptomycina, sulfur, tebuconazolul, tecrazena, tecloftalamul, tecnazena, tetraconazolul, tiabendazolul, tipluzamida, tiofanat, tiofanat-metilul, tiramul, tiadinilul, tolclorfos-metilul, tolilfluanida, triadimefonul, triadimenolul, triarimolul, triazoxidul, tridemorful, trimorfamida, triciclazolul, trifloxistrobina, triforinul, triticonazolul, uniconazolul, validamicina, vinclozolinul, zinebul, ziramul, și zoxamida; nematocidele, cum ar fi aldicarb, imiciafosul, oxamilul și fenamifosul; bactericidele, cum ar fi streptomycina; acaridele, cum ar fi amitraza, chinometionatul, clorobenzilatul, cihexatinul, dicofolul, dienoclorul, etoxazolul, fenazachina, oxidul de fenbutatin, fenproppatrina, fenpiroximatul, hexitiazoxul, propargita, piridabenul și tebufenpiradul; și agenții biologici care conțin bacteria entomopatogenice, cum ar fi *Bacillus thuringiensis*

sub *sp. aizawai*, *Bacillus thuringiensis* sub *sp. kurstaki*, delta endotoxina încapsulată de *Bacillus thuringiensis*, (ex., Cellcap, MPV, MPVII); fungi entomopatogenic, cum ar fi fungus muscardin verde; și virus entomopatogenic ce include baculovirusul, nucleopolihedrovirusul (NPV), cum ar fi *Helicoverpa zea* nucleopolihedrovirus (HzNPV),
 5 *Anagrapha falcifera* nucleopolihedrovirus (AfNPV); și granulos virus (GV), cum ar fi *Cydia pomonella* granulos virus (CpGV).

Compușii conform prezentei invenții și compozițiile acestora pot fi aplicate la plantele modificate genetic pentru a exprima proteinele toxice pentru dăunătorii nevertebrați (cum ar fi delta-endotoxinele *Bacillus thuringiensis*). Efectul compușilor conform prezentei
 10 invenții pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați aplicați exogenic poate fi sinergice cu proteinele toxice exprimate.

Referințe generale la acești protectanți agricoli (ex. insecticide, fungicide, nematocide, acaricide, erbicide și agenți biologici) se conțin în *The Pesticide Manual*, ediția a 13-a, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 și *The BioPesticide Manual*, ediția a 2-a, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council,
 15 Farnham, Surrey, U.K., 2001.

De menționat este compoziția conform prezentei invenții în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa constituită din abamectin, acefat, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadiractin, azinfosmetil, bifentrină, bifenazat, bistrifluron, buprofezină, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluazuron, clorantiraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metil, clorobenzilat, cromofenozidă, clotianidină, ciflometofen, ciflutrină, beta-ciflutrină, cihalotrină, gamma-cihalotrină, lambda-cihalotrină, cihexatin, cipermitrină, ciromazină, deltametrină, diafenthiuron, diazinonă, dicofol, dieldrină, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrină, dimetoat, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazachină, fenbutatin oxid, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrină, fenpiroximat, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamidă, flucitrinat, tau-fluvalinat, flufenimer, flufenoxuron, fonofos, halofenozidă, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, izofenfos, lufenuron, malation, metaflumizon, metaldehidă, metamidofos, metidation, metomil, metopren, metoxiclor, metoxifenoizidă, metoflutrină, monocrotofos, nitenpiram, nitiazină, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrină, forat, fozalon, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, proflutrină, propargită, protrifenbut, pimetrozină, pirafuprol, piretrină, piridaben, piridilil, pirifluchinazon, piriprol, piriproxifen, rotenonă, rianodină, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromezifen, spiroetramat, sulprofos, tebufenozidă, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrină, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodiu, tolfenpirad, tralometrină, triazamat, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, o delta-endotoxină încapsulată de *Bacillus thuringiensis*,
 40 baculovirus, bacterie entomopatogenică, virus entomopatogenic și fungi entomopatogenice.

De asemenea de menționat este compoziția conform prezentei invenții în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa constituită din abamectin, acetamiprid, amitraz, avermectin, azadiractin, bifentrină, buprofezină, cartap, clorantiraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidină, ciflutrină, beta-ciflutrină, cihalotrină, lambda-cihalotrină, cipermitrină, ciromazină, deltametrină, dieldrină, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamidă, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizon, metomil, metopren, metoxifenoizidă, nitenpiram, nitiazină, novaluron, oxamil, pimetrozină, piretrină, piridaben, piridilil, piriproxifen, rianodină, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromezifen, tebufenozidă, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodiu, tralometrină, triazamat, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus și o delta-endotoxină încapsulată de *Bacillus thuringiensis*.
 55

Pentru variantele de realizare în care sunt unul sau folosite mai multe componente de amestecare raportul de greutate ale acestor diverse componente (în total) față de compusul

5 cu Formula 1 de obicei este între aproximativ 1:3000 și aproximativ 3000:1. De menționat sunt raporturile de greutate între aproximativ 1:300 și aproximativ 300:1 (de exemplu raporturile între aproximativ 1:30 și aproximativ 30:1). Un specialist în domeniu poate ușor determina prin experiențe simple cantitățile biologice efective ale ingredientelor active necesare pentru spectrul dorit al activității biologice. Este evident că includerea acestor componente adiționale poate mări spectrul dăunătorilor nevertebrați combătuți în comparație cu compusul cu Formula 1 folosit singur.

10 În anumite circumstanțe, combinații ale unui compus conform prezentei invenții cu alți compuși sau agenți (ex. ingrediente active) biologic activi (în special de combatere a dăunătorilor nevertebrați) pot avea un efect (ex. sinergic) mai mare decât aditiv. Reducerea cantității ingredientelor active ce ajung în mediul înconjurător în timpul ce asigură combaterea efectivă a dăunătorilor întotdeauna este dorită. Când apare sinergismul ingredientelor active de combatere a dăunătorilor nevertebrați în norme de aplicare ce asigură nivele satisfăcătoare din punct de vedere agronomic de combatere a dăunătorilor nevertebrați, astfel de combinații pot fi avantajoase pentru a reduce costul de producere a culturilor și a scădea impactul negativ asupra mediului înconjurător.

15 De menționat este combinația unui compus cu Formula 1 cu cel puțin un alt ingredient activ de combatere a dăunătorilor nevertebrați. În special de menționat este o astfel de combinație în care alt ingredient activ de combatere a dăunătorilor nevertebrați are alt mod de acțiune în comparație cu compusul cu Formula 1. În anumite circumstanțe, o combinație cu cel puțin un alt ingredient activ de combatere a dăunătorilor nevertebrați ce are un spectru similar de combatere, dar un alt mod de acțiune va fi în special avantajoasă pentru administrarea rezistenței. Astfel, o compoziție conform prezentei invenții poate conține suplimentar o cantitate biologic efectivă de cel puțin un ingredient activ de combatere a dăunătorilor nevertebrați adițional cu un spectru similar de combatere, dar cu mod de acțiune diferit. Contactul plantei modificate genetic pentru a exprima compusul dăunătorului nevertebrat (ex. proteină) sau locului plantei cu o cantitate biologic efectivă a unui compus conform prezentei invenții, de asemenea, poate asigura un spectru mai larg de protecție și fi avantajos în administrarea rezistenței.

20 În Tabelul A sunt enumerate combinații specifice ale unui compus cu Formula 1 cu alți agenți de combatere a dăunătorilor nevertebrați ilustrative pentru amestecuri, compoziții și procedee conform prezentei invenții. În prima coloană a Tabelului A sunt enumerate agenți de combatere a dăunătorilor nevertebrați specifici (ex., "Abamectin" în rândul unu). În a doua coloană a Tabelului A sunt enumerate modurile de acțiune (dacă se cunosc) sau clasa chimică a agenților de combatere a dăunătorilor nevertebrați. În a treia coloană a Tabelului A sunt enumerate varianta(e) limitelor raporturilor de greutate la care agentul de combatere a dăunătorilor nevertebrați poate fi aplicat față de un compus cu Formula 1, un N-oxid sau o sare a sa (ex., "50:1 până la 1:50" de abamectin față de un compus cu Formula 1 după greutate). Astfel, de exemplu, rândul unu al Tabelului A în special dezvăluie că combinația unui compus cu Formula 1 cu abamectin poate fi aplicată în raport de greutate între 50:1 până la 1:50. Restul randurilor din Tabelul A sunt construite în mod similar. Suplimentar e de menționat că în Tabelul A sunt enumerate combinații ale unui compus cu Formula 1 cu alți agenți de combatere a dăunătorilor nevertebrați ilustrative pentru amestecuri, compoziții și procedee conform prezentei invenții și include variante suplimentare a limitelor raporturilor de greutate pentru norme de aplicare.

Tabelul A

Agentul de combatere a dăunătorilor nevertebrați	Modul de acțiune sau clasa chimică	Raportul de masă tipic
Abamectin	lactone macrociclice	50:1 până la 1:50
Acetamiprid	neonicotinoide	150:1 până la 1:200
Amitraz	liganzi receptori de octopamină	200:1 până la 1:100
Avermectin	lactone macrociclice	50:1 până la 1:50
Azadiractin	antagoniști ai ecdizinelor	100:1 până la 1:120

MD 4157 B1 2012.03.31

75

Beta-ciflutrină	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Bifentrină	modulatori ai canalului de sodiu	100:1 până la 1:10
Buprofezină	inhibitori ai sintezei de chitină	500:1 până la 1:50
Cartap	analogi de nereistoxină	100:1 până la 1:200
Clorantlaniliprol	liganzi receptori de rianodină	100:1 până la 1:120
Clorfenapir	inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali	300:1 până la 1:200
Clorpirifos	inhibitori de colinesterază	500:1 până la 1:200
Clotianidină	neonicotinoide	100:1 până la 1:400
Ciflutrină	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Cihalotrină	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Cipermetrină	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Ciromazină	inhibitori ai sintezei de chitină	400:1 până la 1:50
Deltametrină	modulatori ai canalului de sodiu	50:1 până la 1:400
Dieldrină	insecticide ciclodiene	200:1 până la 1:100
Dinotefuran	neonicotinoide	150:1 până la 1:200
Diofenolan	inhibitori ai năpârlirii	150:1 până la 1:200
Emamectin	lactone macrociclice	50:1 până la 1:10
Endosulfan	insecticide ciclodiene	200:1 până la 1:100
Esfenvalerat	modulatori ai canalului de sodiu	100:1 până la 1:400
Etiprol	blocatori ai canalului de clorură GABA-regulat	200:1 până la 1:100
Fenotiocarb		150:1 până la 1:200
Fenoxicarb	imitatori ai hormonului juvenil	500:1 până la 1:100
Fenvalerat	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Fipronil	blocatori ai canalului de clorură GABA-regulat	150:1 până la 1:100
Flonicamidă		200:1 până la 1:100
Flubendiamidă	liganzi receptori de rianodină	100:1 până la 1:120
Flufenoxuron	inhibitori ai sintezei de chitină	200:1 până la 1:100
Hexaflumuron	inhibitori ai sintezei de chitină	300:1 până la 1:50
Hidrametilnon	inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali	150:1 până la 1:250
Imidacloprid	neonicotinoide	1000:1 până la 1:1000
Indoxacarb	modulatori ai canalului de sodiu	200:1 până la 1:50
Lambda-cihalotrină	modulatori ai canalului de sodiu	50:1 până la 1:250
Lufenuron	inhibitori ai sintezei de chitină	500:1 până la 1:250
Metaflumizon		200:1 până la 1:200

Metomil	inhibitori de colinesterază	500:1 până la 1:100
Metopren	imitatori ai hormonului juvenil	500:1 până la 1:100
Metoxifenoizidă	agoniști ai ecdizoneilor	50:1 până la 1:50
Nitenpiram	neonicotinoide	150:1 până la 1:200
Nitiazină	neonicotinoide	150:1 până la 1:200
Novaluron	inhibitori ai sintezei de chitină	500:1 până la 1:150
Oxamil	inhibitori de colinesterază	200:1 până la 1:200
Pimetrozină		200:1 până la 1:100
Piretrină	modulatori ai canalului de sodiu	100:1 până la 1:10
Piridaben	inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali	200:1 până la 1:100
Piridalil		200:1 până la 1:100
Piriproxifen	imitatori ai hormonului juvenil	500:1 până la 1:120
Rianodină	liganzi receptori de rianodină	100:1 până la 1:120
Spinetoram	lactone macrociclice	150:1 până la 1:100
Spinosad	lactone macrociclice	500:1 până la 1:10
Spiridiclofen	inhibitori ai biosintezei lipidice	200:1 până la 1:200
Spiromezifen	inhibitori ai biosintezei lipidice	200:1 până la 1:200
Tebufenozidă	agoniști ai ecdizoneilor	500:1 până la 1:250
Tiacloprid	neonicotinoide	100:1 până la 1:200
Tiametoxam	neonicotinoide	1250:1 până la 1:1000
Tiodicarb	inhibitori de colinesterază	500:1 până la 1:400
Tiosultap-sodiu		150:1 până la 1:100
Tralometrină	modulatori ai canalului de sodiu	150:1 până la 1:200
Triazamat	inhibitori de colinesterază	250:1 până la 1:100
Triflumuron	inhibitori ai sintezei de chitină	200:1 până la 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	agenți biologici	50:1 până la 1:10
<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxină	agenți biologici	50:1 până la 1:10
NPV (ex., Gemstar)	agenți biologici	50:1 până la 1:10

- Una din variantele agenților de combatere a dăunătorilor nevertebrați (ex., insecticide și acaricide) pentru amestecare cu compuși conform prezentei invenții includ modulatori ai canalului de sodiu, cum ar fi bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfen valeratul, fenvaleratul, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina și tralometrina; inhibitori de colinesterază, cum ar fi clorpirifosul, metomilul, oxamilul, tiodicarb și triazamatul; neonicotinoide, cum ar fi acetamipridul, clotianidina, dinotefuranul, imidaclopridul, nitenpiramul, nitiazina, tiaclopridul și tiametoxamul; lactone macrociclice insecticide, cum ar fi spinetoramul, spinosadul, abamectinul, avermectinul și emamectinul; blockerii canalului de clorură GABA-regulat (acid γ -aminobutiric), cum ar fi endosulfanul, etiprolul și fipronilul; inhibitori ai sintezei de chitină, cum ar fi buprofezinul, ciromazina, flufenoxuronul, hexaflumuronul, lufenuronul, novaluronul, noviflumuronul și triflumuronul; imitatori ai hormonului juvenil, cum ar fi diofenolanul, fenoxicarb, metoprenul și piriproxifenul; liganzi receptori de octopamină, cum ar fi amitrazul; antagoniști ai ecdizoneilor, cum ar fi azadiractinul, metoxifenoizida și tebufenoizida; liganzi receptori de rianodină, cum ar fi rianodina, diamide antranilice, cum ar fi

clorantranilipirrolul (vezi Brevetul U.S. 6,747,047, Publicațiile PCT WO 2003/015518 și WO 2004/067528) și flubendiamida (vezi Brevetul U.S. 6,603,044); analogi de nereistoxină, cum ar fi cartapul; inhibitori ai transportului de electroni mitocondriali, cum ar fi clorfenapirul, hidrametilnonul și piridabenul; inhibitori ai biosintezei lipidice, cum ar fi spirodiclofenul și spiromesifenul; insecticide ciclodiene cum ar fi dieldrina; ciflumetofenul; fenotiocarb; flonicamida; metaflumizonul; pirafluprolul; piridalilul; piriprolul; pimetrozina; spirotetramatul și tiosultap-sodiu. Una din variantele de realizare a agenților biologici pentru amestecare cu compușii conform prezentei invenții include nucleopolihedrovirusul, cum ar fi HzNPV și AfNPV; *Bacillus thuringiensis* și delta-endotoxina încapsulată de *Bacillus thuringiensis*, cum ar fi Cellcap, MPV și MPVII; precum și insecticide virale apărute natural sau modificate genetic ce includ membrii din familia *Baculoviridae*, precum și fungi entomofagi. De menționat este compoziția conform prezentei invenții, în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din Agenții de Combatere a dăunătorilor nevertebrați enumerați în Tabelul A de mai sus. De asemenea de menționat este compoziția conform prezentei invenții în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa constituită din cipermetrină, cihalotrină, ciflutrină, beta-ciflutrină, esfenvalerat, fenvalerat, tralometrină, fenotiocarb, metomil, oxamil, tiodicarb, acetamiprid, clotianidină, imidacloprid, tiametoxam, tiacloprid, indoxacarb, spinosad, abamectin, avermectin, emamectin, endosulfan, etiprol, fipronil, flufenoxuron, triflumuron, diofenolan, piriproxifen, pimetrozină, amitraz, *Bacillus thuringiensis aisawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, deltaendotoxină *Bacillus thuringiensis* și fungi entomofagi.

Raporturile de greutate ale unui compus, inclusiv un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa, față de agentul de combatere a dăunătorilor nevertebrați adițional de obicei este între 1000:1 și 1:1000, una din variantele de realizare fiind între 500:1 și 1:500, altă variantă de realizare fiind între 250:1 și 1:200 și o variantă de realizare fiind între 100:1 și 1:50.

Mai jos în Tabelul B sunt enumerate variante de realizare a compozițiilor specifice ce conțin un compus cu Formula 1 (numerele compușilor se referă la compușii din Tabelul de indexuri A-C) și un agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați adițional.

Tabelul B

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
A- 1	1	și	Abamectin	B- 1	2	și	Abamectin
A-2	1	și	Acetamiprid	B-2	2	și	Acetamiprid
A-3	1	și	Amitraz	B-3	2	și	Amitraz
A-4	1	și	Avermectin	B-4	2	și	Avermectin
A-5	1	și	Azadiractin	B-5	2	și	Azadiractin
A-6	1	și	Beta-ciflutrină	B-6	2	și	Beta-ciflutrină
A-7	1	și	Bifentrină	B-7	2	și	Bifentrină
A-8	1	și	Buprofezină	B-8	2	și	Buprofezină
A-9	1	și	Cartap	B-9	2	și	Cartap
A-10	1	și	Clorantraniliprol	B-10	2	și	Clorantraniliprol
A-11	1	și	Clorfenapir	B-11	2	și	Clorfenapir
A- 12	1	și	Clorpirifos	B- 12	2	și	Clorpirifos
A-13	1	și	Clotianidină	B-13	2	și	Clotianidină
A-14	1	și	Ciflutrină	B-14	2	și	Ciflutrină
A-15	1	și	Cihalotrină	B-15	2	și	Cihalotrină
A- 16	1	și	Cipermetrină	B- 16	2	și	Cipermetrină
A-17	1	și	Ciromazină	B-17	2	și	Ciromazină
A-18	1	și	Deltametrină	B-18	2	și	Deltametrină
A-19	1	și	Dieldrină	B-19	2	și	Dieldrină
A-20	1	și	Dinotefuran	B-20	2	și	Dinotefuran
A-21	1	și	Diofenolan	B-21	2	și	Diofenolan
A-22	1	și	Emamectin	B-22	2	și	Emamectin
A-23	1	și	Endosulfan	B-23	2	și	Endosulfan
A-24	1	și	Esfenvalerat	B-24	2	și	Esfenvalerat
A-25	1	și	Etiprol	B-25	2	și	Etiprol
A-26	1	și	Fenotiocarb	B-26	2	și	Fenotiocarb
A-27	1	și	Fenoxicarb	B-27	2	și	Fenoxicarb
A-28	1	și	Fenvalerat	B-28	2	și	Fenvalerat
A-29	1	și	Fipronil	B-29	2	și	Fipronil
A-30	1	și	Flonicamidă	B-30	2	și	Flonicamidă
A-31	1	și	Flubendiamidă	B-31	2	și	Flubendiamidă
A-32	1	și	Flufenoxuron	B-32	2	și	Flufenoxuron
A-33	1	și	Hexaflumuron	B-33	2	și	Hexaflumuron
A-34	1	și	Hidrametilnon	B-34	2	și	Hidrametilnon
A-35	1	și	Imidacloprid	B-35	2	și	Imidacloprid
A-36	1	și	Indoxacarb	B-36	2	și	Indoxacarb
A-37	1	și	Lambdacihalotrină	B-37	2	și	Lambdacihalotrină
A-38	1	și	ă	B-38	2	și	Lufenuron
A-39	1	și	Lufenuron	B-39	2	și	Metaflumizon
A-40	1	și	Metaflumizon	B-40	2	și	Metomil
A-41	1	și	Metomil	B-41	2	și	Metopren
A-42	1	și	Metopren	B-42	2	și	Metoxifenozidă
A-43	1	și	Metoxifenozidă	B-43	2	și	Nitenpiram
A-44	1	și	Nitenpiram	B-44	2	și	Nitiazină
A-45	1	și	Nitiazină	B-45	2	și	Novaluron
A-46	1	și	Novaluron	B-46	2	și	Oxamil
A-47	1	și	Oxamil	B-47	2	și	Pimetrozină
A-48	1	și	Pimetrozină	B-48	2	și	Piretrină
A-49	1	și	Piretrină	B-49	2	și	Piridaben
A-50	1	și	Piridaben	B-50	2	și	Piridalil

MD 4157 B1 2012.03.31

79

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
A-51	1	și	Piridalil	B-51	2	și	Piriproxifen
A-52	1	și	Piriproxifen	B-52	2	și	Rianodină
A-53	1	și	Rianodină	B-53	2	și	Spinetoram
A-54	1	și	Spinetoram	B-54	2	și	Spinosad
A-55	1	și	Spinosad	B-55	2	și	Spiridiclofen
A-56	1	și	Spiridiclofen	B-56	2	și	Spiromezifen
A-57	1	și	Spiromezifen	B-57	2	și	Tebufenozidă
A-58	1	și	Tebufenozidă	B-58	2	și	Tiacloprid
A-59	1	și	Tiacloprid	B-59	2	și	Tiametoxam
A-60	1	și	Tiametoxam	B-60	2	și	Tiodicarb
A-61	1	și	Tiodicarb	B-61	2	și	Tiosultap-sodiu
A-62	1	și	Tiosultap-sodiu	B-62	2	și	Tralometrină
A-63	1	și	Tralometrină	B-63	2	și	Triazamat
A-64	1	și	Triazamat	B-64	2	și	Triflumuron
A-65	1	și	Triflumuron	B-65	2	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-66	2	și	<i>Bacillus thuringiensis</i> deltaendotoxină
A-67	1	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-67	2	și	NPV (ex., Gemstar)
C- 1	101	și	deltaendotoxină	D- 1	104	și	Abamectin
C-2	101	și	NPV (ex., Gemstar)	D-2	104	și	Acetamiprid
C-3	101	și	Abamectin	D-3	104	și	Amitraz
C-4	101	și	Acetamiprid	D-4	104	și	Avermectin
C-5	101	și	Amitraz	D-5	104	și	Azadiractin
C-6	101	și	Avermectin	D-6	104	și	Betaciflutrină
C-7	101	și	Azadiractin	D-7	104	și	Bifentrină
C-8	101	și	Beta-iflutrină	D-8	104	și	Buprofezină
C-9	101	și	Bifentrină	D-9	104	și	Cartap
C-10	101	și	Buprofezină	D-10	104	și	Clorantraniliprol
C-11	101	și	Cartap	D-11	104	și	Clorfenapir
C-12	101	și	Clorantraniliprol	D- 12	104	și	Clorpirifos
C-13	101	și	Clorfenapir	D-13	104	și	Clotianidină
C-14	101	și	Clorpirifos	D-14	104	și	Ciflutrină
C-15	101	și	Clotianidină	D-15	104	și	Cihalotrină
C-16	101	și	Ciflutrină	D- 16	104	și	Cipermetrină
C-17	101	și	Cihalotrină	D-17	104	și	Ciromazină
C-18	101	și	Cipermetrină	D-18	104	și	Deltametrină
C-19	101	și	Ciromazină	D-19	104	și	Dieldrină
C-20	101	și	Deltametrină	D-20	104	și	Dinotefuran
C-21	101	și	Dieldrină	D-21	104	și	Diofenolan
C-22	101	și	Dinotefuran	D-22	104	și	Emamectin
C-23	101	și	Diofenolan	D-23	104	și	Endosulfan
C-24	101	și	Emamectin	D-24	104	și	Esfenvalerat
C-25	101	și	Endosulfan	D-25	104	și	Etiprol
C-26	101	și	Esfenvalerat	D-26	104	și	Fenotiocarb
C-27	101	și	Etiprol	D-27	104	și	Fenoxicarb
C-28	101	și	Fenotiocarb	D-28	104	și	Fenvalerat
C-29	101	și	Fenoxicarb	D-29	104	și	Fipronil
C-30	101	și	Fenvalerat	D-30	104	și	Flonicamidă
C-31	101	și	Fipronil	D-31	104	și	Flubendiamidă
C-32	101	și	Flonicamidă	D-32	104	și	Flufenoxuron
C-33	101	și	Flubendiamidă	D-33	104	și	Hexaflumuron
C-34	101	și		D-34	104	și	Hidrametilnon
C-35	101	și		D-35	104	și	Imidacloprid

MD 4157 B1 2012.03.31

80

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
C-36	101	și	Flufenoxuron	D-36	104	și	Indoxacarb
C-37	101	și	Hexaflumuron	D-37	104	și	Lambda-cihalotrină
C-38	101	și	Hidrametilnon	D-38	104	și	Lufenuron
C-39	101	și	Imidacloprid	D-39	104	și	Metaflumizon
C-40	101	și	Indoxacarb	D-40	104	și	Metomil
C-41	101	și	Lambda-	D-41	104	și	Metopren
C-42	101	și	cihalotrină	D-42	104	și	Metoxifenoizidă
C-43	101	și	Lufenuron	D-43	104	și	Nitenpiram
C-44	101	și	Metaflumizon	D-44	104	și	Nitiazină
C-45	101	și	Metomil	D-45	104	și	Novaluron
C-46	101	și	Metopren	D-46	104	și	Oxamil
C-47	101	și	Metoxifenoizidă	D-47	104	și	Pimetrozină
C-48	101	și	Nitenpiram	D-48	104	și	Piretrină
C-49	101	și	Nitiazină	D-49	104	și	Piridaben
C-50	101	și	Novaluron	D-50	104	și	Piridalil
C-51	101	și	Oxamil	D-51	104	și	Piriproxifen
C-52	101	și	Pimetrozină	D-52	104	și	Rianodină
C-53	101	și	Piretrină	D-53	104	și	Spinetoram
C-54	101	și	Piridaben	D-54	104	și	Spinosad
C-55	101	și	Piridalil	D-55	104	și	Spiridiclofen
C-56	101	și	Piriproxifen	D-56	104	și	Spiromezifen
C-57	101	și	Rianodină	D-57	104	și	Tebufenozidă
C-58	101	și	Spinetoram	D-58	104	și	Tiacloprid
C-59	101	și	Spinosad	D-59	104	și	Tiametoxam
C-60	101	și	Spiridiclofen	D-60	104	și	Tiodicarb
C-61	101	și	Spiromezifen	D-61	104	și	Tiosultap-sodiu
C-62	101	și	Tebufenozidă	D-62	104	și	Tralometrină
C-63	101	și	Tiacloprid	D-63	104	și	Triazamat
C-64	101	și	Tiametoxam	D-64	104	și	Triflumuron
C-65	101	și	Tiodicarb	D-65	104	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	101	și	Tiosultap-sodiu	D-66	104	și	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
			Tralometrină				
C-67	101	și	Triazamat	D-67	104	și	NPV (ex., Gemstar)
E- 1	8	și	Triflumuron	F-1	10	și	Abamectin
E-2	8	și	<i>Bacillus</i>	F-2	10	și	Acetamiprid
E-3	8	și	<i>thuringiensis</i>	F-3	10	și	Amitraz
E-4	8	și	Delta-endotoxina	F-4	10	și	Avermectin
E-5	8	și	de <i>Bacillus</i>	F-5	10	și	Azadiractin
E-6	8	și	<i>thuringiensis</i>	F-6	10	și	Beta-ciflutrină
E-7	8	și	NPV (ex.,	F-7	10	și	Bifentrină
E-8	8	și	Gemstar)	F-8	10	și	Buprofezină
E-9	8	și	Abamectin	F-9	10	și	Cartap
E-10	8	și	Acetamiprid	F-10	10	și	Clorantilaniprol
E-11	8	și	Amitraz	F-11	10	și	Clorfenapir
E- 12	8	și	Avermectin	F- 12	10	și	Clorpirifos
E-13	8	și	Azadiractin	F-13	10	și	Clotianidină
E-14	8	și	Beta-ciflutrină	F-14	10	și	Ciflutrină
E-15	8	și	Bifentrină	F-15	10	și	Cihalotrină
E- 16	8	și	Buprofezină	F- 16	10	și	Cipermetrină
E-17	8	și	Cartap	F-17	10	și	Ciromazină
E-18	8	și	Clorantilaniprol	F-18	10	și	Deltametrină
E-19	8	și	Clorfenapir	F-19	10	și	Dieldrină
E-20	8	și	Clorpirifos	F-20	10	și	Dinotefuran

MD 4157 B1 2012.03.31

81

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
E-21	8	și	Clotianidină	F-21	10	și	Diofenolan
E-22	8	și	Ciflutrină	F-22	10	și	Emamectin
E-23	8	și	Cihalotrină	F-23	10	și	Endosulfan
E-24	8	și	Cipermetrină	F-24	10	și	Esfenvalerat
E-25	8	și	Ciromazină	F-25	10	și	Etiprol
E-26	8	și	Deltametrină	F-26	10	și	Fenotiocarb
E-27	8	și	Dieldrină	F-27	10	și	Fenoxicarb
E-28	8	și	Dinotefuran	F-28	10	și	Fenvalerat
E-29	8	și	Diofenolan	F-29	10	și	Fipronil
E-30	8	și	Emamectin	F-30	10	și	Flonicamidă
E-31	8	și	Endosulfan	F-31	10	și	Flubendiamidă
E-32	8	și	Esfenvalerat	F-32	10	și	Flufenoxuron
E-33	8	și	Etiprol	F-33	10	și	Hexaflumuron
E-34	8	și	Fenotiocarb	F-34	10	și	Hidrametilnon
E-35	8	și	Fenoxicarb	F-35	10	și	Imidacloprid
E-36	8	și	Fenvalerat	F-36	10	și	Indoxacarb
E-37	8	și	Fipronil	F-37	10	și	Lambda-cihalotrină
E-38	8	și	Flonicamidă	F-38	10	și	Lufenuron
E-39	8	și	Flubendiamidă	F-39	10	și	Metaflumizon
E-40	8	și	Flufenoxuron	F-40	10	și	Metomil
E-41	8	și	Hexaflumuron	F-41	10	și	Metopren
E-42	8	și	Hidrametilnon	F-42	10	și	Metoxifenoizidă
E-43	8	și	Imidacloprid	F-43	10	și	Nitenpiram
E-44	8	și	Indoxacarb	F-44	10	și	Nitiazină
E-45	8	și	Lambda-	F-45	10	și	Novaluron
E-46	8	și	cihalotrină	F-46	10	și	Oxamil
E-47	8	și	Lufenuron	F-47	10	și	Pimetrozină
E-48	8	și	Metaflumizon	F-48	10	și	Piretrină
E-49	8	și	Metomil	F-49	10	și	Piridaben
E-50	8	și	Metopren	F-50	10	și	Piridalil
E-51	8	și	Metoxifenoizidă	F-51	10	și	Piriproxifen
E-52	8	și	Nitenpiram	F-52	10	și	Rianodină
E-53	8	și	Nitiazină	F-53	10	și	Spinetoram
E-54	8	și	Novaluron	F-54	10	și	Spinosad
E-55	8	și	Oxamil	F-55	10	și	Spiridiclofen
E-56	8	și	Pimetrozină	F-56	10	și	Spiromezifen
E-57	8	și	Piretrină	F-57	10	și	Tebufenozidă
E-58	8	și	Piridaben	F-58	10	și	Tiacloprid
E-59	8	și	Piridalil	F-59	10	și	Tiametoxam
E-60	8	și	Piriproxifen	F-60	10	și	Tiodicarb
E-61	8	și	Rianodină	F-61	10	și	Tiosultap-sodiu
E-62	8	și	Spinetoram	F-62	10	și	Tralometrină
E-63	8	și	Spinosad	F-63	10	și	Triazamat
E-64	8	și	Spiridiclofen	F-64	10	și	Triflumuron
E-65	8	și	Spiromezifen	F-65	10	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>
E-66	8	și	Tebufenozidă	F-66	10	și	<i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxină
E-67	8	și	Tiacloprid	F-67	10	și	NPV (ex., Gemstar)
G- 1	41	și	Tiametoxam	H- 1	51	și	Abamectin
G-2	41	și	Tiodicarb	H-2	51	și	Acetamiprid
G-3	41	și	Tiosultap-sodiu	H-3	51	și	Amitraz
G-4	41	și	Tralometrină	H-4	51	și	Avermectin
G-5	41	și	Triazamat	H-5	51	și	Azadiractin
		și	Triflumuron				

MD 4157 B1 2012.03.31

82

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
G-6	41	și	<i>Bacillus</i>	H-6	51	și	Beta-ciflutrină
G-7	41	și	<i>thuringiensis</i>	H-7	51	și	Bifentrină
G-8	41	și	<i>Bacillus</i>	H-8	51	și	Buprofezină
G-9	41	și	<i>thuringiensis</i>	H-9	51	și	Cartap
G-10	41	și	delta-endotoxină	H-10	51	și	Clorantilaniliprol
G-11	41	și	NPV (ex.,	H-11	51	și	Clorfenapir
G-12	41	și	Gemstar)	H-12	51	și	Clorpirifos
G-13	41	și	Abamectin	H-13	51	și	Clotianidină
G-14	41	și	Acetamiprid	H-14	51	și	Ciflutrină
G-15	41	și	Amitraz	H-15	51	și	Cihalotrină
G-16	41	și	Avermectin	H-16	51	și	Cipermetrină
G-17	41	și	Azadiractin	H-17	51	și	Ciromazină
G-18	41	și	Beta-ciflutrină	H-18	51	și	Deltametrină
G-19	41	și	Bifentrină	H-19	51	și	Dieldrină
G-20	41	și	Buprofezină	H-20	51	și	Dinotefuran
G-21	41	și	Cartap	H-21	51	și	Diofenolan
G-22	41	și	Clorantilaniliprol	H-22	51	și	Emamectin
G-23	41	și	Clorfenapir	H-23	51	și	Endosulfan
G-24	41	și	Clorpirifos	H-24	51	și	Esfenvalerat
G-25	41	și	Clotianidină	H-25	51	și	Etiprol
G-26	41	și	Ciflutrină	H-26	51	și	Fenotiocarb
G-27	41	și	Cihalotrină	H-27	51	și	Fenoxicarb
G-28	41	și	Cipermetrină	H-28	51	și	Fenvalerat
G-29	41	și	Ciromazină	H-29	51	și	Fipronil
G-30	41	și	Deltametrină	H-30	51	și	Flonicamidă
G-31	41	și	Dieldrină	H-31	51	și	Flubendiamidă
G-32	41	și	Dinotefuran	H-32	51	și	Flufenoxuron
G-33	41	și	Diofenolan	H-33	51	și	Hexaflumuron
G-34	41	și	Emamectin	H-34	51	și	Hidrametilnon
G-35	41	și	Endosulfan	H-35	51	și	Imidacloprid
G-36	41	și	Esfenvalerat	H-36	51	și	Indoxacarb
G-37	41	și	Etiprol	H-37	51	și	Lambda-cihalotrină
G-38	41	și	Fenotiocarb	H-38	51	și	Lufenuron
G-39	41	și	Fenoxicarb	H-39	51	și	Metaflumizon
G-40	41	și	Fenvalerat	H-40	51	și	Metomil
G-41	41	și	Fipronil	H-41	51	și	Metopren
G-42	41	și	Flonicamidă	H-42	51	și	Metoxifenoizidă
G-43	41	și	Flubendiamidă	H-43	51	și	Nitenpiram
G-44	41	și	Flufenoxuron	H-44	51	și	Nitiazină
G-45	41	și	Hexaflumuron	H-45	51	și	Novaluron
G-46	41	și	Hidrametilnon	H-46	51	și	Oxamil
G-47	41	și	Imidacloprid	H-47	51	și	Pimetrozină
G-48	41	și	Indoxacarb	H-48	51	și	Piretrină
G-49	41	și	Lambda-cihalotrină	H-49	51	și	Piridaben
G-50	41	și	Lufenuron	H-50	51	și	Piridilil
G-51	41	și	Metaflumizon	H-51	51	și	Piriproxifen
G-52	41	și	Metomil	H-52	51	și	Rianodină
G-53	41	și	Metopren	H-53	51	și	Spinetoram
G-54	41	și	Metoxifenoizidă	H-54	51	și	Spinosad
G-55	41	și	Nitenpiram	H-55	51	și	Spiridiclofen
G-56	41	și	Nitiazină	H-56	51	și	Spiromezifen
G-57	41	și	Novaluron	H-57	51	și	Tebufenozidă
G-58	41	și		H-58	51	și	Tiacloprid

Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați	Nr. amestec.	Nr. comp.	și	Agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați
G-59	41	și	Oxamil	H-59	51	și	Tiametoxam
G-60	41	și	Pimetrozină	H-60	51	și	Tiodicarb
G-61	41	și	Piretrină	H-61	51	și	Tiosultap-sodiu
G-62	41	și	Piridaben	H-62	51	și	Tralometrină
G-63	41	și	Piridalil	H-63	51	și	Triazamat
G-64	41	și	Piriproxifen	H-64	51	și	Triflumuron
G-65	41	și	Rianodină	H-65	51	și	<i>Bacillus thuringiensis</i>
G-66	41	și	Spinetoram	H-66	51	și	Delta-endotoxină de <i>Bacillus thuringiensis</i>
G-67	41	și	Spinosad				
			Spiridiclofen	H-67	51	și	NPV (ex., Gemstar)
			Spiromezifen				
			Tebufenozidă				
			Tiacloprid				
			Tiametoxam				
			Tiodicarb				
			Tiosultap-sodiu				
			Tralometrină				
			Triazamat				
			Triflumuron				
			<i>Bacillus thuringiensis</i>				
			Delta-endotoxină de <i>Bacillus thuringiensis</i>				
			NPV (ex., Gemstar)				

Amestecurile specifice enumerate în Tabelul B de obicei combină un compus cu Formula 1 și un alt agent de combatere a dăunătorilor nevertebrați în raporturile specificate în Tabelul A.

- 5 Dăunătorii nevertebrați sunt combătuți în aplicațiile agronomice și neagronomice prin aplicarea unui sau mai multor compuși conform prezentei invenții, de obicei în formă de o compoziție, în cantitate biologic efectivă, habitatului dăunătorilor, inclusiv la locul de infestare agronomic și/sau neagronomic, pe suprafața ce urmează a fi protejată, sau direct dăunătorilor care urmează a fi combătuți.

- 10 Astfel, prezenta invenție se referă la un procedeu pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați în aplicațiile agronomice și/sau neagronomice, care cuprinde contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului lui cu o cantitate biologic efectivă de unul sau mai mulți compuși conform prezentei invenții, sau cu o compoziție ce conține cel puțin unul din acești compuși, sau cu o compoziție ce conține cel puțin unul din acești compuși și o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional.
- 15 Exemple ale compozițiilor corespunzătoare ce conțin un compus conform prezentei invenții și o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional includ compozițiile granulare în care compusul activ adițional este prezent în aceeași granulă cu compusul conform prezentei invenții sau în granule separate de cele ale compusului conform prezentei invenții.

- 20 Contactul dăunătorilor nevertebrați cu un compus sau o compoziție conform prezentei invenții pentru protecția culturilor de câmp realizează prin tratarea semințelor culturii înainte de semănat, frunzișului (ex., frunzelor, tulpinii, florilor, fructelor) plantelor de cultură sau solului sau altor medii de creștere înainte sau după ce planta a fost plantată.

- 25 Una din variantele de realizare a procedurii de contact este pulverizarea. Alternativ, o compoziție granulară ce conține un compus conform prezentei invenții poate fi aplicată pe frunzișul plantei sau în sol. Compușii conform prezentei invenții de asemenea pot fi

utilizați efectiv prin absorbția de către plante, la contactul plantei cu o compoziție care conține un compus conform prezentei invenții, prin impregnarea solului cu o soluție lichidă, o soluție granulară în sol, prin tratarea pepinierii sau printr-o baie de transplanturi. De menționat este o compoziție conform prezentei invenții sub formă de soluție lichidă cu care se impregnează solul.

De asemenea de menționat este un procedeu de combatere a dăunătorilor nevertebrați care cuprinde contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului lui cu o cantitate biologic efectivă de un compus conform prezentei invenții sau cu o compoziție ce conține o cantitate biologic efectivă de un compus conform prezentei invenții. Suplimentar de menționat este un procedeu în care mediul este solul, iar compoziția este aplicată în sol prin impregnarea solului. Suplimentar de menționat este că compușii conform prezentei invenții sunt de asemenea efectivi prin aplicare localizată la locul infestării. Alte procedee de contact cuprind aplicarea unui compus sau a unei compoziții conform prezentei invenții prin pulverizare cu acțiune directă sau posterioară, soluții de pulverizare aeriană, geluri, îngrășarea semințelor, microcapsulare, absorbții sistematice, momeli, fixarea etichetelor, pilule (cocoloși de mâncare), pulverizatoare de aerosol, fumiganți, aerosoli, prafuri și multe altele.

Una din variantele de realizare a procedurii de contact este granula, bastonul sau tableta de îngrășămintă artificiale dimensional stabilă ce conține un compus sau o compoziție conform prezentei invenții. Compușii conform prezentei invenții pot fi de asemenea impregnați în materialele pentru confecționarea dispozitivelor pentru combaterea nevertebratelor (ex., plasele pentru insecte). Compușii conform prezentei invenții sunt de asemenea utili în tratamentul semințelor pentru protecția semințelor de dăunătorii nevertebrați. În contextul dezvoltării și revendicării prezentei invenții, tratamentul semințelor înseamnă contactul semințelor cu o cantitate biologic efectivă de un compus conform prezentei invenții, care de obicei este preparat ca o compoziție conform prezentei invenții. Acest tratament al semințelor protejează semințele de dăunătorii nevertebrați și, în general, poate de asemenea proteja rădăcinile și alte părți ale plantei ce se află în contact cu solul de exemplu ale răsadului ce se dezvoltă de la semința ce germinază. Tratamentul semințelor poate de asemenea asigura protecția frunzei prin translocarea compusului conform prezentei invenții sau a celui de-al doilea ingredient activ în planta ce se dezvoltă. Tratamentul semințelor poate fi aplicat tuturor tipurilor de semințe, inclusiv celor de la care vor germina plantele genetic modificate pentru a exprima caracteristici speciale. Exemplele reprezentative includ acele plante ce exprimă proteine toxice pentru dăunătorii nevertebrați, cum ar fi toxina *Bacillus thuringiensis* sau cele ce exprimă rezistență erbicidă, cum ar fi glifosat acetiltransferaza, care asigură rezistență la glifosat.

Unul din procedeele de tratament al semințelor este prin pulverizare sau stropire a semințelor cu un compus conform prezentei invenții (ex., sub formă de compoziție preparată) înainte de semănarea semințelor. Compozițiile preparate pentru tratamentul semințelor în general conțin o substanță peliculogenă sau un agent adeziv. De aceea, de obicei o compoziție de îngrășare a semințelor conform prezentei invenții conține o cantitate biologic efectivă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa, și o substanță peliculogenă sau un agent adeziv. Semințele pot fi îngrășate prin pulverizare cu un concentrat de suspensie fluidă direct în razorul de semințe urmată de uscarea semințelor. Alternativ, semințele pot fi pulverizate cu alte tipuri de preparate, cum ar fi prafurile umectate, soluțiile, suspoemulsiile, concentratele emulsionabile și emulsiile în apă. Acest procedeu este în special util pentru aplicarea peliculei pe semințe. Diverse mașini și procedee sunt la dispoziția unui specialist în domeniu. Procedeele utile includ acelea enumerate în P. Kusters și alții, *Seed Treatment: Progress și Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57, și referințele specificate în ea.

Semințele tratate de obicei conțin un compus conform prezentei invenții în cantități cuprinse între aproximativ 0.1 g și 1 kg la 100 kg de semințe (ex., de la aproximativ 0.0001 până la 1% din greutatea semințelor înainte de tratament). O suspensie fluidă preparată pentru tratamentul semințelor de obicei conține de la aproximativ 0.5 până la aproximativ 70% ingredient activ, de la aproximativ 0.5 până la aproximativ 30% adeziv peliculogen, de la aproximativ 0.5 până la aproximativ 20% dispersant, de la 0 până la

aproximativ 5% îngroșător, de la 0 până la aproximativ 5% pigment și/sau colorant, de la 0 până la aproximativ 2% antispumant, de la 0 până la aproximativ 1% conservant, și de la 0 până la aproximativ 75% de diluant lichid volatil. Compușii conform prezentei invenții pot fi încorporați într-o compoziție de momeală care se consumă de către

5 dăunătorii nevertebrați sau este folosită cu un dispozitiv, cum ar fi capcana, stația de momeală, și altele asemenea. Această compoziție de momeală poate fi sub formă de granule care conțin (a) ingrediente active, și anume o cantitate biologic activă de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid, sau sare a sa; (b) una sau mai multe substanțe nutritive, (c) opțional un atractant, și (d) opțional unul sau mai mulți umectanți. De menționat sunt

10 granulele sau compozițiile de momeală care conțin între aproximativ 0.001-5% ingredient activ, aproximativ 40-99% substanță nutritivă și/sau atractant; și opțional aproximativ 0,05-10% umectanți; care sunt efective în combaterea dăunătorilor nevertebrați de sol în raporturi de aplicare foarte joase, în particular în doze de ingredient activ care sunt letale mai degrabă prin ingestie decât prin contact direct. Unele substanțe nutritive vor funcționa

15 atât în calitate de sursă de hrană cât și în calitate de atractant. Substanțele nutritive includ carbohidrații, proteinele și lipidele. Exemple de substanțe nutritive sunt făina vegetală, zahărul, amidonul, grăsimea animală, uleiul vegetal, extractele de drojdie și laptele uscat. Exemple de atractanți sunt agenții mirositori și aromatizatori, cum ar fi extractele de plante sau fructe, parfumul, sau alt component animal sau vegetal, feromonii sau alți agenți cunoscuți să atragă un dăunător nevertebrat-țintă. Exemple de umectanți, în special

20 agenți de reținere a umidității, sunt glicolii și alți polioli, glicerina și sorbitolul.

De menționat este o compoziție de momeală (și un procedeu cu utilizarea acestei compoziții de momeală) folosită pentru combaterea cel puțin a unui dăunător nevertebrat selectat din grupa constituită din furnici, termite și gândaci de bucătărie. Un dispozitiv

25 pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați poate conține prezenta compoziție de momeală și un corp prevăzut pentru plasarea compoziției de momeală, care are cel puțin un orificiu executat de mărimea care să permită trecerea dăunătorului nevertebrat prin el și accesul la compoziția de momeală dintr-un loc din afara corpului, și în care corpul este prevăzut suplimentar să fie amplasat în sau aproape de locul de activitate posibilă sau

30 cunoscută a dăunătorului nevertebrat.

Compușii prezentei invenții pot fi aplicați fără adjuvanți, dar cel mai frecvent aplicabil este un preparat care include unul sau mai multe ingrediente active cu purtători, diluanți și agenți activi de suprafață utili și posibili de combinat cu un produs alimentară în funcție de utilizarea prevăzută. Unul din procedeele de aplicare cuprinde pulverizarea unei dispersii

35 apoase sau soluții de ulei rafinat de un compus conform prezentei invenții. Combinațiile cu uleiuri pulverizabile, concentrațiile de uleiuri pulverizabile, agenții adezivi, adjuvanții, alți solvenți, și sinergiști, cum ar fi butoxidul de piperonil adeseori sporesc eficacitatea compușilor. Pentru utilizările neagronomice aceste soluții de pulverizare pot fi aplicate din containere pulverizatoare, cum ar fi o cutie de tinichea, o butelie sau alt container fie

40 prin intermediul unei pompe, fie prin degajarea lor dintr-un container sub presiune, ex. o cutie de tinichea cu soluție de aerosol sub presiune. Aceste compoziții de pulverizare pot avea diverse forme, de exemplu, aerosoli, spume, fumuri sau ceață. Aceste compoziții de pulverizare pot include suplimentar substanțe explozive, spumanți, etc. după caz. De menționat este o compoziție de pulverizare care conține o cantitate biologic efectivă de un

45 compus sau o compoziție conform prezentei invenții și un purtător. Una din variantele de realizare a acestei compoziții de pulverizare conține o cantitate biologic efectivă de un compus sau o compoziție conform prezentei invenții și o substanță explozivă. Substanțele explozive reprezentante includ, dar nu sunt limitate la, metan, etan, propan, butan, izobutan, butenă, pentan, izopentan, neopentan, pentenă, hidrofluorocarboni,

50 clorofluorocarboni, dimetil eter și amestecurile celor menționate.

De menționat este o compoziție de pulverizare (și un procedeu cu utilizarea acestei compoziții pentru pulverizare dintr-un container pulverizator) folosită pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați selectați din grupa constituită din țânțari, musculițe, păduchi negri, musculițe de toamnă, tăunii-renilor, tăunii-cailor, viespi, gărgăuni, căpușe,

55 păianjeni, furnici, țânțari mici și altele asemenea, individual sau în combinație.

Aplicările neagronomice se referă la protecția animalelor, în special a celor vertebrate, mai special a vertebratelor homeoterme (ex., mamiferele sau păsările), în particular a

5 mamiferelor de dăunătorii nevertebrați paraziți prin administrarea unei cantități efective din punct de vedere parazit (în special biologic efectivă) de un compus conform prezentei invenții, de obicei în formă de o compoziție preparată pentru uz veterinar, animalului care urmează a fi protejat. De aceea de menționat este un procedeu de protecție a animalului care cuprinde administrarea a unei cantități efective din punct de vedere parazit a unui compus conform prezentei invenții.

În contextul dezvăluirii și revendicărilor prezentei invenții termenii "paraziticid" și "paraziticide" se referă la efectele vizibile asupra dăunătorilor nevertebrați paraziți pentru asigurarea protecției animalului de dăunător. Efectele paraziticide de obicei se referă la 10 diminuarea apariției sau a activității dăunătorului nevertebrat parazit-țintă. Aceste efecte asupra dăunătorilor includ necroza, moartea, creșterea întârziată, mobilitatea scăzută sau abilitatea scăzută de a rămâne pe sau în animalul-gazdă, hrănirea redusă sau inhibarea reproducerii. Aceste efecte asupra dăunătorilor nevertebrați paraziți asigură combaterea (inclusiv prevenirea, reducerea sau eliminarea) infestării sau infectării parazite a 15 animalului. Exemple de dăunătorii nevertebrați paraziți combătuți prin administrarea unei cantități paraziticide efective de un compus conform prezentei invenții animalului care urmează a fi protejat includ ectoparaziții (artropodele, acarienii, etc.) și endoparaziții (helminții, ex., nematozii, trematodele, cestodele, acantocefalii, etc.). În special, compuşii conform prezentei invenții sunt efectivi împotriva ectoparaziților, inclusiv: muștele, cum ar fi *Haematobia (Lyperosia) irritans*, *Stomoxys calcitrans*, *Simulium* sp., *Glossina* sp., 20 *Hydrotaea irritans*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Morellia simplex*, *Tabanus* sp., *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia Cuprina*, *Calliphora* sp., *Protophormia* sp., *Oestrus ovis*, *Culicoides* sp., *Hippobosca equine*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* și *Gastrophilus naslis*; păduchii, cum ar fi *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, 25 *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* și *Trichodectes canis*; căpușele-oilor, cum ar fi *Melophagus ovinus*; căpușele, cum ar fi *Psoroptes* sp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* sp., *Notoedres cati*, *Trombicula* sp. și *Otodectes cyanotis*; căpușe, cum ar fi sp. *Ixodes* sp., *Boophilus* sp., *Rhipicephalus* sp., *Amblyomma* sp., *Dermacentor* sp., *Hyalomma* sp. și *Haemaphysalis* sp.; puricii, cum ar fi *Ctenocephalides felis* (puricele-de-pisică) și *Ctenocephalides canis* (puricele-de-caine).

Aplicațiile neagronomice în sectorul veterinar se efectuează prin mijloace convenționale, cum ar fi administrarea enterală în formă, de exemplu, de tablete, capsule, băuturi, preparate de îmbibare, granule, paste, boluri, procedee de hrănire, supozitoare; 35 sau prin administrare parenterală, cum ar fi injectarea (inclusiv intramusculară, subcutanată, intravenoasă, intraperitoneală), implanturi; prin administrare nazală; prin administrare locală, de exemplu prin imersiune sau scufundare, pulverizare, spălare, pulverizarea prafului sau aplicarea pe o suprafață mică a animalului, și prin articole, cum ar fi zgărzile, cerceii, benzile pentru coadă, benzile pentru membre sau căpestre ce conțin 40 compuşii sau compoziții conform prezentei invenții. De obicei o compoziție parazitoidă conform prezentei invenții conține un amestec de un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa, cu unul sau mai mulți purtători acceptabili din punct de vedere farmaceutic sau veterinar ce conțin excipienți și substanțe auxiliare selectate în dependență de calea de administrare aleasă (ex., administrare orală, locală sau parenterală, cum ar fi injectarea) și 45 în conformitate cu practica uzuală. Suplimentar, un purtător potrivit este selectat în temeiul compatibilității cu unul sau mai multe ingrediente active ale compoziției, inclusiv din așa considerente, cum ar fi stabilitatea relativă la pH și gradul de umiditate. De aceea de menționat este compoziția pentru protecția animalelor de dăunătorii nevertebrați paraziți ce conține o cantitate parazitoidă efectivă de un compus conform prezentei invenții și cel puțin un purtător. Pentru administrare parenterală, inclusiv prin injectare 50 intravenoasă, intramusculară și subcutanată, un compus conform prezentei invenții poate fi preparat sub formă de suspensie, soluție sau emulsie în agenți purtători uleioși sau apoși, și poate conține substanțe complementare, cum ar fi agenții de suspensie și/sau dispersanți, stabilizatori și/sau dispersanți. Compozițiile farmaceutice pentru injectare 55 includ soluțiile apoase cu forme solubile în apă ale ingredientelor active (ex., o sare a unui compus activ), de preferință soluții-tampon fiziologic compatibile ce conțin alți excipienți și substanțe auxiliare cunoscute în domeniul preparării farmaceutice.

Pentru administrare orală, inclusiv în soluții (în forma cea mai potrivită pentru absorbție), emulsii, suspensii, pastile, geluri, capsule, tablete, prafuri în pastile, granule, blocuri de reținere a rumenului și nutreț/apă/bulgăre de sare, un compus conform prezentei invenții poate fi preparat cu lianți/agenți de umplutură cunoscuți în domeniu ca
 5 potriviți pentru compozițiile administrate oral, cum ar fi zaharozele (ex., lactoză, zaharoză, manită, sorbitol), amidonul (ex., amidon de porumb, amidon de grâu, amidon de orez, amidon de cartofi), celuloza și derivații ei (ex., metilceluloză, carboximetilceluloză, etilhidroxiceluloză), derivații de proteină (ex., zeină, gelatină) și polimerii sintetici (ex., alcool polivinilic, polivinilpirolidonă). Dacă se dorește, lubrifianti
 10 (ex., stearat de magneziu), agenți de dezintegrare (ex., polivinilpirolidonă reticulată, geloză, acid alginic) și coloranți sau pigmenți pot fi adăugați. Pastele și gelurile deseori de asemenea conțin adezivi (ex., acacia, acid alginic, bentonită, celuloză, gumă xantan, alumosilicat de magneziu coloidal) pentru a ajuta menținerea compoziției în contact cu cavitatea bucală și ca aceasta să nu fie ușor vărsată.

15 Dacă compozițiile paraziticide sunt în formă de nutrețuri combinate, un purtător este, de obicei, selectat din nutrețuri de înaltă calitate, cereale de nutreț sau concentrate de proteine. Aceste compoziții ce conțin nutrețuri combinate pot, suplimentar la ingredientele paraziticide active, conține aditivi ce mențin sănătatea și creșterea animalelor, îmbunătățesc calitatea cărnii animalelor destinate tăierii sau sunt altfel
 20 folosite pentru creșterea animalelor. Acești aditivi pot include, de exemplu, vitamine, antibiotice, preparate chimioterapeutice, bacteriostatice, fungistatice, coccidiostatice și hormoni.

Compușii conform prezentei invenții s-au adeverit a avea proprietăți favorabile farmacocinetice și farmacodinamice în urma administrării sistematice orale și ingestiei.
 25 Astfel, după ce concentratele paraziticide efective ale compuşilor conform prezentei invenții nimeresc în sânge, acestea protejează animalul tratat de așa dăunători, cum ar fi puricii, căpușele și păduchi. De aceea de menționat este o compoziție pentru protecția animalelor de dăunători nevertebrați paraziți administrată oral (ex., suplimentar la cantitatea parazitoid efectivă de un compus conform invenției, unul sau mai mulți
 30 purtători sunt selectați din lianți și agenți de umplutură potriviți pentru administrare orală și purtători de nutrețuri combinate).

Preparatele pentru administrare locală sunt de obicei sub formă de praf, cremă, suspensie, soluție de pulverizare, emulsie, spumă, pastă, aerosol, unguent, alifie sau gel. În special preparatul folosit local reprezintă o soluție solubilă în apă, care poate fi sub
 35 formă de concentrat ce se diluează înainte de utilizare. Compozițiile paraziticide potrivite pentru administrare locală de obicei conțin un compus conform prezentei invenții și unul sau mai mulți purtători potriviți pentru folosire locală. În aplicațiile locale ale compoziției paraziticide exteriorului unui animal ca linie sau punct (ex. tratament "exact"), se așteaptă că ingredientul activ se va strămuta pe suprafața animalului pentru a acoperi cea mai
 40 mare sau chiar toată suprafața exterioară. Ca urmare, animalul tratat este în special protejat de la dăunători nevertebrați, care se hrănesc cu epiderma animalului, cum ar fi căpușele, puricii și păduchi. De aceea preparatele pentru administrare locală deseori conțin cel puțin un solvent pentru facilitarea transportului ingredientului activ pe piele și/sau pătrunderea în epiderma animalului. Solvenții folosiți uzual ca purtători în aceste
 45 preparate includ glicol propilene, parafine, substanțe aromatice, ester, cum ar fi miristatul de izopropil, glicol eteri, și alcooli, cum ar fi etanolul și n-propanolul.

Rata de aplicare necesară pentru combaterea efectivă (ex. "cantitate biologică efectivă") va depinde de așa factori ca speciile nevertebratelor care vor fi combătuți, ciclul de viață a dăunătorului, stadiul de viață, mărimea lui, localizarea, anotimpul, planta-gazdă
 50 sau animalul-gazdă, comportamentul de hrănire, comportamentul de împerechere, umiditatea mediului, temperatura și altele asemenea. În circumstanțe normale, normele de aplicare de aproximativ 0.01 până la 2 kg de ingrediente active per hectar sunt suficiente pentru combaterea dăunătorilor în ecosistemele agronomice, dar cel puțin 0.0001 kg/hectar poate fi suficient sau cel mult 8 kg/hectar poate fi necesar. Pentru aplicațiile
 55 neagronomice, normele efective de folosire vor varia de la aproximativ 1.0 până la aproximativ 50 mg/ metru pătrat, dar cel puțin 0.1 mg/ metru pătrat poate fi suficient sau cel mult 150 mg/ metru pătrat poate fi necesar. Un specialist în domeniu va determina

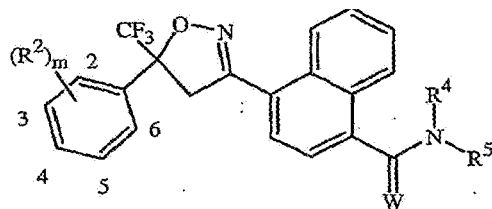
ușor cantitatea biologic efectivă necesară pentru atingerea nivelului dorit de combatere a dăunătorilor nevertebrați.

In general pentru utilizare veterinară, un compus cu Formula 1, un *N*-oxid sau o sare a sa, este administrat în cantități parazitocid efective animalului care urmează a fi protejat de dăunători nevertebrați paraziți. Cantitatea parazitocid efectivă este cantitatea ingredientului activ necesar pentru obținerea efectului observabil de diminuare a apariției sau activității dăunătorului nevertebrat parazit-țintă. Un specialist în domeniu va recunoaște că doza parazitocid efectivă poate varia pentru diverși compuși și compoziții conform prezentei invenții, efectul parazitocid dorit și durată, speciile dăunătorilor nevertebrați-țintă, animalul care urmează a fi protejat, modul de aplicare și altele asemenea, iar cantitatea necesară pentru a obține un anumit rezultat poate fi determinată prin experiențe simple.

Pentru administrare orală animalelor homeoterme, doza zilnică de un compus conform prezentei invenții de obicei variază între de la aproximativ 0.01 mg/kg până la aproximativ 100 mg/kg, în special de la aproximativ 0.5 mg/kg până la aproximativ 100 mg/kg, de greutatea corpului animalului. Pentru administrare locală (ex., dermică), lichidele și soluțiile de pulverizare de obicei conțin de la aproximativ 0.5 ppm până la aproximativ 5000 ppm, în special de la aproximativ 1 ppm până la aproximativ 3000 ppm de compus conform prezentei invenții.

Următoarele abrevieri sunt folosite în Tabelele de Indexuri A-C de mai jos: *i* – *izo*, *t* – *tert*, *c* – *ciclo*, Me – metil, Et – etil, *c*-Pr – ciclopropil și *t*-Bu – *tert*-butil, Naphthyl – naftalenil, (*R*) sau (*S*) – chiralitate absolută a centrului de carbon asimetric, "Ex." – "Exemplu" și este urmată de un număr ce indică care exemplu al compusului este preparat. În Tabelul de Indexuri A, (R^2)_m se referă la combinația de (R^2)_n cu exemple de CR² pentru B¹, B² și B³.

TABELUL DE INDEXURI A



în care m reprezintă 1, 2, 3, 4 sau 5.

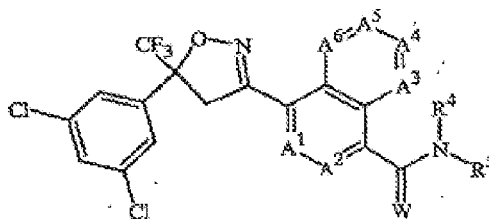
Compus	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	p.t.	(°C)
1 (Ex. 1)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CF ₃	**	
2 (Ex. 2)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**	
3	O	H	H	CH ₂ CF ₃	*	
4	O	H	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
5	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -phenyl	*	
6	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -3-pyridinyl	*	
7	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -4-pyridinyl	*	
8 (Ex. 3)	S	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**	
9	O	3-Cl, 5-Cl	Me	Et	*	
10	O	3-Cl, 5-Cl	H	Et	*	
11	O	3-Cl, 5-Cl	CO ₂ Me	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
12	O	3-Cl, 5-Cl	H	Me	*	
13	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	*	
14	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ ·HCl	*	
15	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-phenyl	*	
16	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃) ₂	*	
17	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CH ₃)-phenyl	*	
18	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	*	
19	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ C=CH	*	
20	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -o-Pr	*	
21	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)-2-pyridinyl	*	
22	O	3-Me, 5-Me	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
23	O	3-Cl, 4-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
24	O	3-F, 5-F	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
25	O	3-Cl	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
26	O	3-Br, 5-Br	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*	
27	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-2-naphthyl	*	
28	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-NO ₂ -phenyl)	*	
29	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CO ₂ CH ₃)-phenyl	*	
30	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-Cl-phenyl)	*	
31	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-F-phenyl)	*	
32	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*	
33	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*	
34	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)- <i>i</i> -Bu	*	
35	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OH	*	
36	O	3-Cl, 5-Cl	H	H	*	
37	O	3-Cl, 5-Cl		-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	*	

Compus	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	p.t. (°C)
38	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
39	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
40	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
41	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	*
42	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Et	*
43	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ H	*
44	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Na	*
45	O	3-Cl, 5-Cl	H	NHC(=O)Me	*
46	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-phenyl	*
47	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂	*
48	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(Me)CO ₂ Me	*
49	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(<i>t</i> -Pr)CO ₂ Me	*
50	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₅ NH ₂	*
51	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CONHCH ₂ CF ₃	*
52	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CN	*
53	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-2-pyridinyl	*

* Vezi Tabelul de Indexuri D pentru datele ¹H RMN. ** Vezi Exemplele pentru datele ¹H RMN.

5

TABELUL DE INDEXURI B



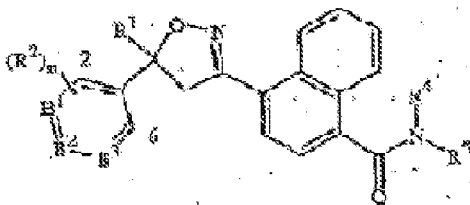
Compus	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	p.t. (°C)
101	O	N	CH	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
102	O	CH	N	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*

Compus	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	p.t. (°C)
103 (Ex. 4)	O	CH	CH	N	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
104 (Ex. 5)	O	CH	CH	CH	N	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	**
105	O	CH	CH	CH	CH	N	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
106	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
107	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
108	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
109	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
110	O	CH	OCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*
111	O	CH	OCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ CF ₃	*

* Vezi Tabelul de Indexuri D pentru datele ¹H RMN. ** Vezi Exemplele pentru datele ¹H RMN.

5

TABELUL DE INDEXURI C



Compus	B ¹	B ²	B ³	(R ³) _n	R ⁴	R ⁵	p.t. (°C)
101	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ CF ₃	*
102	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ -2-pyridinyl	*

* Vezi Tabelul de Indexuri D pentru datele ¹H RMN

10

TABELUL DE INDEXURI D

Nr. compus Datele ¹H RMN (soluție în CDCl₃ dacă nu este specificat)

3	δ 8,67 (d, 1H), 8,06 (d, 1H) 7,66...7,45 (m, 7H), 7,39 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 6,78 (br s 1H), 4,19 (d, 1H), 4,15 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
4	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H) 8,35 (d, 1H), 7,71...7,44 (m, 11H), 7,35 (d, 1H) 7,20 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,95 (d, 1H).
5	δ 8,78 (d, 1H) 8,27 (d, 1H) 7,64...7,30 (m, 12H) 6,40 (br t 1H), 4,71 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
6	δ 8,72 (d, 1H) 8,53 (d, 1H) 8,49 (dd, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,60...7,52 (m, 4H), 7,45 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,27 (m, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H) 4,21 (d, 1H) 3,86 (d, 1H).
7	δ 8,72 (d, 1H) 8,50 (d, 2H), 8,19 (d, 1H) 7,61...7,54 (m, 4H), 7,47 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (d, 2H), 7,02 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
9	δ 8,88 (m, 1H) 7,83 (m, 1H), 7,66...7,40 (m, 7H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,80-3,66 și 3,09 (m, 2H), 3,22... 2,74 (s, 3H) 1,01 și 1,36 (t, 3H).
10	δ 8,78 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,64...7,42 (m, 7H), 6,08 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (m, 2H), 1,31 (t, 3H).
11	δ 8,92 (d, 1H), 8,63 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,74...7,53 (m, 7H), 7,45 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,29 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,43 (s, 3H).
12	δ 8,77 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,63...7,55 (m, 5H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,18 (br s 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,07 (d, 3H).
13	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,39...7,62 (m, H), 6,77 (br s 1H), 4,22 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (q, 2H), 2,53 (t, 2H), 2,25 (s, 6H).
15	δ 8,63 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,47...7,16 (m, 9H), 6,78 (dd, 1H), 5,34 (m, 1H), 4,14 (dd, 1H), 3,80 (dd, 1H), 1,60 (d, 3H).

MD 4157 B1 2012.03.31

92

- 16 δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,66...7,45 (m, 7H), 5,87 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,33 (d, 6H).
- 17 δ 8,77 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,63...7,30 (m, 12H), 6,30 (d, 1H), 5,44 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,67 (d, 1H).
- 5 18 δ 8,60 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,67...7,45 (m, 7H), 6,15 (br t, 1H), 5,99 (m, 1H), 5,31 (d, 1H), 5,24 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
- 19 δ 8,77 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,64...7,56 (m, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,38 (br t, 1H), 4,33 (dd, 2H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,32 (t, 1H).
- 20 δ 8,82 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,67...7,45 (m, 7H), 6,14 (br s 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,42 (dd, 2H), 1,12 (m, 1H), 0,59 (m, 2H), 0,32 (m, 2H).
- 10 21 δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,67...7,57 (m, 6H), 7,50 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,21 (dd, 1H), 5,45 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
- 22 δ 8,85 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,36 (d, 1H), 7,72...7,57 (m, 4H), 7,51 (d, 1H), 7,45 (br t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,25 (s, 2H), 7,21 (dd, 1H), 7,07 (s, 1H), 4,85 (d, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,38 (s, 6H).
- 15 23 δ 8,81 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,78...7,46 (m, 9H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
- 24 δ 8,83 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,74...7,22 (m, H), 6,91 (dt, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
- 20 25 δ 8,83 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,73...7,41 (m, 10H), 7,37 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,86 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
- 26 δ 8,82 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,76 (s, 2H), 7,74...7,59 (m, H), 7,52 (d, 1H), 7,44 (br t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
- 25 27 δ 8,76 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,87...7,36 (m, 14H), 6,46 (d, 1H), 5,59 (m, 1H), 4,20 (d, 1H), 3,84 (d, 1H), 1,73 (d, 3H).
- 28 δ 8,77 (d, 1H), 8,23 (d, 2H), 8,14 (dd, 1H), 7,66...7,44 (m, 9H), 6,45 (d, 1H), 5,47 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
- 30 29 δ 8,80 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,66...7,37 (m, H), 6,99 (d, 1H), 5,87 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,80 (s, 3H).
- 30 δ 8,76 (d, 1H), 8,14 (dd, 1H), 7,63...7,35 (m, 11H), 6,35 (d, 1H), 5,38 (m, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 1,62 (d, 3H).
- 31 δ 8,76 (d, 1H), 8,16 (dd, 1H), 7,64...7,38 (m, 9H), 7,07 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 5,41 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,64 (d, 3H).
- 35 32 δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67...7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
- 33 δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67...7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
- 40 34 δ 8,80 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,68...7,46 (m, 7H), 5,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,24 (d, 3H), 1,01 (s, 9H).
- 35 δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,52...7,44 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s, br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).
- 45 36 δ 8,75 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,63...7,35 (m, 7H), 6,69 (br s, 1H), 6,32 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
- 38 δ 8,79 (m, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,64...7,12 (m, 11H), 6,29 (dd, 1H), 5,50 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,82 (m, 2H), 2,24 (m, 1H), 2,05 (m, 1H), 1,91 (m, 2H).
- 39 δ 8,80 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,65...7,25 (m, H), 6,28 (d, 1H), 5,79 (q 1H), 4,24 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,92...3,07 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
- 50 40 δ 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67...7,26 (m, H), 6,26 (d, 1H), 5,80 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,09...2,93 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
- 41 δ 8,82 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,67...7,46 (m, 7H), 6,40 (br t, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,75 (q, 2H), 3,63 (dd, 2H), 3,39 (s, 3H).

MD 4157 B1 2012.03.31

93

- 42 δ 8,84 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67...7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1 H), 4,33 (d, 2H), 4,29 (q, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,34 (t, 3H).
- 43 DMSO- d_6 : δ 9,02 (t, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,74...7,65 (m, 5H), 4,58 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,02 (d, 2H).
- 5 44 DMSO- d_6 : δ 8,86 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 7,96...7,67 (m, 8H), 4,61 (aparent s, 2H), 3,64 (d, 2H).
- 45 DMSO- d_6 δ 10,44 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,86 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,90 (t, 1H), 7,76 (m, 5H), 4,63 (d, 1H), 4,59 (d, 1H), 2,04 (s, 3H).
- 10 46 δ 10,45 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85...7,63 (m, 7H), 7,22 (t, 2H), 6,90 (d, 2H), 6,78 (t, 1H), 4,57 (aparent s, 2H).
- 47 δ 8,83 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,69...7,46 (m, 9H), 6,54 (br s, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,61 (q, 2H), 3,02 (t, 3H).
- 48 δ 8,83 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,68...7,46 (m, 7H), 6,54 (d, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 1,60 (d, 3H).
- 15 49 δ 8,84 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,70...7,46 (m, 7H), 6,46 (d, 1H), 4,91 (dd, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,36 (m, 1H), 1,10 (d, 3H), 0,99 (d, 3H).
- 50 DMSO- d_6 δ 8,79 (d, 1H), 8,71 (t, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,08 (br s, 2H), 7,90 (d, 1H), 7,84 (dd, 1 H), 7,73...7,66 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 4,54 (aparent s, 2H), 3,35 (m, 2H), 2,76 (m, 2H), 1,60 (m, 4H), 1,39 (m, 4H).
- 20 51 δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67...7,46 (m, 7H), 7,09 (m, 2H), 4,28 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
- 52 δ 8,79 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,68...7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).
- 25 53 δ 8,83 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,70...7,55 (m, 7H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,84 (dd, 1H), 6,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
- 101 δ 9,24 (d, 1H), 8,75 (s, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,82...7,70 (m, 3H), 7,64 (br s, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H).
- 102 δ 9,63 (d, 1H), 9,04 (br t, 1H), 8,93 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,69 (dd, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,31 (d, 1H), 3,94 (d, 1H).
- 30 105 δ 10,17 (s, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,73 (dt, 1H), 7,68 (br t, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
- 106 δ 8,95 (dd, 1H), 8,88 (dd, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,60...7,50 (m, 4H), 7,43 (t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,72 (d, 1H), 4,42 (d, 1H).
- 35 107 δ 8,89 (dd, 1H), 8,61 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,45 (m, 2H), 6,89 (br t, 1H), 4,68 (d, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,18 (m, 2H).
- 108 δ 9,41 (br s, 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).
- 40 109 δ 8,88 (d, 1H), 8,47 (dd, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,53 (s, 2H), 7,47 (m, 3H), 4,74 (m, 2H), 4,59 (d, 1H), 4,25 (d, 1H).
- 110 δ 8,75 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,55-7,35 (m, 5H), 7,31 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 4,82 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 2,44 (s, 3H).
- 45 111 δ 8,59 (d, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,36...7,44 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 6,80 (br t, 1H), 4,20 (d, 1H), 4,08 (m, 2H), 3,86 (d, 1H), 2,23 (s, 3H).
- 201 δ 8,71 (d, 1H), 8,48 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,55...7,64 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,74 (t, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,83 (d, 1H).
- 50 202 δ 8,79 (d, 1H), 8,50 (m, 2H), 8,35 (d, 1H), 7,50...7,72 (m, 7H), 7,47 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).

55

- 11 δ 8.92 (d, 1H), 8.63 (d, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.74-7.53 (m, 7H), 7.45 (t, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.23 (dd, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.29 (d, 1H), 3.92 (d, 1H), 3.43 (s, 3H).
- 12 δ 8.77 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.63-7.55 (m, 5H), 7.44 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 6.18 (br s, 1H), 4.23 (d, 1H), 3.87 (d, 1H), 3.07 (d, 3H).
- 13 δ 8.78 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 7.39-7.62 (m, H), 6.77 (br s, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.88 (d, 1H), 3.58 (q, 2H), 2.53 (t, 2H), 2.25 (s, 6H).
- 15 δ 8.63 (dd, 1H), 8.00 (dd, 1H), 7.56 (s, 2H), 7.47-7.16 (m, 9H), 6.78 (dd, 1H), 5.34 (m, 1H), 4.14 (dd, 1H), 3.80 (dd, 1H), 1.60 (d, 3H).
- 16 δ 8.80 (d, 1H), 8.25 (d, 1H), 7.66-7.45 (m, 7H), 5.87 (d, 1H), 4.41 (m, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.88 (d, 1H), 1.33 (d, 6H).
- 17 δ 8.77 (d, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.63-7.30 (m, 12H), 6.30 (d, 1H), 5.44 (m, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.86 (d, 1H), 1.67 (d, 1H).
- 18 δ 8.80 (d, 1H), 8.27 (d, 1H), 7.67-7.45 (m, 7H), 6.15 (br t, 1H), 5.99 (m, 1H), 5.31 (d, 1H), 5.24 (d, 1H), 4.25 (d, 1H), 4.17 (m, 2H), 3.88 (d, 1H).
- 19 δ 8.77 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.64-7.56 (m, 4H), 7.50 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 6.38 (br t, 1H), 4.33 (dd, 2H), 4.23 (d, 1H), 3.87 (d, 1H), 2.32 (t, 1H).
- 20 δ 8.82 (d, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.67-7.45 (m, 7H), 6.14 (br s, 1H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 3.42 (dd, 2H), 1.12 (m, 1H), 0.59 (m, 2H), 0.32 (m, 2H).
- 21 δ 8.82 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.34 (d, 1H), 7.72 (dt, 1H), 7.67-7.57 (m, 6H), 7.50 (d, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.21 (dd, 1H), 5.45 (m, 1H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 1.66 (d, 3H).
- 22 δ 8.85 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.72-7.57 (m, 4H), 7.51 (d, 1H), 7.45 (br t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.25 (s, 2H), 7.21 (dd, 1H), 7.07 (s, 1H), 4.85 (d, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.94 (d, 1H), 2.38 (s, 6H).
- 23 δ 8.81 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 7.78-7.46 (m, 9H), 7.36 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 4.85 (d, 2H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H).
- 24 δ 8.83 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.39 (d, 1H), 7.74-7.22 (m, H), 6.91 (dt, 1H), 4.87 (d, 2H), 4.27 (d, 1H), 3.90 (d, 1H).
- 25 δ 8.83 (d, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 7.73-7.41 (m, 10H), 7.37 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 4.86 (d, 2H), 4.26 (d, 1H), 3.92 (d, 1H).
- 26 δ 8.82 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.38 (d, 1H), 7.76 (s, 2H), 7.74-7.59 (m, H), 7.52 (d, 1H), 7.44 (br t, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.23 (dd, 1H), 4.87 (d, 2H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H).
- 27 δ 8.76 (d, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.87-7.36 (m, 14H), 6.46 (d, 1H), 5.59 (m, 1H), 4.20 (d, 1H), 3.84 (d, 1H), 1.73 (d, 3H).
- 28 δ 8.77 (d, 1H), 8.23 (d, 2H), 8.14 (dd, 1H), 7.66-7.44 (m, 9H), 6.45 (d, 1H), 5.47 (m, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.88 (d, 1H), 1.66 (d, 3H).
- 29 δ 8.80 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.66-7.37 (m, H), 6.99 (d, 1H), 5.87 (d, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.88 (d, 1H), 3.80 (s, 3H).
- 30 δ 8.76 (d, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.63-7.35 (m, 11H), 6.35 (d, 1H), 5.38 (m, 1H), 4.21 (d, 1H), 3.85 (d, 1H), 1.62 (d, 3H).
- 31 δ 8.76 (d, 1H), 8.16 (dd, 1H), 7.64-7.38 (m, 9H), 7.07 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.30 (d, 1H), 5.41 (m, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.86 (d, 1H), 1.64 (d, 3H).

- 32 δ 8.81 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.67-7.45 (m, 7H), 5.78 (d, 1H), 4.26 (d, 1H), 4.25 (m, 1H), 3.88 (d, 1H), 1.63 (m, 2H), 1.30 (d, 3H), 1.04 (t, 3H).
- 33 δ 8.81 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.67-7.45 (m, 7H), 5.78 (d, 1H), 4.26 (d, 1H), 4.25 (m, 1H), 3.88 (d, 1H), 1.63 (m, 2H), 1.30 (d, 3H), 1.04 (t, 3H).
- 34 δ 8.80 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.68-7.46 (m, 7H), 5.80 (d, 1H), 4.26 (d, 1H), 4.23 (m, 1H), 3.88 (d, 1H), 1.24 (d, 3H), 1.01 (s, 9H).
- 35 δ 8.65 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.55 (s, 2H), 7.52-7.44 (m, 7H), 7.27 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.93 (br t, 1H), 4.16 (d, 1H), 3.81 (d, 1H), 3.73 (s, br, 2H), 3.53 (m, 2H), 3.27 (br s, 1H).
- 36 δ 8.75 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.63-7.35 (m, 7H), 6.69 (br s, 1H), 6.32 (br s, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.86 (d, 1H).
- 38 δ 8.79 (m, 1H), 8.34 (d, 1H), 7.64-7.12 (m, 11H), 6.29 (dd, 1H), 5.50 (m, 1H), 4.22 (d, 1H), 3.87 (d, 1H), 2.82 (m, 2H), 2.24 (m, 1H), 2.05 (m, 1H), 1.91 (m, 2H).
- 39 δ 8.80 (d, 1H), 8.34 (d, 1H), 7.65-7.25 (m, 7H), 6.28 (d, 1H), 5.79 (q, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.87 (d, 1H), 3.92-3.07 (m, 2H), 2.77 (m, 1H), 1.99 (m, 1H).
- 40 δ 8.81 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 7.67-7.26 (m, 7H), 6.26 (d, 1H), 5.80 (q, 1H), 4.24 (d, 1H), 3.88 (d, 1H), 3.09-2.93 (m, 2H), 2.79 (m, 1H), 1.99 (m, 1H).
- 41 δ 8.82 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.67-7.46 (m, 7H), 6.40 (br t, 1H), 4.25 (d, 1H), 3.89 (d, 1H), 3.75 (q, 2H), 3.63 (dd, 2H), 3.39 (s, 3H).
- 42 δ 8.84 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 7.67-7.46 (m, 7H), 6.53 (br t, 1H), 4.33 (d, 2H), 4.29 (q, 2H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 1.34 (t, 3H).
- 43 DMSO- d_6 : δ 9.02 (t, 1H), 8.81 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.83 (t, 1H), 7.74-7.65 (m, 5H), 4.58 (d, 1H), 4.54 (d, 1H), 4.02 (d, 2H).
- 44 DMSO- d_6 : δ 8.86 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.96-7.67 (m, 8H), 4.61 (apparent s, 2H), 3.64 (d, 2H).
- 45 DMSO- d_6 : δ 10.44 (s, 1H), 10.10 (s, 1H), 8.86 (d, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.90 (t, 1H), 7.76 (m, 5H), 4.63 (d, 1H), 4.59 (d, 1H), 2.04 (s, 3H).
- 46 δ 10.45 (s, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.85-7.63 (m, 7H), 7.22 (t, 2H), 6.90 (d, 2H), 6.78 (t, 1H), 4.57 (apparent s, 2H).
- 47 δ 8.83 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 7.69-7.46 (m, 9H), 6.54 (br s, 1H), 4.27 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 3.61 (q, 2H), 3.02 (t, 3H).
- 48 δ 8.83 (d, 1H), 8.35 (d, 1H), 7.68-7.46 (m, 7H), 6.54 (d, 1H), 4.91 (m, 1H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 1.60 (d, 3H).
- 49 δ 8.84 (d, 1H), 8.34 (d, 1H), 7.70-7.46 (m, 7H), 6.46 (d, 1H), 4.91 (dd, 1H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.36 (m, 1H), 1.10 (d, 3H), 0.99 (d, 3H).
- 50 DMSO- d_6 : δ 8.79 (d, 1H), 8.71 (t, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.08 (br s, 2H), 7.90 (d, 1H), 7.84 (dd, 1H), 7.73-7.66 (m, 4H), 7.62 (d, 1H), 4.54 (apparent s, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.76 (m, 2H), 1.60 (m, 4H), 1.39 (m, 4H).
- 51 δ 8.82 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.67-7.46 (m, 7H), 7.09 (m, 2H), 4.28 (d, 2H), 4.25 (d, 1H), 3.96 (m, 2H), 3.88 (d, 1H).
- 52 δ 8.79 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.68-7.46 (m, 7H), 6.53 (br t, 1H), 4.46 (d, 2H), 4.26 (d, 1H), 3.89 (d, 1H).

53	δ 8.83 (d, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.70-7.55 (m, 7H), 7.50 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 6.84 (dd, 1H), 6.80 (d, 1H), 4.26 (d, 1H), 3.90 (d, 1H).
101	δ 9.24 (d, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 7.82-7.70 (m, 3H), 7.64 (br s, 1H), 7.58 (s, 2H), 7.44 (t, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 4.87 (d, 2H).
102	δ 9.63 (d, 1H), 9.04 (br t, 1H), 8.93 (d, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.57 (s, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.23 (dd, 1H), 4.85 (d, 2H), 4.31 (d, 1H), 3.94 (d, 1H).
105	δ 10.17 (s, 1H), 8.64 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.73 (dt, 1H), 7.68 (br t, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.56 (s, 2H), 7.46 (t, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 4.85 (d, 2H), 4.27 (d, 1H), 3.92 (d, 1H).
106	δ 8.95 (dd, 1H), 8.88 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.72 (dt, 1H), 7.60-7.50 (m, 4H), 7.43 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 4.85 (d, 2H), 4.72 (d, 1H), 4.42 (d, 1H).
107	δ 8.89 (dd, 1H), 8.61 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.55 (s, 2H), 7.45 (m, 2H), 6.89 (br t, 1H), 4.68 (d, 1H), 4.32 (d, 1H), 4.18 (m, 2H).
108	δ 9.41 (br s, 1H), 8.91 (dd, 1H), 8.70 (dd, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.75 (dt, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.57 (s, 2H), 7.47 (dd, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.24 (dd, 1H), 5.14 (d, 2H), 4.68 (d, 1H), 4.39 (d, 1H).
109	δ 8.88 (d, 1H), 8.47 (dd, 1H), 8.12 (br s, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.53 (s, 2H), 7.47 (m, 3H), 4.74 (m, 2H), 4.59 (d, 1H), 4.25 (d, 1H).
110	δ 8.75 (d, 1H), 8.42 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.68 (dt, 1H), 7.57 (s, 2H), 7.55-7.35 (m, 5H), 7.31 (s, 1H), 7.18 (dd, 1H), 4.82 (d, 2H), 4.25 (d, 1H), 3.90 (d, 1H), 2.44 (s, 3H).
111	δ 8.59 (d, 1H), 7.58 (s, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.36-7.44 (m, 2H), 7.10 (s, 1H), 6.80 (br t, 1H), 4.20 (d, 1H), 4.08 (m, 2H), 3.86 (d, 1H), 2.23 (s, 3H).
201	δ 8.71 (d, 1H), 8.48 (m, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.55-7.64 (m, 3H), 7.49 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.35 (dd, 1H), 6.74 (t, 1H), 4.24 (d, 1H), 4.17 (m, 2H), 3.83 (d, 1H).
202	δ 8.79 (d, 1H), 8.50 (m, 2H), 8.35 (d, 1H), 7.50-7.72 (m, 7H), 7.47 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 4.83 (d, 2H), 4.28 (d, 1H), 3.89 (d, 1H).

Datele ^1H RMN sunt în câmpul de jos ppm de la tetrametilsilan. Cuplurile sunt desemnate prin (s)-singlet, (d)-dublet, (t)-triplet, (q)-cvartet, (m)-multiplet, (dd)- dubletul dubletelor, (dt)- dubletul tripletelor, (br s)- singlet larg, (br t)- triplet larg.

5

EXEMPLE BIOLOGICE ALE INVENȚIEI

Următoarele Teste demonstrează eficacitatea combaterii anumitor dăunători cu ajutorul compușilor conform prezentei invenții. "Eficacitatea combaterii" reprezintă inhibarea dezvoltării dăunătorului nevertebrat (inclusiv mortalitatea) care cauzează hrănire esențial redusă. Protecția obținută prin combaterea dăunătorilor cu ajutorul compușilor, totuși, nu se limitează la aceste specii. Vezi Tabelele de Indexuri A-C pentru descrierile compușilor.

10

TESTUL A

Pentru evaluarea combaterii moliei de varză (*Plutella xylostella*) modelul de testare a fost constituit dintr-un container mic deschis cu o plantă de ridiche de 12-14 zile în interior. Aceasta a fost infestată preliminar cu 50 larve nou-născute care au fost distribuite în modelul de testare prin crupe de miez de știulete folosind un instrument bazuca. Larvele s-au deplasat pe planta de testare după distribuire în modelul de testare.

15

Compușii pentru testare au fost preparați folosind o soluție care conține 10% de acetonă, 90% de apă și 300 ppm de agent activ de suprafață neionic X-77™ Spreader Lo-Foam Formula, care conține alchilarilpolioxietilenă, acizi grași liberi, glicoli și izopropanol (Loveland Industries Inc., Greeley, Colorado, USA).

20

Compușii preparați au fost introduși în 1 mL de lichid printr-o capsulă de pulverizare SUI2 cu un corp de 1/8 JJ executat la comandă (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, USA) poziționat cu 1.27 cm (0.5 inci) mai sus de partea superioară a fiecărui model de testare.

25

Toți compușii experimentali în aceste teste au fost pulverizați la 250 și/sau 50 ppm și replicați de trei ori. După pulverizarea compusului de testare preparat, fiecare model de

testare a fost lăsat pentru uscare timp de 1 oră și după aceasta un căpăcel negru protector a fost amplasat pe partea superioară.

Modelele de testare au fost ținute pentru 6 zile într-o cameră de creștere la 25°C și umiditatea relativă de 70%. Prejudiciul cauzat plantei prin hrănire a fost vizual evaluat pe baza frunzelor consumate, rata de mortalitate a dăunătorilor de asemenea a fost numărată și calculată pentru fiecare model.

Din compuşii cu Formula 1 testați, următorii au asigurat niveluri de eficacitate a combaterii dăunătorilor de la foarte bune la excelente (un prejudiciu prin hrănire de 20% sau mai puțin sau mortalitate de 80% sau mai mult): 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 38, 39, 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107*, 108*, 109*, 110, 111, 201 și 202.

* înseamnă niveluri de eficacitate a combaterii foarte bune la excelente observate doar la 250 ppm.

15 TESTUL B

Pentru evaluarea combaterii fluturelui-molie (*Spodoptera frugiperda*) modelul de testare a fost constituit dintr-un container mic deschis cu o plantă de porumb de 4-5 zile în interiorul lui. Aceasta a fost infestată preliminar (utilizând o mostră de miez) cu 10-15 larve de vârstă de 1 zi pe o bucată de rație pentru insecte. Compușii pentru testare au fost preparați și pulverizați la 250 și/sau 50 ppm așa cum este descris pentru Testul A și replicați de trei ori. După pulverizare, modelele de testare au fost menținute într-o cameră de creștere, apoi eficacitatea combaterii a fost apreciată pentru fiecare model de testare așa cum este descris pentru Testul A.

Din compuşii cu Formula 1 testați, următorii au asigurat niveluri de eficacitate a combaterii dăunătorilor de la foarte bune la excelente (un prejudiciu prin hrănire de 20% sau mai puțin sau mortalitate de 80% sau mai mult): 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 46, 49, 51, 101, 102, 103, 104, 106*, 107*, 110*, 111*, 201 și 202.

* înseamnă niveluri de eficiență a combaterii foarte bune la excelente observate doar la 250 ppm.

30 TESTUL C

Pentru evaluarea combaterii cicoriței cartofului (*Empoasca fabae* Horris) prin mijloace de contact și/sau sistemice, modelul de testare a fost constituit dintr-un container mic deschis cu o plantă de fasole Soleil (frunze inițiale răsărite) de 5-6 zile în interior.

A fost adăugat nisip alb deasupra solului, iar una din frunzele inițiale a fost tăiată până la introducere. Compușii de testare au fost preparați și pulverizați la 250 ppm și/sau 50 ppm și testul a fost replicat de trei ori așa cum este descris pentru Testul A.

După pulverizare, modelele de testare au fost lăsate pentru uscare timp de 1 oră înainte ca ele să fie infestate preliminar cu 5 cicorițe (insecte adulte de 18...21 zile). Un căpăcel protector negru protector a fost amplasat deasupra cilindrului. Modelele de testare au fost menținute timp de 6 zile într-o cameră de creștere la temperatura de 19...21°C și umiditatea relativă de 50-70 %. Eficacitatea combaterii pentru fiecare model de testare a fost apoi stabilită vizual prin mortalitatea insectelor.

Din compuşii cu Formula 1 testați următorii au asigurat niveluri de eficacitate a combaterii dăunătorilor de la foarte bune la excelente (mortalitate de 80% sau mai mult): 1, 2, 8, 10, 11, 14*, 15, 16, 18*, 19, 20, 21, 26, 28, 31, 32*, 34, 36, 38, 46*, 101, 102* și 106*.

* înseamnă niveluri de eficiență a combaterii foarte bune la excelente observate doar la 250 ppm.

50 TESTUL D

Pentru evaluarea combaterii tripsului-florilor occidental (*Frankliniella occidentalis*) prin mijloace de contact și/sau sistemice, modelul de testare a fost constituit dintr-un container mic deschis cu o plantă de fasole Soleil de 5-7 zile în interior. Compușii de testare au fost preparați și pulverizați la 250 ppm și/sau 50 ppm testul a fost replicat de trei ori așa cum este descris pentru Testul A.

După pulverizare, modelele de testare au fost lăsate pentru uscare timp de 1 oră, apoi 22-27 tripiși adulți au fost adăugați în fiecare model, iar un căpăcel negru protector a fost amplasat pe partea superioară.

- 5 Modelele de testare au fost menținute timp de 6 zile la temperatura de 25°C și umiditatea relativă de 45..55%. Rata de mortalitate împreună cu rata prejudiciului au fost evaluate pentru fiecare model de testare.

- 10 Din compușii cu Formula 1 testați, următorii au asigurat niveluri de eficacitate a combaterii dăunătorilor de la foarte bune la excelente (un prejudiciu prin hrănire de 20% sau mai puțin sau mortalitate de 80% sau mai mult): 1, 2, 8, 10, 11, 13*, 14*, 15*, 16, 18, 19, 20*, 21, 26, 32, 33*, 34*, 35, 39*, 41, 42, 45*, 46*, 47*, 48*, 49, 51, 101 și 104.

* înseamnă niveluri de eficiență a combaterii foarte bune la excelente observate doar la 250 ppm.

TESTUL E

- 15 Pentru evaluarea combaterii puricelui-de-pisică (*Ctenocephalides felis* Bouche), un șoarece CD-I® (aproximativ 30 g, mascul, obținut în Charles River Laboratories, Wilmington, MA) a fost oral dozat cu compusul de testare în cantitate de 10 mg/kg dizolvat în glicol propilenic /glicerol formal (60:40). Peste două ore după administrarea orală, aproximativ 8...16 purici adulți au fost aplicați fiecărui șoarece. Mortalitatea puricilor a fost evaluată peste 48 de ore după aplicare.

- 20 Din compușii testați următorii au cauzat mortalitate de 30% sau mai mult: 1*, 2, 10*, 41* și 51*.

* înseamnă că compusul a cauzat mortalitatea la 50% sau mai mult.

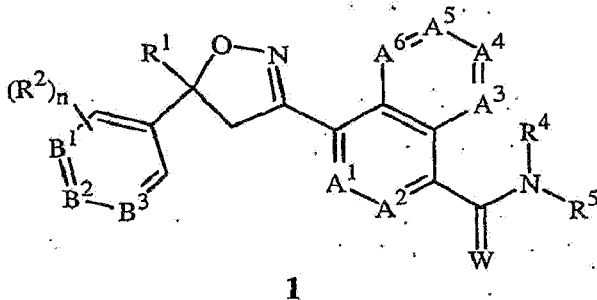
25

(56) Referințe bibliografice citate în descriere:

1. WO 2005/085216 A 2005-09-15

(57) Revendicări:

1. Un compus cu formula 1, un N-oxid sau o sare a sa,



în care:

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ sunt selectați independent din grupa constituită din CR³ și N, cu condiția că cel mult 3 din A¹, A², A³, A⁴, A⁵ și A⁶ reprezintă N;

B¹, B² și B³ sunt selectați independent din grupa constituită din CR² și N;

W reprezintă O sau S;

R¹ reprezintă C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁶;

fiecare R² reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, C₂-C₄ alcoxycarbonil, -CN sau -NO₂;

fiecare R³ reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆

haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, -CN sau -NO₂;

R⁴ reprezintă H, C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil, C₄-C₇ cicloalchilalchil, C₂-C₇ alchilcarbonil sau C₂-C₇ alcoxycarbonil;

R⁵ reprezintă H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² sau Q¹; sau C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁷; sau

R⁴ și R⁵ sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați independent din grupa constituită din C₁-C₂ alchil, halogen, -CN, -NO₂ și C₁-C₂ alcoxi;

fiecare R⁶ reprezintă independent halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, -CN sau -NO₂;

fiecare R⁷ reprezintă independent halogen, C₁-C₆ alchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₈ dialchilamino, C₃-C₆ cicloalchilamino, C₂-C₇ alchilcarbonil, C₂-C₇ alcoxycarbonil, C₂-C₇ alchilaminocarbonil, C₃-C₉ dialchilaminocarbonil, C₂-C₇ haloalchilcarbonil, C₂-C₇ haloalcoxycarbonil, C₂-C₇ haloalchilaminocarbonil, C₃-C₉ halodialchilaminocarbonil, hidroxi, -NH₂, -CN sau -NO₂; sau Q²;

fiecare R⁸ reprezintă independent halogen, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, C₂-C₄ alcoxycarbonil, -CN sau -NO₂;

fiecare R⁹ reprezintă independent halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alchiltio, C₁-C₆ haloalchiltio, C₁-C₆ alchilsulfinil, C₁-C₆ haloalchilsulfinil, C₁-C₆ alchilsulfonil, C₁-C₆ haloalchilsulfonil, C₁-C₆ alchilamino, C₂-C₆ dialchilamino, -CN, -NO₂, fenil sau piridinil;

R¹⁰ reprezintă H; sau C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți halogeni;

R¹¹ reprezintă H, C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil, C₄-C₇ cicloalchilalchil, C₂-C₇ alchilcarbonil sau C₂-C₇ alcoxycarbonil;

R¹² reprezintă H; Q³; sau C₁-C₆ alchil, C₂-C₆ alchenil, C₂-C₆ alchinil, C₃-C₆ cicloalchil, C₄-C₇ alchilcicloalchil sau C₄-C₇ cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁷; sau

R¹¹ și R¹² sunt luați împreună cu nitrogen, de care aceștia sunt legați pentru a forma un ciclu cu 2 până la 6 atomi de carbon și opțional un atom adițional selectat din grupa constituită din N, S sau O, ciclul menționat substituit opțional cu 1 până la 4 substituenți selectați independent din grupa constituită din C₁-C₂ alchil, halogen, -CN, -NO₂ și C₁-C₂ alcoxi;

Q¹ reprezintă un ciclu fenil, un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, sau un sistem biciclic condensat cu 8, 9 sau 10 membri ce conține opțional de la unu până la trei heteroatomi selectați din până la 1 O, până la 1 S și până la 3 N, fiecare ciclu sau sistem ciclic substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁸;

fiecare Q² reprezintă independent un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁹;

Q³ reprezintă un ciclu fenil sau un nucleu heterociclic cu 5 sau 6 membri, fiecare ciclu substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁹; n este egal cu 0, 1 sau 2.

2. Compus conform revendicării 1, în care:

R¹ reprezintă C₁-C₃ alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R⁶;

fiecare R² reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ haloalchil, C₁-C₆ haloalcoxi sau -CN; și

fiecare R³ reprezintă independent H, halogen, C₁-C₆ alchil, C₁-C₆ haloalchil, C₃-C₆ cicloalchil, C₃-C₆ halocicloalchil, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, -CN sau -NO₂.

3. Compus conform revendicării 2, în care:
 B^1 , B^2 și B^3 reprezintă independent CR^2 ;
 W reprezintă O;
 R^4 reprezintă H, C_1 - C_6 alchil, C_2 - C_7 alchilcarbonil sau C_2 - C_7 alcocarbonil; și
 R^5 reprezintă H, $NR^{11}R^{12}$ sau Q^1 ; sau C_1 - C_4 alchil, C_2 - C_4 alchenil, C_2 - C_4 alchinil, C_3 - C_4 cicloalchil, C_4 - C_7 alchilcicloalchil sau C_4 - C_7 cicloalchilalchil, fiecare substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 .
4. Compus conform revendicării 3, în care:
 R^1 reprezintă C_1 - C_3 alchil substituit opțional cu halogen;
fiecare R^2 reprezintă independent H, CF_3 , OCF_3 , halogen sau -CN;
fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 haloalchil, C_3 - C_6 ciclopropil, C_1 - C_4 alcoxi sau -CN; și
fiecare R^7 reprezintă independent halogen, C_1 - C_4 alchil, C_1 - C_4 alcoxi, C_1 - C_4 alchiltio, C_1 - C_4 alchilsulfonil, C_1 - C_4 alchilsulfonil, C_2 - C_4 alchilcarbonil, C_2 - C_4 alcocarbonil, C_2 - C_5 alchilaminocarbonil, C_2 - C_5 haloalchilcarbonil, C_2 - C_5 haloalcocarbonil, C_2 - C_5 haloalchilaminocarbonil, $-NH_2$, -CN sau $-NO_2$; sau Q^2 .
5. Compus conform revendicării 4, în care:
 R^4 reprezintă H;
 R^5 reprezintă C_1 - C_4 alchil substituit opțional cu unul sau mai mulți substituenți selectați independent din R^7 ;
fiecare R^7 reprezintă independent halogen sau Q^2 ; și
fiecare Q^2 reprezintă independent fenil, piridinil sau tiazolil.
6. Compus conform revendicării 5, în care:
 R^1 reprezintă CF_3 ;
 A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 și A^6 reprezintă fiecare CR^3 ;
 B^2 reprezintă CR^2 ; și
fiecare R^3 reprezintă independent H, C_1 - C_4 alchil sau -CN.
7. Compus conform revendicării 6, în care:
 B^2 reprezintă CH;
fiecare R^2 reprezintă independent halogen sau C_1 - C_3 haloalchil;
 R^3 reprezintă H;
 R^5 reprezintă CH_2CF_3 sau CH_2 -2-piridinil; și
n este egal cu 0.
8. Compus conform revendicării 1, care este selectat din grupa constituită din:
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamidoamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-etil-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-metoxietil)-1-naftalencarboxamidă,
4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-[2-(2,2,2-trifluoroetil)-2-oxoetil]-1-naftalencarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-chinolincarboxamidă,
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-8-izochinolincarboxamidă, și
1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-izoxazolil]-
N-(2-piridinilmetil)-4-izochinolincarboxamidă.
9. Compoziție care include un compus conform revendicării 1 și cel puțin un component adițional selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid; și opțional mai conține cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional.
10. Compoziție pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care include o cantitate biologic efectivă de un compus conform revendicării 1 și cel puțin un component adițional

selectat din grupa constituită dintr-un agent activ de suprafață, un diluant solid și un diluant lichid; și opțional mai conține o cantitate biologic efectivă de cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional.

11. Compoziție conform revendicării 10, în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa de insecticide constituită din modulatori ai canalului de sodiu, inhibitori de colinesterază, neonicotinoide, lactone macrociclice insecticide, blocatori ai canalului de clorură GABA-reglabil, inhibitori ai sintezei de chitină, imitatori ai hormonului juvenil, liganzi receptori de octopamină, agoniști ai ecdizinelor, liganzi receptori de rianodină, analogi de nereistoxină, inhibitori ai transportului de electroni mitocondrial, inhibitori ai biosintezei lipidice, insecticide ciclodiene, inhibitori ai năpârlirii, virus nucleopoliedric, membru al *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxină încapsulată a *Bacillus thuringiensis* și un insecticid viral natural sau modificat genetic.

12. Compoziție conform revendicării 10, în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa constituită din abamectin, acefat, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadiractin, azinfos-metil, bifentrină, bifenazat, bistrifluron, buprofezină, carbofuran, cartap, chinometionat, clorfenapir, clorfluaaron, clorantraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metil, clorobenzilat, cromofenozidă, clotianidină, ciflumetofen, ciflutrină, beta-ciflutrină, cihalotrină, gamma-cihalotrină, lambda-cihalotrină, cihexatin, cipermitrină, ciromazină, deltametrină, diafentiuon, diazinonă, dicofol, dieldrină, dienoclor, diflubenzuron, dimeflutrină, dimetoat, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazachină, fenbutatin oxid, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrină, fenpiroximat, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamidă, flucitrat, tau-fluvalinat, flufenerim, flufenoxuron, fonofos, halofenozidă, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, izofenfos, lufenuron, malation, metaflumizon, metaldehidă, metamidofos, metidation, metomil, metopren, metoxiclor, metoxifenoizidă, metoflutrină, monocrotofos, nitenpiram, nitiazină, novaluron, noviflumuron, oxamil, paration, paration-metil, permetrină, forat, fozalon, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, proflutrină, propargită, protrifenbut, pimetozină, pirafluprol, piretrină, piridaben, piridilil, pirifluchinazon, piriprol, piriproxifen, rotenonă, rianodină, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromezifen, spirotetramat, sulprofos, tebufenozidă, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrină, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodiu, tolfenpirad, tralometrină, triazamat, triclorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovirus, o delta-endotoxină încapsulată de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterie entomopatogenică, virus entomopatogenic și fungi entomopatogenice.

13. Compoziție conform revendicării 12, în care cel puțin un compus sau agent biologic activ adițional este selectat din grupa constituită din abamectin, acetamiprid, amitraz, avermectin, azadiractin, bifentrină, buprofezină, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidină, ciflutrină, beta-ciflutrină, cihalotrină, lambda-cihalotrină, cipermitrină, ciromazină, deltametrină, dieldrină, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerat, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerat, fipronil, flonicamid, flubendiamidă, flufenoxuron, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizon, metomil, metopren, metoxifenoizidă, nitenpiram, nitiazină, novaluron, oxamil, pimetozină, piretrină, piridaben, piridilil, piriproxifen, rianodină, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromezifen, tebufenozidă, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodiu, tralometrină, triazamat, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovirus și o delta-endotoxină încapsulată de *Bacillus thuringiensis*.

14. Compoziție conform revendicării 10 în formă de soluție lichidă pentru impregnarea solului.

15. Compoziție de pulverizare pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care cuprinde:

(a) o cantitate biologic efectivă de compus conform revendicării 1 sau compoziția conform revendicării 10; și

(b) un propelant.

16. Compoziție de momeală pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați care cuprinde:

(a) o cantitate biologic efectivă de compus conform revendicării 1 sau compoziția conform revendicării 10;

- (b) una sau mai multe substanțe nutritive;
- (c) opțional un atractant; și
- (d) opțional un umectant.

17. Compoziție de momeală pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați conform revendicării 16 care cuprinde componenții menționați într-un raport potrivit pentru utilizare în dispozitivul-capcană pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați, care conține un corp prevăzut pentru plasarea compoziției de momeală, în care corpul are cel puțin un orificiu executat de mărimea care să permită trecerea dăunătorilor nevertebrați prin el și accesul la compoziția de momeală dintr-un loc aflat în afara corpului, și în care corpul suplimentar este prevăzut să fie amplasat în sau aproape de locul activității posibile sau cunoscute a dăunătorilor nevertebrați.

18. Procedeu de combatere a dăunătorilor nevertebrați care cuprinde contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului său cu o cantitate efectivă biologic de un compus conform revendicării 1.

19. Procedeu de combatere a dăunătorilor nevertebrați care cuprinde contactul dăunătorului nevertebrat sau al habitatului său cu o compoziție conform revendicării 10.

20. Procedeu conform revendicării 19, în care habitatul este solul și compoziția este aplicată prin impregnarea solului.

21. Procedeu de combatere a gândacilor de bucătărie, furnicilor sau termitelor, care cuprinde contactul gândacului de bucătărie, furnicii sau termitei cu compoziția de momeală în dispozitivul-capcană conform revendicării 17.

22. Procedeu de combatere a țânțarului, musculiței, păduchelui negru, musculiței de toamnă, tăunului-renilor, tăunului-cailor, viespii, gărgăunului, căpușei, păianjenului, furnicii, țânțarului mic, care cuprinde contactul dăunătorilor menționați cu compoziția de pulverizare conform revendicării 15 distribuită dintr-un container pulverizator.

23. Procedeu de protecție a semințelor de dăunători nevertebrați, care cuprinde contactul semințelor cu o cantitate biologic efectivă de un compus conform revendicării 1.

24. Procedeu conform revendicării 23, în care semințele sunt acoperite cu compusul conform revendicării 1 preparat ca o compoziție ce conține o substanță peliculogenă sau un agent adeziv.

25. Semințe tratate care conțin un compus conform revendicării 1 în cantitate de la aproximativ 0,0001 până la 1% din greutatea semințelor înainte de tratament.

26. Compoziție pentru protecția animalelor de dăunători nevertebrați paraziți care conține o cantitate paraziticid efectivă de un compus conform revendicării 1 și cel puțin un purtător.

27. Compoziție conform revendicării 26 într-o formă pentru administrare orală.

28. Procedeu de protecție a animalelor de dăunători nevertebrați paraziți care cuprinde administrarea animalului a unei cantități paraziticid efective de un compus conform revendicării 1.

Șef Secție:	IUSTIN Viorel
Examinator:	JOVMIR Tudor
Redactor:	LOZOVANU Maria

RAPORT DE DOCUMENTARE SUPLIMENTAR LA RAPORTUL PCT

I. Datele de identificare a cererii	
(21) Nr. depozit: a 2008 0171	(32) Data de prioritate recunoscută: 2005.12.30; 2006.08.23; 2006.11.07
(22) Data depozit: 2006.12.28	Raport de documentare internațională: da
(54) Titlul: Izoxazoline pentru combaterea dăunătorilor nevertebrați	
(71) Solicitant: E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, US	
(51) (Int.Cl): Int.Cl: C07D 261/04 (2006.01) A01N 43/80 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01) A01P 7/00 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)	
II. Condiții de unitate a invenției: ☒ satisface ☐ nu satisface Note:	
III.Revendicări: claritatea, susținerea de descriere Note: ☒ satisface ☐ nu satisface	
IV. Colecții și Baze de date de brevete cercetate (denumirea, termeni caracteristici, ecuații de căutare) MD « Documentare Invenții » (inclusiv cereri nepublicate; trunchiere automată stânga/dreapta): Izoxazol; chinolin; izochinolin; artropod ; nevertebrat ; C07D413; C07D261; "Worldwide" (Espacenet) : - EA, CIS (Eapatis) : изоксазол* AND C07D 413; изохинолин* AND C07D 413 ; хинолин* AND C07D 413; артропод* ; беспозвоночн* ; C07D261 ; SU (nonpublic) : - Alte BD –	
V. Baze de date și colecții de literatură nonbrevet cercetate	

VI. Documente considerate a fi relevante		
Categoria*	Date de identificare ale documentelor citate si, unde este cazul, indicarea pasajelor pertinente	Numărul revendicării vizate
A	MD 89 C2 (1994.11.30)	1-28
* categoriile speciale ale documentelor citate:		
A – document care definește stadiul anterior general		T – document publicat după data depozitului sau a priorității invocate, care nu aparține stadiului pertinent al tehnicii, dar care este citat pentru a pune în evidența principiul sau teoria pe care se bazează invenția
X – document de relevanță deosebită: invenția revendicată nu poate fi considerată nouă sau implicând activitate inventivă când documentul este luat în considerație de unul singur		E – document anterior dar publicat la data depozit național reglementar sau după aceasta dată
Y – document de relevanță deosebită: invenția revendicată nu poate fi considerată ca implicând activitate inventivă când documentul este asociat cu unul sau mai multe documente de aceeași categorie		D – document menționat în descrierea cererii de brevet
O - document referitor la o divulgare orală, un act de folosire, la o expoziție sau la orice alte mijloace de divulgare		C – document considerat ca cea mai apropiată soluție
		& – document, care face parte din aceeași familie de brevete
P - document publicat înainte de data de depozit, dar după data priorității invocate		L – document citat cu alte scopuri
Data finalizării documentării 2011.08.05		
Examinator JOVMIR Tudor		