

00 49 397



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organización CSA Ltda

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones



SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. 00-49397

34. TÍTULO Nuevas Pirazoles fingicidos
Ver titulo nuevo en folio 239

5. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL AOIN 43/56

71. SOLICITANTE Aventis CropScience S.A
55 Avenue, Parc Cassin 69009

DOMICILIO Lyon francia

74. APODERADO Carlos R. Olarte

2. BOGOTÁ, D. C., JUNIO 30 - 2000.

02040



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Handwritten signature or mark.

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

00-49397

21. **EXPEDIENTE No.**

54. **TITULO**

NUEVOS PIRAZOLES FUNGICIDAS.

Ver titulo nuevo en folio 234

51. **CLASIFICACION INTERNACIONAL**

AOIN 43/56

71. **SOLICITANTE**

AVENTIS CROPS SCIENCE S.A.

55 Avenue René Cassin, 69009,

DOMICILIO

Lyon Francia

74. **APODERADO**

CARLOS R. OJARBE

22. **SANTAFE DE BOGOTA, D.C.**

JUNIO 30, 2000

202040



00 49397

DE
IN

Radicación : 00049397 00000000

Folios: 93

Fecha (AMD): 2000-06-30 17:27:07

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 REGISTRO

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

AVENTIS CROPS SCIENCE S.A.

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

FRANCIA

Departamento o Estado

LYON

Dirección

55 Avenue René Cassin, 69009

Ciudad

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

CARLOS R. OLARTE

Dirección

CALLE 35 No. 7-25 Piso 4

Ciudad

SANTAFE DE BOGOTÁ

Teléfono

285-14-00/570-0010

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

JOSEPH PEREZ, GILBERT EMERIC, VINCENT GERUSZ, BENOIT

HARTMANN, HELENE LACHAISE, LOIC LE HIR DE FALLOIS, NATHALIE

HUSER, THOMAS WEGMANN, STEPHANIE GARY, NELLY GOURLAOUEN

Identificación

Dirección

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención NUEVOS PIRAZOLES FUNGICIDAS.

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

FR

(32) Fecha

Junio 30, 1999

(31) No. Solicitud

99 08596

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

CLASIFICACION INTERNACIONAL

A01N43/56

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

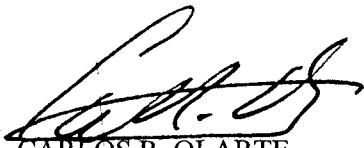
2

ANEXOS DE LA SOLICITUD

- Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica ☐
- Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC Adjutno ☒
- Recibo de la tasa respectiva ☒
- Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras de la publicación ☐
- Si se reivindica prioridad Andina: ☐
- Copia de la primera solicitud ☐
- Traducción oficial ☐
- Si se reivindica prioridad Unionista: ☐
- Copia certificada de la primera solicitud ☐
- Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior ☐
- Traducción simple ☐
- Capítulo descriptivo ☒
- Dibujos, planos necesarios ☐
- Capítulo reivindicatorio ☒
- Tarjeta archivo propietarios según formato ☒
- Tarjeta archivo temático según formato ☒
- Extracto para publicación según formato ☒
- Arte final 12 x 12 y 6 x 6 cms ☐
- Otros Documentos ☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA



NOMBRE CARLOS R. OLARTE

CC. 79.782.747 de Bogotá

T.P.No. 74.295



3

A

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00049397 00000000

Folios: 30

Fecha (AMD): 2000-06-30 17:27:07

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAL

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800171000 2

RECIBO OFICIAL DE PAGA : 35,475
FECHA : JUNIO 7 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Nº. PAGO
ALVARO RODRIGUEZ GONZALEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	150 00110 4	2052510	27,875,000.00

***** G O B I E R N O *****

SANT. CONTABILITICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 5015 01 01 SOLICITUDES	1 TRAMITE DE SOL. DE PATENTE DE IN	102,000.00
	TOTAL :	102,000.00

SDN: DESEMBOLSO COMO MIL PAGOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE PAGA APLICADO AL EXPEDIENTE N°.



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

colombiana

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA

5707570254

Members of the Firm

LE MINISTRE DES AFFAIRES ÉTRANGÈRES
Constate que la présente certification de signature
a été effectuée conformément à la loi française.
Pour le Ministre et par délégation.



Manesse

Christophe MANESSE

BAKER & MCKENZIE

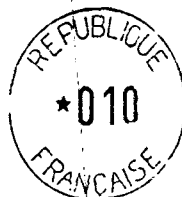
ATTORNEYS AT LAW

APARTADO AEREO 3746

TELEFONO: 285-1400

SANTAFE DE BOGOTÁ, D.C. 1000
COLOMBIA

MINISTRE
DES AFFAIRES
ÉTRANGÈRES
STE:
PARIS CHARL



POWER OF ATTORNEY

PODER

The undersigned.

La abajo firmada.

AVENTIS CROPS SCIENCE S.A.

AVENTIS CROPS SCIENCE S.A.

located in
55 Avenue René Cassin
69009 Lyon
France

domiciliada en
55 Avenue René Cassin
69009 Lyon
France

declares that it hereby grants to

declara por el presente otorgar a

ALVARO CORREA ORDOÑEZ and/or
CARLOS REINALDO OLARTE
LUZ HELENA VILLAMIL and/or

ALVARO CORREA ORDOÑEZ y/o
CARLOS REINALDO OLARTE
LUZ HELENA VILLAMIL y/o

a full and sufficient power of attorney to apply to the
proper national officers and authorities for the issue of:

poder especial amplio y bastante para recabar de las
oficinas y autoridades nacionales que correspondan, la
obtención de:

Letters Patent, mergers, changes of name,
assignments, filing and prosecution of oppositions,
changes of address

Patentes de Invención, fusiones, cambios de
nombre, traspasos, presentación y tramitación
de oposiciones, cambios de dirección

to which end it empowers them to take all steps
necessary before said authorities for the objects stated,
to file petitions, prepare descriptions, make protests,
declarations, appeals and objections, pay imposts,
apply for certifications, receive documents and
securities, abandon applications and collect refunds.
To the said mandatories sufficient power is granted
hereby to receive notifications for and on behalf of the
Company, to confer powers on those who are to
represent the company judicially and extrajudicially, to
answer in court in the matter of all claims and demands
that may be presented in connection with the patents,
and to do everything that may be required, before
administrative or judicial officers of any class giving
them likewise power to substitute these presents and
revoke such substitutions if necessary. Additionally, the
Company hereby ratifies all acts taken to date on its
behalf and in furtherance of this Power of Attorney.

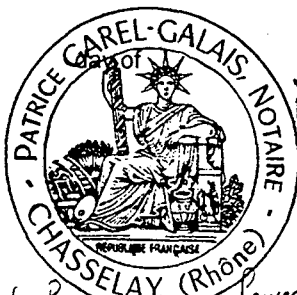
a cuyo efecto los faculta para dar ante dichas
autoridades, todos los pasos necesarios al objeto
indicado, elevar solicitudes, formular descripciones,
protestas, declaraciones, apelaciones y reclamos,
oblar impuestos, solicitar testimonios, recibir
documentos y valores, desistir y percibir. Se concede a
los expresados mandatarios poder bastante para
recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar
poderes a quienes vayan a representar a la compañía
judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a
todas las reclamaciones o demandas que por motivo
de las patentes se presentaren y hacer cuanto fuere
necesario, ante las autoridades administrativas o
judiciales de cualquier orden, dándoles asimismo
facultad para sustituir el presente y en caso necesario
revocar dichas sustituciones. Adicionalmente, la
compañía por medio de la presente ratifica toda
actuación tomada en representación suya y en relación
con este poder.

Done and subscribed in

Dado y firmado en

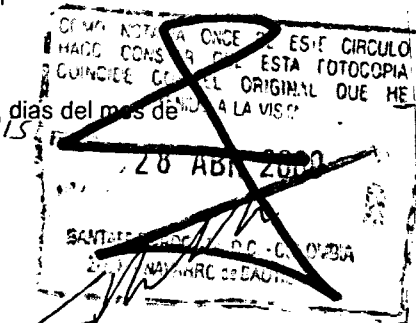
On the

19



Signature of Person Issuing Power

Je soussigné M^{re} GAREL-GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
A. BRACHOTTE
qui a été apposée
à Chasselay le 07/03/2000



CHARLES BRACHOTTE

AUTHORIZED REPRESENTATIVE



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
PARIS, FRANCIA

No. 1365

París, 4 de Abril de 2000

El suscrito **Cónsul General de Colombia en París**, vistos los documentos presentados por los interesados,

CERTIFICA:

Que el señor **Christophe MANESSE**, quien constató que la autenticación de la firma del signatario del poder precedente fue efectuada de conformidad con la ley francesa, ejercía en la fecha las funciones de **Adjunto Administrativo de cancillería de la Dirección de los Franceses en el Exterior y de los Extranjeros en Francia del Ministerio de Asuntos Exteriores de Francia**, y que su firma corresponde con la registrada en este Consulado;

Que la compañía **AVENTIS CROPS SCIENCE S.A.** es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de la República Francesa y que cumple con su objeto conforme a las mismas;

Que el señor **Charles BRACHOTTE**, quien confiere el poder precedente, está debidamente facultado para representar legalmente a dicha compañía en todo lo relacionado con asuntos de propiedad intelectual.

El Cónsul General no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.


Alejandro Borda Rojas
Cónsul General

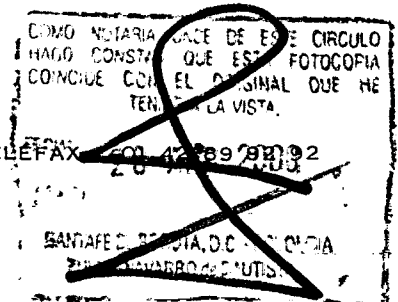


Pagado Impuesto de Timbre por valor de US\$7,00 (SIETE DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA)

Pagados Derechos Consulares por valor de US\$15 (QUINCE DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA)

Total: US\$22 (VEINTIDOS DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA).

12. RUE DE BERRI - 75008 PARIS - TÉL. : 01 53 93 91 91 - TÉLÉFAX : 01 42 39 91 92



NUEVOS PIRAZOLES FUNGICIDAS

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevos compuestos que poseen un grupo pirazol, su procedimiento de preparación, su utilización como fungicidas, especialmente en forma de composiciones fungicidas, así como los procedimientos para reprimir hongos fitopatógenos de los cultivos con ayuda de estos compuestos o de estas composiciones.

Estado de la técnica

Numerosos compuestos que contienen un grupo pirazol son ya conocidos y están extensamente ilustrados en la literatura científica. A título de ejemplo, la Patente de EE.UU. 4.622.330 describe derivados de pirazol que poseen actividades antiparasitarias.

Más específicamente, las Patentes de EE.UU. 5.760.056 y WO-A-97/17064 describen derivados de quinolil-pirazoles que poseen un grupo adamantilcarboxílico y son útiles en el tratamiento terapéutico de trastornos del sistema nervioso central.

Las Solicitudes de Patentes EP-A-0703234 y DE-A-19636509 describen especialmente composiciones fungicidas que poseen una estructura quinolil-pirazólica cuyo ciclo de pirazol lleva opcionalmente un solo sustituyente.

Los derivados conocidos de quinolil-pirazoles, y especialmente aquellos conocidos por su actividad fungicida, presentan sin embargo numerosos inconvenientes, bien conocidos por el usuario de tales compuestos, es decir el que se enfrenta a los problemas de lucha contra las enfermedades fúngicas de las plantas: escasa actividad, compuestos eficaces sobre una gama relativamente escasa de enfermedades fúngicas, escasa selectividad, toxicidad, incluso ecotoxicidad.

Dicho de otro modo, los compuestos fúngicidas conocidos son escasamente activos y/o poseen un espectro de actividad relativamente estrecho. A fin de erradicar todas las especies diferentes de hongos que atacan a las plantas, el usuario debe, por ejemplo, utilizar varios productos, por lo que debe conocer exactamente el espectro y las dosis de aplicación. La utilización de varios productos está además en contra de los modos de tratamiento de los cultivos preconizados hoy en día, donde las dosis de aplicación deben ser las más bajas posibles, con el objeto evidente de protección del medio ambiente.

Además, el empleo de grandes cantidades de productos y/o de varios

productos fungicidas diferentes es muchas veces nocivo para los cultivos (toxicidad de los productos).

El empleo de grandes cantidades de productos en el tratamiento de las enfermedades fúngicas entraña en ciertos casos la aparición de cepas fúngicas resistentes a estos productos. Esta es la razón por la cual hoy en día es necesario proponer al usuario nuevas moléculas antifúngicas.

Un objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos que tenga un amplio espectro de acción sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos.

Otro objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos que tenga un amplio espectro de acción sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos, que permita resolver los problemas específicos encontrados.

Otro objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos activos a bajas dosis sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos.

Otro objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos que tenga un amplio espectro de acción mejorada sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos.

Otro objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos que tenga un amplio espectro de acción mejorada sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos y que posea una toxicidad y/o una ecotoxicidad reducida.

Otro objeto de la presente invención es proponer una nueva familia de compuestos que tenga un amplio espectro de acción mejorada sobre los hongos fitopatógenos de los cultivos, como cereales, arroz, maíz, girasol, árboles frutales, árboles forestales, vid, cultivos oleaginosos, cultivos hortícolas, solanáceas, remolacha, etc.

Definición general de la invención

De manera completamente sorprendente, se ha encontrado que estos objetos pueden ser realizados en su totalidad o en parte por compuestos que poseen un resto quinolil-pirazol, en el cual el pirazol posee al menos dos sustituyentes diferentes.

La presente invención se refiere a compuestos de fórmula general (I):

2

8

compuestos de fórmula (I) en la cual:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquil-carbonilo, heterocicilcarbonilo, cicloalquil-oxycarbonilo, cicloalquilalquilo-oxycarbonilo, heterocicil-oxycarbonilo, heterocicilalcoxycarbonilo, tioalquiltiocarbonilo, alcoxitiocarbonilo, tioalquilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $C(=O)NR_4R_5$, $C(=S)NR_4R_5$, un radical $C(=NR_4)R_5$, un átomo de halógeno, el radical sulfonilo, el radical sulfinilo, el radical sulfanilo, el radical fosforilo y el radical fosfona, o bien, R_1 y R_2 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_4R_5 ;
- R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio,

alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicililcarbonilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, cicloalquil-oxicarbonilo, cicloalquilalquiloxicarbonilo, heterocicililoxicarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitró, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{C}(=\text{S})\text{NR}_4\text{R}_5$ y un radical $\text{C}(=\text{NR}_4)\text{R}_5$,

- R_4 y R_5 , idénticos o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, cicloalquiloxicarbonilo, cicloalquilalquiloxicarbonilo, heterocicililoxicarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitró, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo y dialquilaminoalquilo, hidrazino, o bien, R_4 et R_5 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene de 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_7R_8 ;
- R_6 representa hidrógeno, un radical alquilo, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo y alcoxycarbonilalquilo,
- R_7 y R_8 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio,

cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, cicloalquiloxicarbonilo, cicloalquilalquiloxicarbonilo, heterociciloxicarbonilo, heterocicilalcoxicarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,

el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, hidrazino, o bien,

R_7 y R_8 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y amino;

- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; el radical hidroxilo, mercapto, nitro, tiocianato, azido, ciano o pentafluorosulfonilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquiltioalquilo, haloalquiltioalquilo, cianoalquilo, cianoalcoxi, cianoalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, un grupo cicloalquilo, halocicloalquilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, un radical arilo o heteroarilo eventualmente sustituido, un radical amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, acilamino, aminoalquilo, N-alquilaminoalquilo, N,N-dialquilaminoalquilo, acilaminoalquilo, el radical carboxi, el radical carbamoilo, un radical N-alquilcarbamoilo, N,N-dialquilcarbamoilo, alcoxicarbonilo y un radical alquilcarbonilo, o bien dos radicales adyacentes elegidos entre Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 también pueden formar, juntos y con los dos átomos de carbono a los que están unidos, un ciclo aromático de 6 miembros, o dos radicales adyacentes elegidos entre Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 también pueden formar juntos un radical divalente metilen-di-oxi;
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen

una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, NR_4R_5 , ciano, nitro, alquilo, alcoxialquilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenoilcarbonilo, alquenoilcarboniloxi, alquinoilcarbonilo, alquinoilcarboniloxi, arilcarbonilo, arilcarboniloxi, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarboniloxi, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, halógenoalcoxi, perhalógenoalcoxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilcarboniloxi, heterocicilcarbonilo, heterocicilcarboniloxi, ariloxialquilcarboniloxi, alquilcarbonilalquilcarboniloxi, alcoxycarbonilalquilcarboniloxi, arilcarbonilcarboniloxi, heteroarilcarbonilcarboniloxi, alcoxialcoxialquilcarboniloxi y alquiltioalquilcarboniloxi,

- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, oxo, ciano, nitro, cianato, tiocianato, formilo, propilen-diilo, amino, alquilamino, dialquilamino, pentafluorosulfonilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alqueno, alquino, alcoxi, alquiltio, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenoilcarbonilo, alquenoilcarboniloxi, alquinoilcarbonilo, alquinoilcarboniloxi, arilcarbonilo, arilcarboniloxi, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarboniloxi, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo y heterocicilcarbonilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles fórmulas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir.

En las definiciones precedentes de los radicales R_1 a R_8 e Y_1 a Y_6 , se entenderá que:

- los radicales o grupos alquilo, alqueno, alquino, (así como los radicales derivados, como alcoxi, alcoxycarbonilo, etc.) contienen de 1 a 6 átomos de carbono (de 2 a 6 para los radicales alqueno y alquino) en cadena lineal o ramificada;
- los radicales cicloalquilo contienen de 3 a 7 átomos de carbono, estando los ciclos parcial o totalmente saturados, por ejemplo ciclopropilo, ciclopentilo, ciclopentenilo, ciclohexilo, ciclohexenilo;
- los radicales heterociclilo contienen de 3 a 7 átomos, de los cuales 1,

2 ó 3 se eligen entre nitrógeno, oxígeno y azufre, siendo átomos de carbono los demás, estando los ciclos parcial o totalmente saturados, por ejemplo aziridilo, morfolilo, tiomorfolilo, piperidilo, piperazinilo, pirrolidinilo, imidazolidinilo, tioimidazolidinilo, isoxazolilo, isotiazolilo, tetrahidropiridinilo, 1,3-dioxolilo;

- por radical arilo, se entiende el radical fenilo o el radical naftilo;
- por radical heteroarilo, se entiende un radical heteroaromático mono o bicíclico de 3 a 10 miembros, que puede contener hasta 3 heteroátomos iguales o diferentes y elegidos entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de radicales aromáticos son el radical piridilo, quinolilo, quinoxalilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazinilo, piridazinilo.

Por otro lado, los términos genéricos siguientes se utilizan con los significados siguientes:

- halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo;
- los radicales halogenados pueden contener uno o varios átomos de halógeno iguales o diferentes;
- el radical acilo significa alquilcarbonilo o cicloalquilcarbonilo;
- cuando un radical está disustituido, los dos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes;
- cuando el radical amino está disustituido, los dos sustituyentes pueden constituir un heterociclo nitrogenado saturado o insaturado, de 4 ó 6 átomos;
- cuando el radical carbamoilo está disustituido, los dos sustituyentes pueden constituir un heterociclo nitrogenado saturado o insaturado de 4 ó 6 átomos.

Las realizaciones preferidas de la invención son aquellas en que los productos de fórmula (I) presentan además una y/u otra de las características siguientes, tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, hidroxialquilo, aminoalcoxialquilo, N-alquilaminoalcoxi-alquilo, N,N-dialquilaminoalcoxialquilo, aminoalquiltioalquilo, N-alquil-aminoalquil-tioalquilo, N,N-dialquilaminoalquiltioalquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquilcarbonilo, heterociclilcarbonilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterociclilalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarboniloxialquilo, alquenilcarboniloxialquilo, alquinilcarboniloxialquilo, alcoxicarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilcarboniloxi-alquilo, heteroarilcarboniloxialquilo,

- R₃ se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicilo, cicloalquilalquilo, heterocicil-alquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, y un radical NR₄R₅.

un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, el radical mercapto, el radical ciano, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo y dialquilaminoalquilo,

- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, el radical hidroxilo, mercapto, nitro, ciano o pentafluorosulfonilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, cianoalquilo, cianoalcoxi, cianoalquiltio, un radical alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio.

el radical carboxi, alcóxicarbonilo y un radical alquilcarbonilo,
ou bien

- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales

o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, ciano, nitro, arilo, heteroarilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, halógenoalcoxi, perhalógenoalcoxi, cianoalquil-carboniloxi, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilcarboniloxi, heterociclicarbonilo, heterociclicarboniloxi, ariloxialquilcarboniloxi, alquilcarbonilalquilcarboniloxi, alcoxicarbonil-alquilcarboniloxi, arilcarbonilcarboniloxi, heteroarilcarbonil-carboniloxi, alcoxialcoxialquilcarboniloxi y alquiltioalquilcarboniloxi,

- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, escogidos entre oxo, ciano, nitro, formilo, propilen-diilo, amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, arilo, heteroarilo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alcoxi, alquiltio, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, ariloxi, cicloalquilo y heterociclilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir.

De manera ventajosa, se prefieren más aún los compuestos de fórmula (I) que poseen las características siguientes, tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, hidroxialquilo, aminoalcoxialquilo, N-alquilaminoalcoxi-alquilo, N,N-dialquilaminoalcoxialquilo, aminoalquil-tioalquilo, N-alquilaminoalquil-tioalquilo, N,N-dialquilaminoalquiltioalquilo, alquenilo, cicloalquilcarbonilo, heterociclicarbonilo, cicloalquilalquilo, heterociclicilalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarbonil-oxialquilo, alcoxicarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical carboxi, un radical NR_4R_5 , $CH_2NR_4R_5$, $C(=O)NR_4R_5$, y un radical $C(=NR_4)R_5$,
- R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterociclicilalquilo,

15
4

alcoxicarbonilo,
el radical carboxi, y un radical NR_4R_5 ,

- R_4 et R_5 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicliilalquilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, y un radical OR_6 ,
- R_6 representa hidrógeno, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo y heterocicliilalquilo,
- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, el radical hidroxilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo y haloalcoxialquilo,
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, halógeno, alcoxi y haloalcoxi,
- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre oxo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo y ariloxi,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir..

De manera particularmente ventajosa, se prefieren más aún los compuestos de fórmula (I) que poseen las características siguientes tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicliilcarbonilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarboniloxialquilo, alcoxicarbonilo, cicloalquilalcoxicarbonilo,

un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo,
el radical carboxi y un radical $C(=O)NR_4R_5$,

- R_3 representa hidrógeno,
- R_4 y R_5 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi y alcóxicarbonilalquilo,
- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un radical alquilo, haloalquilo y alcoxi,
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidróxido, halógeno, alcoxi y haloalcoxi,
- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre oxo, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, perhaloalcoxi y alcóxicarbonilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos o metaloídicos de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir..

Por último, se prefieren los compuestos de fórmula (I) elegidos entre:

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 3-(metoximetil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(3-nitrofenil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-N,N-dietil-5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-N-metoxi-5-(metoximetil)-N-metil-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(2-metoxietil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 17
- 5-(2-metoxietil)-1-(7-metoxi-4-quinolil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 1-[2,8-bis(trifluorometil)-4-quinolil-*N*-metoxi-3-(metoximetil)-*N*-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-3-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 1-(6-fluoro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de 2-etoxietilo;

- *N*-metoxi-3-(metoximetil)-*N*-metil-1-[8(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

- [1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-il](1,3-tiazolidin-3-il)metanona;

- 2-[1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-il]-2-propanol;

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-*N*-metoxi-5-(metoximetil)-*N*-propil-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

- 5-({4-metoxicarbonil}-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-5-il}metoxi)-isofalato de dimetilo;

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-*N*-isopropil-*N*-metoxi-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

- 4-[[1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazole-4-il]carbonil)-(metoxi)amino]butanoato de metilo;

- 5-[(heptanoiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 7-cloro-4-{5-metoximetil}-4-[5-trifluorometil]-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1*H*-pirazol-1-il}-quinoleína;

- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[[1,1-dimetiletil)sulfanil]metil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1*H*-pirazol-4-carbaldehído;

- [1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1-feniletetil)-1*H*-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-{3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-il}etanona;

• 3-[(metiloxi)metil]-5-(metilsulfanil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

• 5-cloro-3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

• oxima de (1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}etanona ;

• 1-(2,7-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• N-metil-1-[2-metil-8-(1-metiletil)-4-quinolinil]-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-[2-metil-7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2,5,7-trimetil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

• 1-(7-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• 1-(6,8-dicloro-2-metil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(8-metil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

• 1-(2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-[2-metil-8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

• 1-(6-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2-metil-4-quinolinil)-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-1-[2-metil-8-(metiloxi)-4-quinolinil]-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2,6,8-trimetil-4-quinolinil)-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-[5-cloro-2-metil-8-(metiloxi)-4-quinolinil]-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)-metil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(5,7-dicloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-(hidroximetil)-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(6-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1 H-pirazol-4-carboxamida
- N-5-dimetil-N-(metiloxi)-1-[2-metil-8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- O-metiloxima de 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1 H-pirazol-4-carbaldehído;
- 5-(bromometil)-1-(5,7-dicloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-3-(dibromometil)-N-metil-N-(metiloxi)-1 H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1 H-pirazol-4-il}etanol;
- O-(ciclopropilmetil)oxima de (1E)-1-{3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1 H-pirazol-4-il

20
28

etanonona;

N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[2-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4,5-dihidro-5-isoxazol-carboxilato de metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(ciclopropilcarbonil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-oxopropanoato de etilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metildisulfanil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etildisulfanil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-[(1-metiletil)disulfanil]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbimidatoato de etilo;

O-metiloxima
(1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1-propanona;

(3E)-4-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-buten-2-ona;

(2Z,4E)-5-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-hidroxi-2,4-pentadienoato de etilo;

21
H

(2E)-3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-2-propenoato de 2-propenilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etiloxi)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

4-{3-[(metiloxi)metil]-4-{5-[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-1H-pirazol-1-il)-8-(trifluorometil)quinolina;

7-cloro-4-{4-[(etiloxi)metil]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}quinolina;
metanosulfonato de
(Z)-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}[(metiloxi)imino]metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(metilsulfanil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etilsulfanil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}acetonitrilo;

3-(hidroximetil)-N,N-dimetil-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

{1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[3-(4-fluorofenil)-1,2,4-oxadiazol-5-il]-1H-pirazol-5-il}metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-N-5-bis[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidoato de 2-oxiranilmetilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-[(ciclopropilmetil)oxi]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidamida;
cloruro de
1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidoilo;

- 3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-N,N-dimetil-4,5-dihidro-5-isoxazolcarboxamida;
- O-(2-metilpropanoil)oxima de (1Z)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;
- O-(ciclopropilcarbonil)oxima de (1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;
- 1-(8-fluoro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-(7-metil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[[2-(metiloxi)-5-nitrofenil]-oxi]metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-[[2-(2-bromo-3-piridinil)oxi]metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-[[4'-bromo[1,1'-bifenil]-4-il]oxi]metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluoro-metil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-cloro-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- {{{1-(7-chloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}carbonil)-(metil)amino}oxi}(oxo)acetato de metilo;
- 1-{1-(7-fluoro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1-propanona;
- O-[2-(metiloxi)acetil]oxima de (1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;
- 4-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}benzaldehído;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[[2-(etilsulfanil)fenil]oxi]metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(propiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(2-propeniloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-[(1-metilpropil)oxi]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-[(1-metiletil)oxi]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 4-{{{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}carbonil)-(metil)amino}oxi}butanoato de metilo;
- N-(3-buteniloxi)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(etiloxi)metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-7-bromoquinolina;
acetato de (3-{1-(6-fluoro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)metilo;
- 4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-6-fluoroquinolina;
- 7-etil-4-{5-[(metiloxi)metil]-4-{5-[(tetrahidro-2H-piran-2-iloxi)metil]-3-isoxazolil}-1H-pirazol-1-il}quinolina;
- 4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-7-etilquinolina;
- 3-[[{3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)metil}oxi]propanonitrilo;
- 3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4-m

etil-5-isoxazolcarboxilato de metilo;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolcarboxilato de 1,1-dimetiletilo;

3-[[3-{1-(7-etil-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)-metil]oxi]propanonitrilo;

{1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[2-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-5-il}metil-metil-éter;

7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{4-[(trifluorometil)oxi]fenil}-1H-pirazol-1-il)quinolina;

5-[(metiloxi)metil]-1-(6,7,8-tricloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[[1-(metiletil)oxi]metil]-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-[(metiloxi)metil]-5-(2-tienil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{3-[(metiloxi)metil]-1,2,4-oxadiazol-5-il}-1H-pirazol-1-il)quinolina;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxilato de 1,1-dimetiletilo;

1-(7-ciano-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

[4-[5-(bromometil)-3-isoxazolil]-1-(7-bromo-4-quinolinil)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-metil-5-[(metiloxi)metil]-N'-fenil-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,5-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1

H-pirazol-4-carbohidrazida;

- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(1,1-dimetiletil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;
- 2-metilpropanoato de (1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]-carbonil]-1H-pirazol-5-il)metilo;
- N-etil-1-(6-fluoro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(ciclopropilmetil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4,6-dimetil-4H-1,2,4-oxadiazin-5(6H)-ona;
- N-(4-cloro-2-butinil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-(etilsulfanil)-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-N-(4-morfolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-(metilsulfanil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- ciclopropanocarboxilato de (1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]-carbonil]-1H-pirazol-5-il)metilo;
- 2-tienilacetato de (1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]carbonil]-1H-pirazol-5-il)metilo;
- 7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{1-[3-(metiloxi)propil]-1H-imidazol-5-il}-1H-pirazol-1-il)quinolina;
- [1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1-metil-1H-imidazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

- {1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}[(trime
tilsilil)oxi]-acetonitrilo;
- [1-(7-bromo-4-quinolinil)-4-(1-piperidinilcarbonil)-1H-pirazol-5-il
]metil-metil-éter;
- {4-(1-piperidinilcarbonil)-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pir
azol-5-il}-metil-metil-éter;
- 5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carbonitrilo;
- 3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-2-ti
ofenocarbaldehído;
- [1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(5-etenil-1,3-oxazol-2-il)-1H-pirazol-5-
il]metil-metil-éter;
- acetato de
1-(2-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1,3-oxaz
ol-5-il)etilo;
- [1-(7-bromo-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-
5-il]metil-metil-éter;
- {4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-
pirazol-5-il}metil-metil-éter;
- [1-(7-etil-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-5-il]
metil-metil-éter;
- [1-(6-fluoro-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-
5-il]metil-metil-éter;
- N'-(2-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pi
razol-4-carbohidrazida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,4-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1
H-pirazol-4-carbohidrazida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,6-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1
H-pirazol-4-carbohidrazida;
-

27
2

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-N'-(3-metilfenil)-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

N'-(3-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

N'-(3-cloro-4-metilfenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(3,4-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(4-cianofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

(3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-i soxazolil)-metil-fenil-sulfona;

(3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-i soxazolil)-metil-etil-sulfóxido;

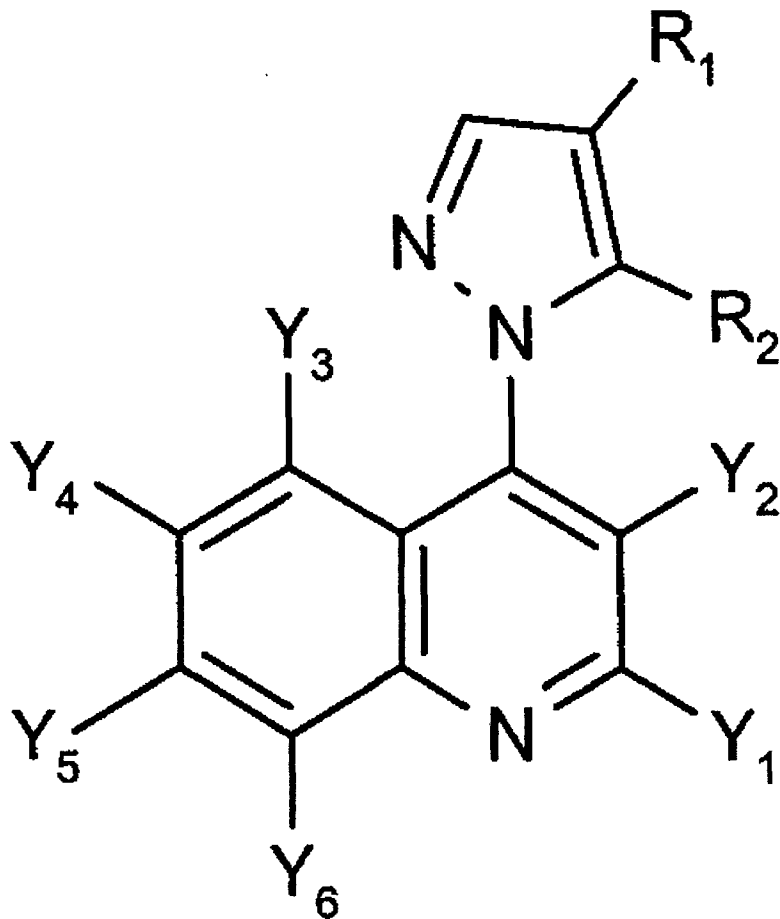
[4-(4-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-fenil-2-propin-1-ona;

N-({1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}metil)-3-(metiloxi)-1-propanamina,

así como sus posibles formas tautómeras, sus sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides.

Entre los compuestos de fórmula (I) como se han definido aquí anteriormente, un grupo de compuestos particularmente interesantes está constituido por los compuestos de fórmula general (IV):



caso particular de compuestos de fórmula (I) para los cuales R_3 representa hidrógeno y R_1 y R_2 están respectivamente en posición 4 y 5 del núcleo de pirazol, siendo R_2 , Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 tales como se han definido anteriormente,

y R_1 representa un grupo carboxi, carbamoilo, N-alquilcarbamoilo, N,N-dialquilcarbamoilo, N-alquilo, N-alcoxialquilcarbamoilo, N-alcoxycarbamoilo, N-alquil-N-amino-alquilcarbamoilo, N,N-diaminoalquilcarbamoilo, alcoxycarbonilo inferior; un nitrilo, o un grupo acilo inferior.

Los compuestos de fórmulas generales (I) y (IV) así como los

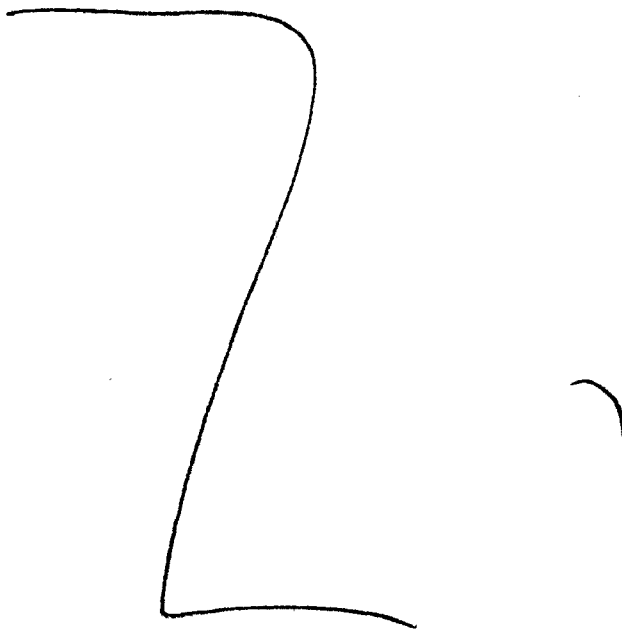
compuestos opcionalmente utilizables como intermedios en los procedimientos de preparación y que se definirán con la ocasión de la descripción de estos procedimientos, pueden existir en una o varias formas de isómeros ópticos o quirales dependiendo del número de centros asimétricos del compuesto. Por tanto, la invención se refiere tanto a todos los isómeros ópticos como a sus mezclas racémicas o escalémicas (por escalémica se entiende una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones), así como las mezclas de todos los estereoisómeros posibles en todas las proporciones. La separación de los diastereoisómeros

y/o isómeros ópticos se puede efectuar según métodos bien conocidos (E. Eliel *ibid.*).

La preparación de los reactivos utilizados en cualquiera de los métodos de preparación siguientes, es habitualmente bien conocida y está descrita habitualmente de modo específico en la técnica anterior o de una manera tal que el experto en la técnica puede adaptarla para el fin buscado.

La técnica anterior utilizable por el experto en la técnica para establecer las condiciones de preparación de los reactivos, se pueden encontrar en numerosas obras generales de química como "Advanced Organic Chemistry" de J. March, Ed. Wiley (1992), "Methoden der organischen Chemie" (Houben-Weil), Ed. Georg Thieme Verlag o los "Chemical Abstracts" Ed. American Chemical Society así como en las bases de datos informáticos accesibles al público.

Los compuestos de la presente invención de fórmulas generales (I) y (IV) así como los compuestos opcionalmente utilizables como intermedios en los procedimientos de preparación, se pueden preparar según el procedimiento siguiente:



compuestos de fórmulas (I), (II) y (III), en las cuales X representa un halógeno y R₁, R₂, R₃, Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ son como se han definido anteriormente,

efectuándose la reacción en presencia de una base orgánica o inorgánica, en ausencia o en presencia de un disolvente.

Esta reacción se efectúa generalmente a una temperatura comprendida entre -80°C y 180°C (con preferencia entre 0°C y 150°C) o al punto de ebullición del disolvente utilizado. El disolvente apropiado para esta reacción puede ser un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, octano; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno, xilenos, halógenobencenos; un éter tal como dietil-éter, diisopropil-éter, tetrahidrofurano, dioxano, dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado tal como diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano, 1,1,1-tricloroetano; un éster tal como acetato de metilo, acetato de etilo, un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo, benzonitrilo; un disolvente aprótico dipolar tal como dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metilpirrolidona, dimetilprolilenurea, dimetilsulfóxido o agua. También se pueden utilizar mezclas de estos disolventes diferentes.

La duración de la reacción depende de las condiciones utilizadas y generalmente está comprendida entre 0,1 y 48 h.

No hay ninguna limitación estricta para las proporciones relativas de los compuestos de fórmula (II) y fórmula (III). Sin embargo, es ventajoso elegir una razón molar (III)/(II) comprendida entre 0,1 y 10, con preferencia de 0,5 a 2.

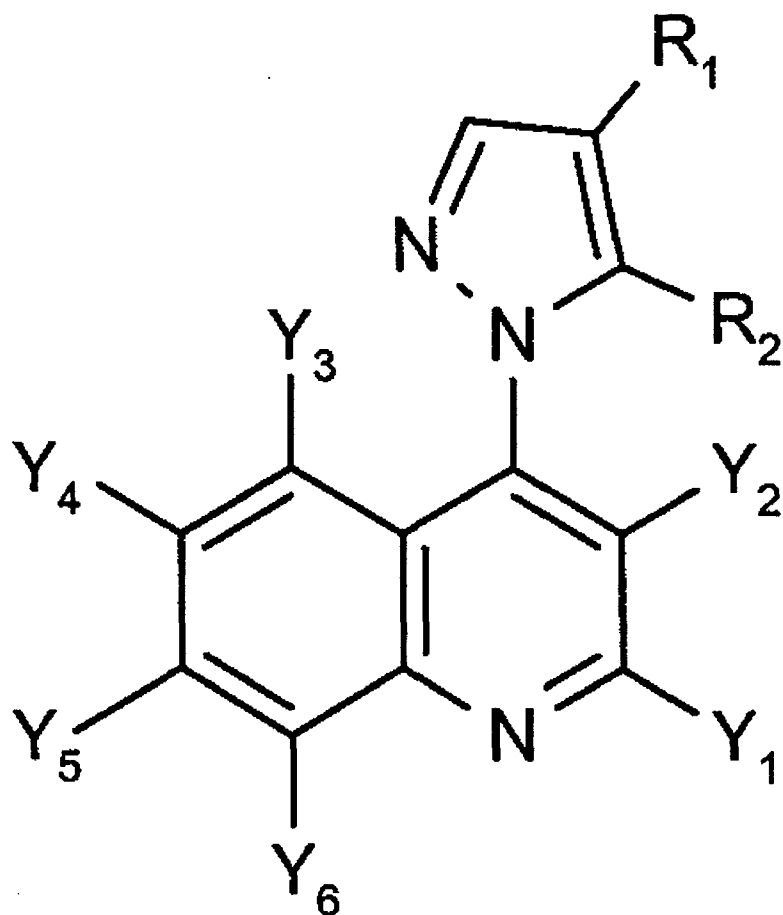
Como base orgánica o inorgánica apropiada para esta reacción, se pueden citar los hidróxidos de metales alcalinos y alcalino-térreos como hidróxido de sodio, potasio, cesio o calcio; los alcóxidos de metales alcalinos y alcalino-térreos como terc-butóxido de potasio, los hidruros de metales alcalinos y alcalino-térreos, como hidruro de sodio, potasio o cesio; los carbonatos y bicarbonatos de metales alcalinos y alcalino-térreos como carbonato de sodio, potasio, calcio o bicarbonato de sodio, potasio o calcio; bases orgánicas, con preferencia nitrogenadas, como piridina, alquilpiridinas, alquilaminas como trimetilamina, trietilamina o di-isopropiletilamina, derivados azoicos como 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, fosfazenos como 1-terc-butyl-2,2,4,4,4-pentaquis-(dimetilamino)-2λ⁵,4λ⁵-catenadi(fosfazeno).

Como referencias para esta reacción se pueden citar: Advances in Heterocyclic Chemistry, Volumen 6, páginas 414-416, para una referencia más general sobre la preparación de compuestos de fórmula (III) se puede citar

31
 7

Houben-Weyl, band E8b, Hetarene III, Teil 2 páginas 408-704, para los compuestos de fórmula (II) se puede citar Tetrahedron (1985) 41, 3033-3036 y Organic Synthesis, Col. Vol. 3, 272 (1955).

Los compuestos de fórmula (IV):



(IV)

caso particular de compuestos de fórmula (I) para los cuales R₃ representa hidrógeno y R₁ y R₂ están respectivamente en posición 4 y 5 del núcleo de pirazol, siendo R₂, Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ como se han definido anteriormente, y R₁ representa un grupo carboxi, carbamoilo, N-alquilcarbamoilo,

N,N-dialquilcarbamoilo, N-alkuil,N-alcoxialquilcarbamoilo, N-alcoxicarbamoilo, N-alkuil-N-amino-alkuilcarbamoilo, N,N-diaminoalkuilcarbamoilo, alcoxicarbonilo inferior, un nitrilo, un grupo acilo inferior,

se pueden preparar ventajosamente según la reacción siguiente (véase Houben-Weyl, band E8b, Hetarene III, Teil 2 páginas 450-472) :

7

donde X' representa un átomo de halógeno, N,N-dialquilamino o alcoxi, siendo R₁, R₂ e Y₁ a Y₆ como se han definido para los compuestos de fórmula (IV) mencionada anteriormente.

Los compuestos de fórmula (VII) se pueden preparar ventajosamente a partir de los compuestos de fórmula (II) definida anteriormente por reacción con hidrazina según técnicas clásicas conocidas por el experto en la materia.

Una vez conseguida la construcción del pirazol se pueden hacer transformaciones clásicas sobre los grupos funcionales de los sustituyentes como se describe en numerosas obras generales de química como "Advanced Organic Chemistry" de J.March, Ed. Wiley (1992), "Methoden der organischen Chemie" (Houben-Weil), Ed. Georg Thieme Verlag o los "Chemical Abstracts" Ed. American Chemical Society así como en las bases de datos informáticos accesibles al público o de manera más precisa sobre pirazoles como los descritos en Houben-Weyl, band E8b, Hetarene III, Teil 2 páginas 580-656.

La invención se refiere igualmente a composiciones fungicidas que

contienen una cantidad eficaz de al menos una materia activa de fórmula (I).

Las composiciones fungicidas según la invención comprenden un compuesto de fórmulas (I) o de fórmula (IV) o de una de sus sales aceptables en agricultura o un complejo metálico o metaloide de este compuesto, en asociación con un vehículo sólido o líquido, aceptable en agricultura y/o un agente tensioactivo también aceptable en agricultura. En particular, son utilizables los vehículos inertes y habituales y los agentes tensioactivos habituales. Estas composiciones abarcan no sólo las composiciones listas para ser aplicadas a la planta o a las semillas que hay que tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de pulverización o de espolvoreo, sino también las composiciones concentradas comerciales que deben ser diluidas antes de la aplicación al cultivo.

Estas composiciones fungicidas según la invención pueden contener también toda clase de ingredientes adicionales tales como, por ejemplo, coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizantes, secuestrantes, etc. De modo más general, las materias activas pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que corresponda a las técnicas habituales de la práctica de formulaciones.

De manera general, las composiciones según la invención contienen habitualmente de 0,05 a 95% (en peso) de materia activa, uno o varios vehículos sólidos o líquidos y, opcionalmente, uno o varios agentes tensioactivos.

Por el término "vehículo" en la presente descripción, se designa una materia orgánica o mineral, natural o sintética, con la cual se combina la materia activa para facilitar su aplicación a las partes de la planta. Este vehículo es, por tanto, generalmente inerte y debe ser aceptable en agricultura. El vehículo puede ser sólido (arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, grasas sólidas, etc.) o líquido (agua, alcoholes, especialmente butanol, etc.).

El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, dispersante o humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales agentes tensioactivos. Se pueden citar, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (especialmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácidos sulfosuccínicos, derivados de taurina (especialmente los alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilados, ésteres de ácidos grasos y polioles, derivados con función sulfato, sulfonato y fosfato de los compuestos precedentes. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente indispensable cuando la materia activa y/o el vehículo inerte no

son solubles en agua y el agente vector de aplicación es agua.

Así pues, las composiciones para uso agrícola según la invención pueden contener la materia activas entre límites muy amplios, que van de 0,05% a 95% (en peso). Su contenido en agente tensioactivo está comprendido ventajosamente entre 5% y 40% en peso. Salvo indicación en contrario los porcentajes dados en esta descripción son porcentajes en peso.

Estas composiciones según la invención están por sí mismas en formas bastante diversas, sólidas o líquidas.

Como formas de composiciones sólidas, se pueden citar polvos para espolvorear (con un contenido en materia activa que puede ir hasta 100%) y gránulos, especialmente los obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un vehículo granulado, granulación a partir de un polvo (estando el contenido en materia activa de estos gránulos entre 0,5 y 80% para este último caso).

Las composiciones fungicidas según la invención también se pueden utilizar en forma de polvos para espolvorear; también se pueden utilizar composiciones que comprenden 50 g de materia activa y 950 g de talco; también se pueden utilizar composiciones que comprenden 20 g de materia activa, 10 g de sílice finamente dividida y 970 g de talco; estos constituyentes se mezclan y se muelen y se aplica la mezcla para espolvorear.

Como formas de composiciones líquidas o destinadas a constituir composiciones líquidas durante su aplicación, se pueden citar las soluciones, en particular concentrados solubles en agua, emulsiones, suspensiones, suspensiones concentradas, polvos humectables (o polvos para pulverizar).

Las suspensiones concentradas, aplicables por pulverización, se preparan de manera que se obtenga un producto fluido estable que no se deposite y contienen habitualmente de 10 a 75% de materia activa, de 0,5 a 15% de agentes tensioactivos, de 0,1 a 10% de agentes tixotrópicos, de 0 a 10% de aditivos apropiados, como antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizantes, agentes de penetración y adhesivos y, como vehículo, agua o un líquido orgánico en el que la materia activa sea poco o nada soluble: ciertas materias sólidas orgánicas o sales minerales pueden disolverse en el vehículo para ayudar a impedir la sedimentación o como anticongelantes para el agua.

A título de ejemplo, se da a continuación una composición de suspensión concentrada:

Ejemplo SC 1:

- materia activa	500 g
- fosfato de triestirilfenol polietoxilado	50 g
- alquilfenol polietoxilado	50 g
- policarboxilato de sodio	20 g

- etilen-glicol	50 g	
- aceite organopolisiloxánico (antiespumante)		1 g
- polisacárido	1,5 g	
- agua	316,5 g	

Los polvos humectables (o polvos para pulverizar) se preparan habitualmente de manera que contengan 20 a 95% de materia activa y contienen habitualmente, además del vehículo sólido, de 0 a 30% de un agente humectante, de 3 a 20% de un agente dispersante, y cuando es necesario, de 0,1 a 10% de uno o varios estabilizantes y/u otros aditivos, como son los agentes de penetración, adhesivos, o agentes antiapelmazantes, colorantes, etc.

Para obtener los polvos para pulverizar o los polvos humectables, se mezclan íntimamente las materias activas en mezcladores apropiados con las sustancias adicionales y se muelen en molinos u otras trituradoras apropiadas. Así se obtienen polvos para pulverizar cuya humectabilidad y puesta en suspensión son ventajosas; pueden suspenderse en agua a cualquier concentración deseada y estas suspensiones son utilizables muy ventajosamente en particular para aplicación, por ejemplo, sobre las hojas de las plantas o las semillas.

A título de ejemplo, se dan a continuación diversas composiciones de polvos humectables (o polvos para pulverizar):

Ejemplo PH 1:

- materia activa	50%	
- alcohol graso etoxilado (agente humectante)		2,5%
- feniletilfenol etoxilado (agente dispersante)		5%
- creta (vehículo inerte)	42,5%	

Ejemplo PH 2:

- materia activa	10%	
- alcohol sintético oxo de tipo ramificado, de C13 etoxilado por 8 a 10 unidades de óxido de etileno (agente humectante)		0,75%
- lignosulfonato de calcio neutro (agente dispersante)		12%
- carbonato de calcio (carga inerte)		c.s.p.
100%		

Ejemplo PH 3:

Este polvo humectable contiene los mismos ingredientes que los del Ejemplo precedente, en las proporciones siguientes:

- materia activa	75%	
- agente humectante	1,50%	
- agente dispersante	8%	
- carbonato de calcio (carga inerte)		c.s.p.
100%		

Ejemplo PH 4:

- materia activa	90%	
- alcohol graso etoxilado (agente humectante)		4%
- feniletilfenol etoxilado (agente dispersante)		6%

Ejemplo PH 5:

- materia activa	50%	
- mezcla de tensioactivos aniónicos y no iónicos (agente humectante)	2,5%	
- lignosulfonato de sodio (agente dispersante)		5%
- arcilla caolínica (vehículo inerte)	42,5%	

Las dispersiones y emulsiones acuosas, por ejemplo las composiciones obtenidas al diluir un polvo humectable según la invención con ayuda de agua, están comprendidas dentro del alcance general de la presente invención. Las emulsiones pueden ser del tipo agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa como la de la "mayonesa".

Las composiciones fungicidas según la invención se pueden formular en forma de gránulos dispersables en agua, igualmente comprendidos dentro del alcance de la invención.

Estos gránulos dispersables, de densidad aparente generalmente comprendida entre aproximadamente 0,3 y 0,6, tienen un tamaño de las partículas generalmente comprendido entre aproximadamente 150 y 2.000 y con preferencia entre 300 y 1.500 micras.

El contenido de materia activa en estos gránulos está comprendido generalmente entre aproximadamente 1% y 90%, y con preferencia entre 25% y 90%.

El resto de los gránulos está compuesto esencialmente por una carga sólida y opcionalmente adyuvantes tensioactivos que confieren a los gránulos unas propiedades de dispersabilidad en agua. Estos gránulos pueden ser esencialmente de dos tipos distintos según que la carga retenida sea soluble o insoluble en agua. Cuando la carga es hidrosoluble, puede ser mineral o, con preferencia, orgánica. Se han obtenido excelentes resultados con urea. En el caso de una carga insoluble, dicha carga es con preferencia mineral, como por ejemplo caolín o bentonita. En este caso está acompañada ventajosamente

37
Z

por agentes tensioactivos (a razón de 2 a 20% en peso de gránulos) donde más de la mitad está, por ejemplo, constituida por al menos un agente dispersante, esencialmente aniónico, tal como un polinaftaleno-sulfonato de metal alcalino o alcalino-térreo o un lignosulfonato de metal alcalino o alcalino-térreo, estando constituido el resto por agentes humectantes no iónicos o aniónicos tales como un alcanoil-naftaleno-sulfonato de metal alcalino o alcalino-térreo. Por lo demás, si bien no es indispensable, se pueden añadir otros adyuvantes tales como los agentes antiespumantes.

Los gránulos según la invención se pueden preparar mezclando ingredientes necesarios y después granulando según diversas técnicas bien conocidas (grageado, lecho fluido, atomizador, extrusión, etc.). Generalmente se termina con una trituración seguida de un tamizado al tamaño de partícula elegido dentro de los límites mencionados aquí anteriormente. También se pueden utilizar gránulos obtenidos como se ha descrito anteriormente e impregnados después con una composición que contiene la materia activa.

Con preferencia, se obtienen por extrusión, al operar como se indica en los Ejemplos siguientes.

Ejemplo GD1 : Gránulos dispersables

En un mezclador se mezclan 90% en peso de materia activa y 10% en peso de urea en perlas. Seguidamente la mezcla se muele en un molino de bolas. Se obtiene un polvo que se humidifica con aproximadamente 8% en peso de agua. El polvo húmedo se extrude en un extrusor con un rulo perforado. Se obtienen gránulos que se secan, y después se trituran y tamizan, de manera que sólo se guardan respectivamente los gránulos con un tamaño comprendido entre 150 y 2.000 micras.

Ejemplo GD2 : Gránulos dispersables

En un mezclador, se mezclan los constituyentes siguientes:

- materia activa	75%	
- agente humectante (alquilnaftaleno-sulfonato de sodio)	2%	
- agente dispersante (polinaftaleno-sulfonato de sodio)		8%
- carga inerte insoluble en agua (caolín)	15%	

Esta mezcla se granula en lecho fluidizado, en presencia de agua, y después se seca, tritura y tamiza de manera que se obtienen gránulos con un tamaño comprendido entre 0,15 y 0,80 mm.

Estos gránulos pueden utilizarse a solas, en solución o dispersión en agua de manera que se obtenga la dosis deseada. También se pueden utilizar

para preparar asociaciones con otras materias activas, especialmente fungicidas, estando estos últimos en forma de polvos humectables, o de gránulos o suspensiones acuosas.

Los compuestos de la invención también se pueden mezclar con uno o varios insecticidas, fungicidas, bactericidas, acaricidas, artropodidas, nematocidas, atrayentes o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen actividad de amplio espectro. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas, por ejemplo las mezclas con fungicidas de la familia de los triazoles, derivados de la estrobilurina, etc. Los compuestos de la presente invención se pueden utilizar ventajosamente en asociación con azoxiestrobina, kresoxim-metilo, discoestrobina, carbendazim, tiram, dietofencarb, dodina, manebo, mancozebo, diflumetorim, etirimol, benomil, cimoxanil, fenpropidina, fenpropimorf, triadimefon, captano, captafol, folpel, tiofanato, tiabendazol, ácido fosfórico y sus derivados como fosetil-A1, clorotalonil, composiciones fungicidas a base de cobre, dicloran, metalaxil, iprodiona, fenamidona, oxadixil, vinclozolina, tebuconazol, bromuconazol, triticonazol, difenconazol, diniconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, procloraz, fenarimol, triadimenol, furalaxil, derivados de cobre como hidróxido y oxiclورو, probenazol, epoxiconazol, famoxadona, picoxiestrobina, fludioxonil, pirimetanil, mepanipirim, ciprodinil, quinoxifen, ferimzona, fluazinam, trifloxiestrobina, dimetomorf, benalaxil, blastidicid-S, fluquinconazol, tricloclazol, fluzilazol, derivados de valinamida, como por ejemplo iprovalicarb, flutolanil, guazatina, hexaconazol, himexazol, isoprotiolano, cazugamicina, pencicuron, ftalida, piroquilon, tetraconazol, tifulzamida y carboxina.

Las composiciones según la invención son igualmente útiles para tratar las semillas, por ejemplo de cereales (trigo, centeno, variedades triguales y cebada especialmente), patata, algodón, guisantes, colza, maíz, lino o también semillas de árboles forestales (especialmente resinosos). Se entenderá a este respecto que en el argot del experto en la materia, el término tratamiento de semillas se refiere en realidad al tratamiento de los granos. Las técnicas de aplicación son bien conocidas por el experto en la materia y se pueden utilizar sin inconveniente dentro del alcance de la presente invención. Se podrá citar por ejemplo la aplicación de películas o de revestimientos.

Se ha descubierto de manera totalmente sorprendente que los compuestos de fórmula (I) según la invención son compuestos fungicidas activos sobre una gama muy amplia de hongos fitopatógenos de los cultivos. Esta actividad se revela durante tratamientos preventivos, pero también durante tratamientos curativos. Además, esta actividad se manifiesta muy interesante incluso al emplear dosis bajas de compuestos de fórmula (I).

De manera totalmente sorprendente para compuestos que poseen tal

actividad (amplio espectro de acción y bajas dosis empleadas), estos compuestos de fórmula (I) son muy débilmente fitotóxicos o no lo son en absoluto. Es decir poseen una selectividad muy buena frente a las plantas tratadas.

Por último, los compuestos de fórmula (I) tienen un comportamiento muy favorable en relación con el medio ambiente en el sentido de que son muy débilmente ecotóxicos o no lo son en absoluto.

Así, la invención tiene por objeto adicional un procedimiento de lucha, a título curativo o preventivo, contra los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado porque las semillas, las hojas o los troncos de las plantas o el suelo donde brotan o son susceptibles de brotar estas plantas, se tratan por aplicación, pulverización o inyección de una cantidad eficaz (agronómicamente eficaz) y no fitotóxica de una materia activa de fórmulas (I) o una de sus sales aceptables en agricultura o un complejo metálico o metaloide de este compuesto igualmente aceptable en agricultura, con preferencia en forma de una composición fungicida según la invención.

Por "cantidad eficaz y no fitotóxica", se entiende una cantidad de composición según la invención suficiente para permitir la represión o la destrucción de los hongos presentes o susceptibles de aparecer en los cultivos, y que no entrañan para los cultivos mencionados ningún síntoma notable de fitotoxicidad. Tal cantidad es susceptible de variar dentro de amplios límites dependiendo del hongo que haya de combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos comprendidos en la composición fungicida según la invención. Esta cantidad puede ser determinada por ensayos sistemáticos en campo, a la disposición del experto en la materia.

La dosis de composición aplicada es, por lo general, de manera ventajosa tal que la dosis de materia activa esté comprendida entre 2 y 200 g de materia activa por 100 kg de semillas, con preferencia entre 3 y 150 g por 100 kg en el caso de los tratamientos de semillas.

En el caso de los tratamientos de plantas, generalmente se aplican dosis de 10 a 800 g/ha, con preferencia 50 a 300 g/ha en tratamiento foliar. Se entenderá que estas dosis se dan a título puramente ilustrativo para las necesidades de la presente invención.

Así, el experto en la materia podrá evaluar por sí mismo las dosis precisas de materias activas que hay que aplicar, según la naturaleza y el grado de desarrollo de los cultivos, según la naturaleza de las enfermedades que hay que erradicar y su estado de infestación, así como de las condiciones edáficas y climáticas presentes en el terreno en el momento o antes o después del o de los tratamientos.

Igualmente, el número y la frecuencia de los tratamientos podrá variar en función de los mismos criterios señalados anteriormente. Así, el experto en

la materia juzgará oportuno efectuar uno o varios tratamientos de manera preventiva, es decir antes de la aparición de las enfermedades, asociados o no asociados con uno o varios tratamientos curativos, destinados a erradicar las enfermedades que ya han aparecido.

La invención se refiere por último a un método de protección a título preventivo o curativo de los productos de multiplicación de las plantas, así como de las plantas resultantes, contra las enfermedades fúngicas, caracterizado porque dichos productos se recubren con una dosis eficaz y no fitotóxica de una composición según la invención.

Entre los productos de las multiplicaciones de las plantas referidos, se pueden citar especialmente las semillas o granos, y los tubérculos.

Como se ha indicado aquí anteriormente, las modalidades de recubrimiento de los productos de multiplicación de las plantas, especialmente de las semillas, son bien conocidas en la técnica y se recurre en particular a las técnicas de aplicación de película o revestimiento.

Los productos y las composiciones según la invención se pueden aplicar también en aplicación foliar a los cultivos vegetales.

Entre las plantas consideradas por el método según la invención se pueden citar a título de ejemplos no limitativos:

- el trigo, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: las fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*), los tizones (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* o *Tilletia indica*), la septoriosis (*Septoria nodorum*);

- el trigo, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas de las plantas: cercosporielosis (*Pseudocercospora herpotrichoides*), pietín (*Gaeumannomyces graminis*), fusariosis del pie (*F. culmorum*, *F. graminearum*), fusariosis de las espigas (*F. culmorum*, *F. graminearum*, *Microdochium nivale*), helmintosporiosis (*Pyrenophora tritici-repentis*) viruela (*Rhizoctonia cerealis*), oídio (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), rollas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);

- trigo y cebada, en lo que concierne a la lucha contra las enfermedades bacterianas y virales, por ejemplo clorosis nanisante de la cebadas.

- cebada, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: helmintosporiosis (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), carbón desnudo (*Ustilago nuda*) y fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*),

- cebada, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las plantas aéreas de las plantas: cercosporielosis (*Pseudocercospora herpotrichoides*), helmintosporiosis (*Pyrenophora teres* y

Cochliobolus sativus), oídio (*Erysiphe graminis* forma especie hordei), rolla enana (*Puccinia hordei*) y rincosporiosis (*Rhynchosporium secalis*);

- patata, en lo que concierne a la lucha contra las enfermedades de los tubérculos, (especialmente *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), mildíu (*Phytophthora infestans*) y ciertas virosis (virus Y);

- patata, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las hojas: alternariosis (*Alternaria solani*), mildíu (*Phytophthora infestans*);

- algodón, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las plantas jóvenes obtenidas a partir de semillas: enfermedades de los semilleros y necrosis del cuello (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*), la podredumbre negra de las raíces (*Thielaviopsis basicola*);

- cultivos proteaginosos, por ejemplo el guisante, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: antracnosis (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*), podredumbre gris (*Botrytis cinerea*), mildíu (*Peronospora pisi*);

- cultivos oleaginosos, por ejemplo colza, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae*, *Sclerotinia sclerotiorum*;

- maíz, en lo que concierne a la lucha contra las enfermedades de las semillas: (*Rhizopus* sp., *Penicillium* sp., *Trichoderma* sp., *Aspergillus* sp. y *Gibberella fujikuroi*);

- lino, en lo que concierne a la lucha contra la enfermedad de las semillas: *Alternaria linicola*;

- árboles forestales, en lo que concierne a la lucha contra las enfermedades de los semilleros (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*).

- cultivos de leguminosas, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas o de las plantas jóvenes obtenidas a partir de semillas: enfermedad de los semilleros y necrosis del cuello (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium* sp).

- cultivos de leguminosas, en lo que concierne a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas: la podredumbre gris (*Botrytis* sp.), oídio (especialmente *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Leveillula taurica*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), cladosporiosis (*Cladosporium* sp.), alternariosis (*Alternaria* sp.), antracnosis (*Colletotrichum* sp.), septoriosis (*Septoria* sp.), viruela (*Rhizoctonia solani*), mildíu (por ejemplo *Bremia lactucae*, *Peronospora* sp., *Pseudoperonospora* sp, *Phytophthora* sp).

- árboles frutales, en lo que concierne a enfermedades de las partes

aéreas: moniliosis (*Monilia fructigena*), roña (*Venturia inaequalis*), oídio (*Sphaerotheca fructigena*).

- vid, en lo que concierne a las enfermedades de las hojas: especialmente la podredumbre gris (*Botrytis cinerea*), oídio (*Uncinula necator*), roña negra (*Guignardia biwelli*), mildiu (*Plasmopara viticola*)

- remolacha, en lo que concierne a las siguientes enfermedades de las partes aéreas: cercosporiosis (*Cercospora beticola*), oídio (*Erysiphe beticola*), ramulariosis (*Ramularia beticola*).

El trigo y la cebada son los vegetales preferidos para poner en práctica el método según la invención.

La presente invención se refiere igualmente al tratamiento de plantas genéticamente modificadas con los compuestos según la invención o las composiciones agroquímicas según la invención. Las plantas genéticamente modificadas son plantas en cuyo genoma se ha integrado de manera estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés.

Por gen heterólogo que codifica una proteína de interés, se entiende esencialmente según la invención los genes que confieren nuevas propiedades agronómicas a la planta transformada, o los genes que mejoran la calidad agronómica de la planta transformada.

Entre los genes que confieren nuevas propiedades agronómicas a las plantas transformadas, se pueden citar los genes que confieren tolerancia a ciertos herbicidas, los que confieren resistencia a ciertos insectos, los que confieren tolerancia a ciertas enfermedades, etc. Tales genes están descritos especialmente en las Solicitudes de Patente WO 91/02071 y WO 95/06128.

Entre los genes que confieren tolerancia a ciertos herbicidas, se pueden citar el gen *Bar* que confiere tolerancia a bialafos, el gen que codifica una EPSPS apropiada que confiere resistencia a herbicidas que tienen EPSPS como blanco, como el glifosato y sus sales (documentos US 4.535.060, US 4.769.061, US 5.094.945, US 4.940.835, US 5.188.642, US 4.971.908, US 5.145.783, US 5.310.667, US 5.312.910, US 5.627.061, US 5.633.435, FR 2.736.926), el gen que codifica glifosato-óxido-reductasa (US 5.463.175), o también un gen que codifica una HPPD que confiere tolerancia a los herbicidas que tiene por blanco HPPD como los isoxazoles, especialmente isoxafutol (documentos FR 95 06800, FR 95 13570), dicetonitrilos (documentos EP 496 630, EP 496 631) o tricetonas, especialmente sulcotriona (documentos EP 625 505, EP 625 508, US 5.506.195). Tales genes que codifican una HPPD que confiere tolerancia a los herbicidas que tienen por blanco HPPD están descritos en la Solicitud de Patente WO 96/38567.

En el caso de los genes que codifican EPSPS o HPPD, y más particularmente para los genes mencionados anteriormente, la secuencia que codifica estas enzimas está precedida ventajosamente por una secuencia que

43
7

codifica un péptido de tránsito, en particular el péptido de tránsito llamado péptido de tránsito optimizado, descrito en los documentos US 5.510.471 o US 5.633.448.

Entre los genes que confieren nuevas propiedades de resistencia a los insectos, se citarán más particularmente los genes que codifican proteínas *Bt* ampliamente descritas en la bibliografía y bien conocidas por los expertos en la materia. También se citarán los genes que codifican proteínas extraídas de bacterias como *Photobacterium* (documentos WO 97/17432 y WO 98/08932).

Entre los genes que confieren nuevas propiedades de resistencia a enfermedades se citarán especialmente los genes que codifican quitinasas, glucanasas, oxalato-oxidasa, estando todas estas proteínas y sus secuencias codificantes ampliamente descritas en la bibliografía, o también los genes que codifican péptidos antibacterianos y/o antifúngicos, en particular péptidos de menos de 100 aminoácidos ricos en cisteínas, como las tioninas o defensinas de las plantas, y más particularmente los péptidos líticos de cualquier origen que comprenden uno o varios puentes disulfuro entre las cisteínas y regiones que comprenden aminoácidos básicos, especialmente los péptidos líticos siguientes: androctonina (documentos WO 97/30082 y PCT/FR98/01814, presentado el 18 de Agosto de 1998) o drosomicina (documento PCT/FR98/01462, presentado el 8 de Julio de 1998). Igualmente se citarán los genes que codifican péptidos incitadores fúngicos, en particular las elicitininas (Kamoun y col., 1993; Panabières y col., 1995).

Entre los genes que modifican la constitución de las plantas modificadas, se pueden citar en particular los genes que modifican el contenido y la calidad de ciertos ácidos grasos esenciales (documento EP 666 918) o también el contenido y la calidad de proteínas, en particular en las hojas y/o los granos de dichas plantas. Se citarán en particular los genes que codifican proteínas enriquecidas en aminoácidos sulfurados (Korit, A.A. y col., Eur. J. Biochem. (1991) 195, 329-334; documentos WO 98/20133; WO 97/41239; WO 95/31554; WO 94/20828; WO 92/14822).

La presente invención se refiere muy particularmente al tratamiento de las plantas genéticamente modificadas que comprenden un gen heterólogo que confiere a la planta propiedades de resistencia a las enfermedades. De manera preferente, el gen heterólogo confiere a la planta genéticamente modificada un espectro de actividad complementario del espectro de actividad de los compuestos según la invención.

Por espectro complementario, se entiende, según la invención, un espectro de actividad para el gen heterólogo distinto del espectro de actividad de los compuestos según la invención, o un espectro de actividad referido a agentes infecciosos idénticos, pero que permite una represión idéntica o mejorada con menores dosis de aplicación de los compuestos según la

44
E

invención.

La Tabla siguiente ilustra de manera no limitativa los ejemplos de compuestos fungicidas según la invención (los diferentes compuestos han sido analizados por espectrometría de masas; la columna « Masa observada » facilita la masa +1 o la masa -1 del pico molecular observado):

45
7

TABLE

7

Los modos operatorios presentes mencionados a continuación ilustran los procedimientos de preparación de algunos de estos compuestos.

Está claro que los procedimientos que siguen son directamente transponibles a la síntesis del conjunto de compuestos de la presente invención.

Para acceder a los compuestos de la invención, se pueden poner en práctica otras muchas vías de síntesis, fácilmente accesibles para los expertos en la materia.

46
H

9

Ejemplo 1 : Preparación del compuesto nº 11

Preparación de
3-(metoximetil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo.

Etapas 1 :

Se disuelven 50g de 4-metoxi-3-oxobutanoato de metilo en 500 ml de tolueno y después se añaden 77,3 g de dimetilacetil de N,N-dimetilformamida, y la mezcla se calienta a 90°C durante 5 horas mientras se destila por medio de un aparato Dean-Stark el metanol que se forma. A continuación se evapora el medio de reacción a vacío y se utiliza el 3-(dimetilamino)-2-(2-metoxiacetil)-2-propenoato de metilo bruto obtenido tal cual en la siguiente etapa.

Etapas 2 :

Se disuelven 40 g de 3-(dimetilamino)-2-(2-metoxiacetil)-2-propenoato de metilo en 100 ml de ácido acético y se añaden poco a poco 9,6 ml de hidrazina. A continuación se calienta durante 3 horas a 90°C. Se deja alcanzar la temperatura ambiente, se añade 1 l de agua y el ácido acético se neutraliza vertiendo suavemente bicarbonato de potasio hasta que cesa el desprendimiento de gas. A continuación se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se lava con agua. A continuación se seca sobre sulfato de magnesio y se evapora para obtener 28,7 g de 5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo en forma de un sólido marrón que se utiliza tal cual en la siguiente etapa.

Etapas 3 :

Se disuelven 5,7 g de 5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo en 60 ml de dimetilformamida y se añaden 17 ml de una solución 2 M de 1-terc-butil-2,2,4,4,4-pentaquis-(dimetilamino)-2λ⁵,4λ⁵-catenadi(fosfazeno)en tetrahydrofurano. La solución se agita durante 10 minutos y después y después se le añaden 7,74g de 4-cloro-8-trifluorometilquinoleína y se calienta durante 4 horas a 70°C. A continuación se deja que la mezcla de reacción alcance la temperatura ambiente, se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se lava con una solución saturada de cloruro de litio y después con agua. La fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se evapora y el producto bruto obtenido se purifica por cromatografía instantánea con, sucesivamente, 15 y después 30 y después 40% de acetato de etilo en heptano para obtener 8 g de un sólido beige. Este producto se puede recrystalizar en diisopropil-éter para obtener 3-(metoximetil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1H-pirazol-4-carboxilato

de metilo en forma de un sólido blanco.

P.f. = 138°C (se designa por esta expresión el punto de fusión)

Ejemplo 2 : Preparación del compuesto nº 6

Preparación

de

1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo

Se disuelven 15 g de 3-(dimetilamino)-2-(2-metoxiacetil)-2-propenoato de metilo en 100 ml de ácido acético y se añaden 14,4g de 7-cloro-4-hidrazinoquinoleína y se calienta a 90°C. Al cabo de una hora, se deja alcanzar la temperatura ambiente y se añaden 100 ml más de ácido acético. Se calienta también durante 3 horas a 90°C y después se deja alcanzar la temperatura ambiente, la mezcla se vierte en 1 l de agua y después se filtra el precipitado marrón que se forma. Se añade heptano al precipitado, se evaporan los disolventes y se obtienen 15,7 g de un sólido beige.

P.f. = 123°C.

Ejemplo 3 : Preparación del compuesto nº 61

Preparación

de

1-(7-cloro-4-quinolil)-N,N-dietil-5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxamida

A una suspensión de 6,6 ml de N,N-dietilamina en 70 ml de 1,2-dicloroetano se añaden suavemente 425 ml de una solución 2 M de trimetilaluminio en hexano a 0°C y después se agita a temperatura ambiente durante 20 minutos. A continuación se añaden 7 g de 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo y se calienta la mezcla de reacción a 75°C durante 20 horas. La mezcla se enfría a 0°C y se hidroliza suavemente con una solución de ácido clorhídrico 1 M hasta que cesa el desprendimiento de gas y se extrae con diclorometano. Después de secar y evaporar la fase orgánica, se obtienen 6,84 g de un aceite pardo que se purifica por cromatografía instantánea eluyendo con acetato de etilo/heptano 70/30 y después con acetato de etilo al 100% para obtener 3,1 g de un sólido castaño.

P.f. = 114°C.

Ejemplos de actividades biológicas de los compuestos de la invención

Ejemplo A : Ensayo *in vivo* sobre *Septoria nodorum* (septoriosis del trigo):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de la materia activa ensayada por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de

sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
— arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

A continuación, esta suspensión acuosa se diluye con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Scipion) en semilleros, sembradas sobre un sustrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por pulverización de una suspensión acuosa de esporas (500.000 esporas por cm³) de *Septoria nodorum*. Las esporas se recogen de un cultivo de siete días de vida.

Las plantas de trigo contaminadas se ponen en incubación durante 72 horas a 18°C aproximadamente, en atmósfera húmeda, y después durante 14 días a una humedad relativa de 90%.

La puntuación se efectúa 15 a 20 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 11, 135, 136, 287 y 387.

Ejemplo B : Ensayo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (oidio del trigo):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
- arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

A continuación, esta suspensión acuosa se diluye con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Audace) en semilleros, sembradas sobre un sustrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en

comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 6, 11, 61, 67, 136, 163, 170, 215, 217 y 430.

Ejemplo C : Ensayo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei* (oídio de la cebada):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
- arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

A continuación, esta suspensión acuosa se diluye con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de cebada (variedad Express) en semilleros, sembradas sobre un sustrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 11, 41, 61, 67, 91, 119, 163, 170, 215, 217, 306, 310 y 430.

Ejemplo D : Ensayo *in vivo* sobre *Puccinia recondita* (rolla parda del trigo):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de la materia activa ensayada por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
- arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

A continuación, esta suspensión acuosa se diluye con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Scipion) en semilleros, sembradas sobre un

50
R

substrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por pulverización de una suspensión acuosa de esporas (100.000 esporas por cm³) de *Puccinia recondita*. Las esporas se recogen de plantas enfermas.

Las plantas de trigo contaminadas se ponen en incubación durante 24 horas a 18°C aproximadamente, en atmósfera húmeda, y después durante 7 a 14 días a una humedad relativa de 60%.

La puntuación se efectúa 8 a 15 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 11, 88, 119, 136 y 155.

Ejemplo E : Ensayo *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (helminthosporiasis de la cebada):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
- arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

A continuación, esta suspensión acuosa se diluye con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de cebada (variedad Express) en semilleros, sembradas sobre un substrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por pulverización de una suspensión acuosa de esporas (10.000 esporas por cm³) de *Pyrenophora teres*. Las esporas se recogen de un cultivo de 10 días de vida.

Las plantas de cebada contaminadas se ponen en incubación durante 24 horas a 18°C aproximadamente, en atmósfera húmeda, y después durante 7 a 14 días a una humedad relativa de 80%.

La puntuación se efectúa 8 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

51
Z

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 11, 41, 61, 119, 136, 155, 163, 170 y 430.

Ejemplo F : Ensayo curativo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (oídio del trigo):

Plantas de trigo (variedad Audace) en semilleros, sembradas sobre un sustrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C, se contaminan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, efectuándose el espolvoreo con la ayuda de plantas enfermas.

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- agente tensioactivo Tween 80 (oleato de derivado de polioxietileno de sorbitán) diluido a 10% en agua: 5 ml/mg de materia activa,
- arcilla: vehículo inerte c.s.p. 100%.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Audace) contaminadas se tratan 48, 72 y 96 horas después de la contaminación por pulverización de la suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigos se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 500 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en el Ejemplo 67.

Ejemplo G : Ensayo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (oídio del trigo):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 µl por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Audace) en semilleros, sembradas sobre un

substrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 31, 34, 41, 43, 53, 78, 93, 94, 101 y 738.

Ejemplo H : Ensayo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei* (oídio de la cebada):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

— agua,

— mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 µl por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de cebada (variedad Express) en semilleros, sembradas sobre un substrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por pulverización de la suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 31, 34, 41, 43, 53, 78, 93, 94, 101 y 738.

Ejemplo I : Ensayo curativo *in vivo* sobre *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (oídio del trigo):

Plantas de trigo (variedad Audace) en semilleros, sembradas sobre un substrato de tierra de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12°C se tratan en la fase de 1 hoja (10 cm de altura) por espolvoreo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 µl por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de trigo (variedad Audace) contaminadas se tratan 48 horas después de la contaminación por pulverización de la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene la materia activa.

La puntuación se efectúa 7 a 14 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con el compuesto descrito en los Ejemplos 31, 34 y 67.

Ejemplo J : Ensayo *in vivo* sobre *Uncinula necator* (oídio de la vid):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

- agua,
- mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 µl por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Plantas de vid (variedad Chardoney) en semilleros se tratan en la fase de 5-6 hojas (6 semanas después de la multiplicación por estacas) por pulverización de la suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo con esporas de *Uncinula necator*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 30 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 31, 34, 43 y 67.

Ejemplo K : Ensayo *in vivo* sobre *Sphaerotheca fuliginea* (oídio de las cucurbitáceas):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

— agua,

— mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 μ l por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Pepinos (variedad Marketer) en semilleros se tratan en la fase de 2 hojas desplegadas por pulverización de la suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por espolvoreo con esporas de *Sphaerotheca fuliginea*, efectuándose el espolvoreo con ayuda de plantas enfermas.

La puntuación se efectúa 3 semanas después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una protección buena (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 31, 34, 41 y 67.

Ejemplo L : Ensayo *in vivo* sobre *Venturia inaequalis* (roña del manzano):

Se obtiene una suspensión acuosa, de 2 g/l de concentración, de materia activa de ensayo por molienda fina de la misma en la mezcla siguiente:

— agua,

— mezcla específica a base de Soprofor BS4, ciclohexanona, N-metil-pirrolidona y N-octil-pirrolidona a razón de 100 μ l por 10 mg de materia activa.

Esta suspensión acuosa se diluye a continuación con agua de manera que se obtiene la concentración deseada de materia activa.

Manzanos (variedad Golden) en semilleros se tratan en la fase de 5-6 hojas (4 a 6 semanas después de la siembra) por pulverización de la

55
\$

suspensión acuosa descrita aquí anteriormente.

Plantas utilizadas como testigo se tratan con una solución acuosa que no contiene materia activa.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan con una solución acuosa de *Venturia inaequalis* (suspensión de 150.000 esporas/ml).

La puntuación se efectúa 15 a 20 días después de la contaminación, en comparación con las plantas testigo.

En estas condiciones, se observa, a la dosis de 250 g/ha, una buena protección (al menos 50%) o total con los compuestos descritos en los Ejemplos 31, 34 y 67.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula general (I):

7.

en la cual:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquil-carbonilo, heterocicilcarbonilo, cicloalquil-oxycarbonilo, cicloalquilalquiloxycarbonilo, heterocicilil-oxycarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, tioalquiltiocarbonilo, alcoxitiocarbonilo, tioalquilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $C(=O)NR_4R_5$, $C(=S)NR_4R_5$, un radical $C(=NR_4)R_5$, un átomo de halógeno, el radical sulfonilo, el radical sulfinilo, el radical sulfanilo, el radical fosforilo y el radical fosfona, o bien, R_1 y R_2 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con

57


- uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_4R_5 ;

R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicililcarbonilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquil-oxycarbonilo, cicloalquilalquilo-oxycarbonilo, heterocicililoxycarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_5$, $\text{C}(=\text{S})\text{NR}_4\text{R}_5$ y un radical $\text{C}(=\text{NR}_4)\text{R}_5$,
- R_4 y R_5 , idénticos o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquilo-oxycarbonilo, cicloalquilalquilo-oxycarbonilo, heterocicililoxycarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo y dialquilaminoalquilo, hidrazino, o bien,

R_4 et R_5 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene de 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_7R_8 ;
- R_6 representa hidrógeno, un radical alquilo, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo y alcoxycarbonilalquilo,

- R₇ y R₈, iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquinitio, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, cicloalquiloxicarbonilo, cicloalquilalquiloxicarbonilo, heterocicililoxicarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR₆, amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, hidrazino, o bien,
- R₇ y R₈ pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y amino;

- los radicales Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; el radical hidroxilo, mercapto, nitro, tiocianato, azido, ciano o pentafluorosulfonilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquiltioalquilo, haloalquiltioalquilo, cianoalquilo, cianoalcoxi, cianoalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, un grupo cicloalquilo, halocicloalquilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquinitio, un radical arilo o heteroarilo eventualmente sustituido, un radical amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, acilamino, aminoalquilo, N-alquilaminoalquilo, N,N-dialquilaminoalquilo, acilaminoalquilo, el radical carboxi, el radical carbamoilo, un radical N-alquilcarbamoilo, N,N-dialquilcarbamoilo, alcoxycarbonilo y un radical alquilcarbonilo, o bien dos radicales adyacentes elegidos entre Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 también pueden formar, juntos y con los dos átomos de carbono a los que están unidos, un ciclo aromático de 6 miembros, o dos radicales adyacentes elegidos entre Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 también

pueden formar juntos un radical divalente metilen-di-oxi;

- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, NR_4R_5 , ciano, nitro, alquilo, alcoxialquilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, alquilcarbonilo, alquilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alquinoilcarbonilo, alquinoilcarbonilo, arilcarbonilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, halógenoalcoxi, perhalógenoalcoxi, cianoalquilcarbonilo, cicloalquilo, heterocicilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicilcarbonilo, heterocicilcarbonilo, ariloxialquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilcarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, arilcarbonilcarbonilo, heteroarilcarbonilcarbonilo, alcoxialcoxialquilcarbonilo y alquiltioalquilcarbonilo,
- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, oxo, ciano, nitro, cianato, tiocianato, formilo, propileno-dilo, amino, alquilamino, dialquilamino, pentafluorosulfonilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alqueno, alquino, alcoxi, alquiltio, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxialcarbonilo, alquilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alquinoilcarbonilo, alquinoilcarbonilo, arilcarbonilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, cicloalquilo, heterocicilo, cicloalquilcarbonilo y heterocicilcarbonilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles fórmulas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir, con la excepción de los compuestos siguientes:

- trans-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1H-pirazol-4-il]etil]tetrahydro-4-hidroxi-2H-piran-2-ona;
- trans-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1H-

- pirazol-4-il]etenil]tetrahydro-4-hidroxi-2H-piran-2-ona;
- 3-metil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-trifluorometil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-fenil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-(2-tienil)-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- los 1-(metil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(trifluorometil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(fenil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-[(2-tienil)-quinolin-4-il]-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;

endo-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-N-(9-azabicyclo[3,3,1]non-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida;

- 5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carbonitrilo;
- 4-acetil-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-1H-pirazol;
- ácido 5-metil-1-(4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxílico;
- ácido 5-ciclopropil-1-(4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxílico.

2. Compuestos según la reivindicación 1, que presentan una y/u otra de las características siguientes tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, hidroxialquilo, aminoalcoxialquilo, N-alquilaminoalcoxi-alquilo, N,N-dialquilaminoalcoxialquilo, aminoalquiltioalquilo, N-alquil-aminoalquil-tioalquilo, N,N-dialquilaminoalquiltioalquilo, alquenilo, cicloalquilo, cicloalquilcarbonilo, heterociclicarbonilo, heterociclico, cicloalquilalquilo, heterociclicilalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarboniloxialquilo, alquenilcarboniloxialquilo, alquilcarboniloxialquilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilcarboniloxi-alquilo, heteroarilcarboniloxialquilo, el radical hidroxil, el radical carboxil, el radical nitro, el radical ciano, un radical NR_4R_5 , $CH_2NR_4R_5$, $C(=O)NR_4R_5$, y un radical $C(=NR_4)R_5$,
- R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterociclico, cicloalquilalquilo, heterociclicil-alquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, el radical hidroxil, el radical mercapto, el radical carboxil, y un radical NR_4R_5 ,
- R_4 y R_5 , iguales o diferentes, se escogen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi,

alquiniloxi, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo,

un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,

el radical mercapto, el radical ciano, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo y dialquilaminoalquilo,

- R_6 representa hidrógeno, un radical alquilo, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo y alcoxycarbonilalquilo,
- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, el radical hidroxilo, mercapto, nitro, ciano o pentafluorosulfonilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, cianoalquilo, cianoalcoxi, cianoalquiltio, un radical alquenilo, alquinitio, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquinitio, un radical amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, aminoalquilo, N-alquilaminoalquilo, N,N-dialquilaminoalquilo, el radical carboxi, alcoxycarbonilo y un radical alquilcarbonilo, ou bien dos radicales adyacentes elegidos entre Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 pueden formar también juntos y con los dos átomos de carbono a los que están unidos, un ciclo aromático de 6 miembros.
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alquenilo, alquinitio, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, ciano, nitro, arilo, heteroarilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, halógenoalcoxi, perhalógenoalcoxi, cianoalquil-carboniloxi, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilcarboniloxi, heterocicilcarbonilo, heterocicilcarboniloxi, ariloxialquilcarboniloxi, alquilcarbonilalquilcarboniloxi, alcoxycarbonil-alquilcarboniloxi, arilcarbonilcarboniloxi, heteroarilcarbonil-carboniloxi, alcoxialcoxialquilcarboniloxi y alquiltioalquilcarboniloxi,

- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, escogidos entre oxo, ciano, nitro, formilo, propilen-diilo, amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, arilo, heteroarilo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alcoxi, alquiltio, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, ariloxi, cicloalquilo y heterociclilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de estos compuestos.

3. Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, que presentan una y/u otra de las características siguientes tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, hidroxialquilo, aminoalcoxialquilo, N-alquilaminoalcoxi-alquilo, N,N-dialquilaminoalcoxialquilo, aminoalquil-tioalquilo, N-alquilaminoalquil-tioalquilo, N,N-dialquilaminoalquiltioalquilo, alquenilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicililcarbonilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarbonil-oxialquilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical carboxi, un radical NR_4R_5 , $\underline{CH_2NR_4R_5}$, $C(=O)NR_4R_5$, y un radical $C(=NR_4)R_5$,
7
- R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alcoxycarbonilo, el radical carboxi, y un radical NR_4R_5 ,
- R_4 et R_5 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, y un radical OR_6 ,
- R_6 representa hidrógeno, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo y

heterociclicialquilo,

- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, el radical hidroxil, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo y haloalcoxialquilo,
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxil, halógeno, alcoxi y halógenoalcoxi,
- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre oxo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo y ariloxi,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de estos compuestos.

4. Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, que presentan una y/u otra de las características siguientes tomadas aisladamente o en combinación:

- R_1 y R_2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, cicloalquilcarbonilo, heterociclicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquilcarboniloxialquilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, ariloxialquilo, heteroariloxialquilo, el radical carboxil y un radical $C(=O)NR_4R_5$,
- R_3 representa hidrógeno,
- R_4 y R_5 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi y alcoxycarbonilalquilo,
- los radicales Y_1, Y_2, Y_3, Y_4, Y_5 e Y_6 se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un

- radical alquilo, haloalquilo y alcoxi,
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alqueno, alquino, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, halógeno, alcoxi y haloalcoxi,
- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre oxo, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, perhaloalcoxi y alcóxicarbonilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles formas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos o metaloídicos de estos compuestos.

5. Compuestos según una de las reivindicaciones precedentes, elegidos entre:

- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 3-(metoximetil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(3-nitrofenil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-*N,N*-dietil-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-*N*-metoxi-5-(metoximetil)-*N*-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(2-metoxietil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 5-(2-metoxietil)-1-(7-metoxi-4-quinolil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-[2,8-bis(trifluorometil)-4-quinolil]-*N*-metoxi-3-(metoximetil)-*N*-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-3-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(6-fluoro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxilato de 2-etoxietilo;

65
L

N-metoxi-3-(metoximetil)-*N*-metil-1-[8(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

[1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-il](1,3-tiazolidin-3-il)metanona;

2-[1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-il]-2-propanol;

1-(7-cloro-4-quinolil)-*N*-metoxi-5-(metoximetil)-*N*-propil-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

5-({4-metoxicarbonil}-1-[8(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-5-il)metoxi)-isofталato de dimetilo;

1-(7-cloro-4-quinolil)-*N*-isopropil-*N*-metoxi-5-(metoximetil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida;

4-[[1-(7-cloro-4-quinolil)-5-(metoximetil)-1*H*-pirazole-4-il]carbonil)-(metoxi)amino]butanoato de metilo;

5-[(heptanoiloxi)metil]-1-[8(trifluorometil)-4-quinolil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

7-cloro-4-{5-metoximetil}-4-[5-trifluorometil]-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1*H*-pirazol-1-il}-quinoleína;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(1,1-dimetiletil)sulfanil]metil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1*H*-pirazol-4-carbaldehído;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1-feniletetil)-1*H*-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-{3-[(metiloxi)metil]-1-[8(trifluorometil)-4-quinolinil]-1*H*-pirazol-4-il}etanona;

3-[(metiloxi)metil]-5-(metilsulfanil)-1-[8(trifluorometil)-4-quinolinil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

5-cloro-3-[(metiloxi)metil]-1-[8(trifluorometil)-4-quinolinil]-1*H*-pirazol-4-carboxilato de metilo;

oxima
(1*E*)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1*H*-pirazol-4-il}etanona

- 1-(2,7-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-1-[2-metil-8-(1-metiletil)-4-quinolinil]-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-[2-metil-7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2,5,7-trimetil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(6,8-dicloro-2-metil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(8-metil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-[2-metil-8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(6-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2-metil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-1-[2-metil-8-(metiloxi)-4-quinolinil]-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1-(2,6,8-trimetil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-[5-cloro-2-metil-8-(metiloxi)-4-quinolinil]-N-metil-N-(metiloxi)-

68
A
B

5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

1-(5,7-dicloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

5-(hidroximetil)-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

1-(6-cloro-2,8-dimetil-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

N-metil-N-(metiloxi)-5-[2-(metiloxi)etil]-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida

•

N-5-dimetil-N-(metiloxi)-1-[2-metil-8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

O-metiloxima de
1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbaldehído;

•

5-(bromometil)-1-(5,7-dicloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-3-(dibromometil)-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}etanol;

•

O-(ciclopropilmetil)oxima de
(1E)-1-{3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-il}
}etanona;

•

N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[2-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

•

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4,5-dihidro-5-isoxazol-carboxilato de metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(ciclopropilcarbonil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-oxopropanoato de etilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metildisulfanil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etildisulfanil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-[(1-metiletil)disulfanil]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbimidatoato de etilo;

O-metiloxima
(1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1-propanona;

(3E)-4-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-buten-2-ona;

(2Z,4E)-5-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-hidroxi-2,4-pentadienoato de etilo;

(2E)-3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-2-propenoato de 2-propenilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etiloxi)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

4-(3-[(metiloxi)metil]-4-{5-[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-1H-pirazol-1-il)-8-(trifluorometil)quinolina;

7-cloro-4-{4-[(etiloxi)metil]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}quinolina;
metanosulfonato
(Z)-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}[(metiloxi)i

69
E

mino]metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(metilsulfanil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(etilsulfanil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}acetonitrilo;

3-(hidroximetil)-N,N-dimetil-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

{1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[3-(4-fluorofenil)-1,2,4-oxadiazol-5-il]-1H-pirazol-5-il}metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-N-5-bis[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(3-fenil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidoato de 2-oxiranilmetilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-[(ciclopropilmetil)oxi]-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidamida;

cloruro de
1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboximidoilo;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-N,N-dimetil-4,5-dihidro-5-isoxazolcarboxamida;

O-(2-metilpropanoil)oxima de
(1Z)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;

O-(ciclopropilcarbonil)oxima de
(1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;

1-(8-fluoro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

70
R

- N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-(7-metil-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-([2-(metiloxi)-5-nitrofenil]-oxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-[(2-bromo-3-piridinil)oxi]metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-[(4'-bromo[1,1'-bifenil]-4-il)oxi]metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1-[8-(trifluoro-metil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 5-cloro-N-metil-N-(metiloxi)-3-[(metiloxi)metil]-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- {{{[1-(7-chloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il]carbonil)-(metil)amino]oxi}(oxo)acetato de metilo;
- 1-{1-(7-fluoro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1-propanona;
- O-[2-(metiloxi)acetil]oxima de (1E)-1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)-metil]-1H-pirazol-4-il}etanona;
- 4-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}benzaldehído;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-([2-(etilsulfanil)fenil]oxi)metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(propiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-(2-propeniloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-N-[(1-metilpropil)oxi]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-[(1-metiletil)oxi]-5-[(metiloxi)m

71
L

etil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

4-[[{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}carbonyl)-(metil)amino]oxi]butanoato de metilo;

N-(3-buteniloxi)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(etiloxi)metil]-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-7-bromoquinolina;

acetato de
(3-{1-(6-fluoro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)metilo;

4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-6-fluoroquinolina;

7-etil-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{5-[(tetrahidro-2H-piran-2-iloxi)metil]-3-isoxazolil}-1H-pirazol-1-il)quinolina;

4-{4-{4,5-bis[(metiloxi)metil]-3-isoxazolil}-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-1-il}-7-etilquinolina;

3-[(3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)metil]oxi]propanonitrilo;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4-metil-5-isoxazolcarboxilato de metilo;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolcarboxilato de 1,1-dimetiletilo;

3-[(3-{1-(7-etil-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)-metil]oxi]propanonitrilo;

{1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[2-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-5-il}metil-metil-éter;

72
Z

- 7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{4-[(trifluorometil)oxi]fenil}-1H-pirazol-1-il)quinolina;
- 5-[(metiloxi)metil]-1-(6,7,8-tricloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(1-metiletil)oxi]metil]-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;
- 3-[(metiloxi)metil]-5-(2-tienil)-1-[8-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;
- 7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{3-[(metiloxi)metil]-1,2,4-oxadiazol-5-il}-1H-pirazol-1-il)quinolina;
- [1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;
- [1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxilato de 1,1-dimetiletilo;
- 1-(7-ciano-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;
- [4-[5-(bromometil)-3-isoxazolil]-1-(7-bromo-4-quinolinil)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-metil-5-[(metiloxi)metil]-N'-fenil-1H-pirazol-4-carbohidrazida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,5-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;
- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(1,1-dimetiletil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;
- 2-metilpropanoato de (1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]carbonil]-1H-pirazol-5-il]metilo;
- N-etil-1-(6-fluoro-4-quinolinil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-(ciclopropilmetil)-N-metil-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-4,6-dimetil-4H-1,2,4-oxadiazin-5(6H)-ona;

N-(4-cloro-2-butilil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxilato de metilo;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-(etilsulfanil)-N-metil-N-(metiloxi)-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-N-(4-morfolinil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N-metil-N-(metiloxi)-5-(metilsulfanil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

ciclopropanocarboxilato de
(1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]carbonil]-1H-pirazol-5-il)metilo;

2-tienilacetato de
(1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-[[metil(metiloxi)amino]carbonil]-1H-pirazol-5-il)metilo;

7-cloro-4-(5-[(metiloxi)metil]-4-{1-[3-(metiloxi)propil]-1H-imidazol-5-il}-1H-pirazol-1-il)quinolina;

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(1-metil-1H-imidazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}[(trimetilsilil)oxi]-acetonitrilo;

[1-(7-bromo-4-quinolinil)-4-(1-piperidinilcarbonil)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;

{4-(1-piperidinilcarbonil)-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-pirazol-5-il}-metil-metil-éter;

5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carbonitrilo;

3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-2-ti
ofenocarbaldéido;

•

[1-(7-cloro-4-quinolinil)-4-(5-etenil-1,3-oxazol-2-il)-1H-pirazol-5-
il]metil-metil-éter;

•

acetato de
1-(2-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-1,3-oxaz
ol-5-il)etilo;

•

[1-(7-bromo-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-
5-il]metil-metil-éter;

•

{4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1-[7-(trifluorometil)-4-quinolinil]-1H-
pirazol-5-il}metil-metil-éter;

•

[1-(7-etil-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-5-il]
metil-metil-éter;

•

[1-(6-fluoro-4-quinolinil)-4-(2-isoxazolidinilcarbonil)-1H-pirazol-
5-il]metil-metil-éter;

•

N'-(2-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pi
razol-4-carbohidrazida;

•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,4-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1
H-pirazol-4-carbohidrazida;

•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(2,6-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1
H-pirazol-4-carbohidrazida;

•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-N'-(3-metilfenil)-1H-pir
azol-4-carbohidrazida;

•

N'-(3-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pi
razol-4-carbohidrazida;

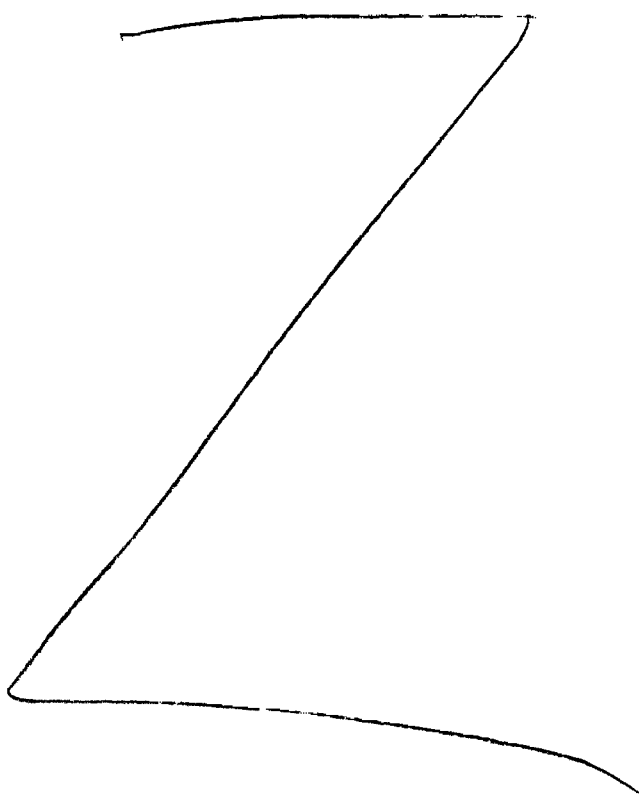
•

N'-(3-cloro-4-metilfenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)meti
l]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;

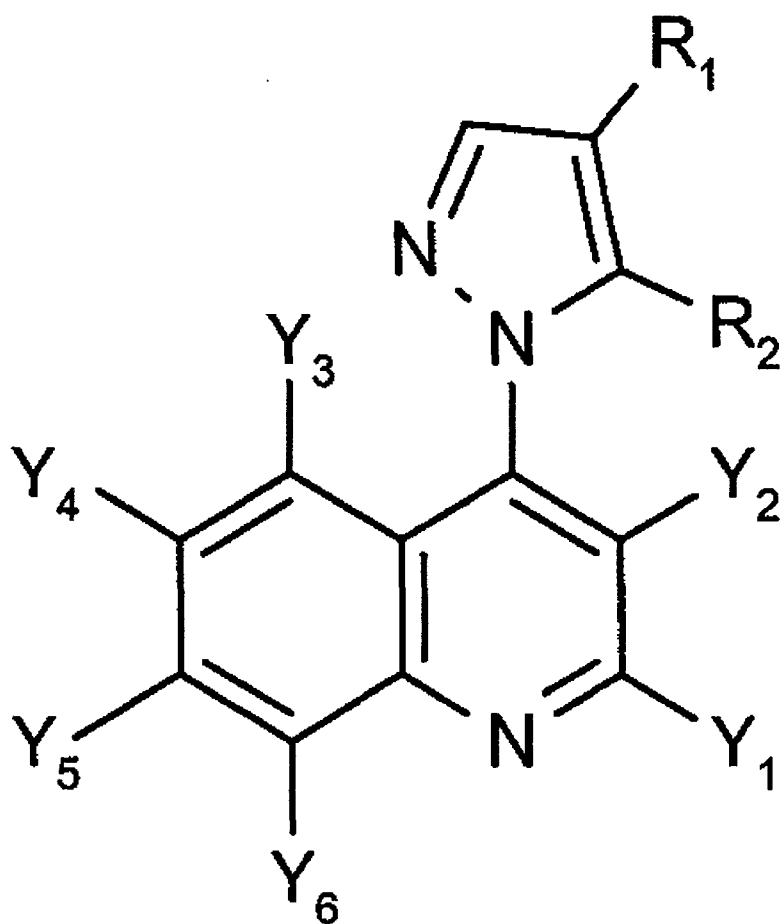
•

1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(3,4-diclorofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1
H-pirazol-4-carbohidrazida;

- 1-(7-cloro-4-quinolinil)-N'-(4-cianofenil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-carbohidrazida;
 - (3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)-metil-fenil-sulfona;
 - (3-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-5-isoxazolil)-metil-etil-sulfóxido;
 - [4-(4-clorofenil)-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-5-il]metil-metil-éter;
 - 1-{1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}-3-fenil-2-propin-1-ona;
 - N-({1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-[(metiloxi)metil]-1H-pirazol-4-il}metil)-3-(metiloxi)-1-propanamina,
así como sus posibles formas tautómeras, sus sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides.
6. Compuestos según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, de fórmula general (IV):



26
#



(IV)

caso particular de compuestos de fórmula (I) para los cuales R₃ representa hidrógeno y R₁ y R₂ están respectivamente en posición 4 y 5 del núcleo de pirazol, siendo R₂, Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ tales como se han definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, y R₁ representa un grupo carboxi, carbamoilo, N-alquilcarbamoilo, N,N-dialquilcarbamoilo, N-alquilo, N-alcoxilalquilcarbamoilo, N-alcoxicarbamoilo, N-alquil-N-amino-alquilcarbamoilo, N,N-diaminoalquilcarbamoilo, alcoxycarbonilo inferior; un nitrilo, o un grupo acilo inferior.

7. Procedimiento de preparación de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado por la reacción:

77
77

7

fórmulas (I), (II) y (III), en las cuales X representa un halógeno y R_1 , R_2 , R_3 , Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 son como se han definido en la reivindicación 1, efectuándose la reacción en presencia de una base orgánica o inorgánica, en ausencia o en presencia de un disolvente, a una temperatura comprendida entre -80°C y 180°C o al punto de ebullición del disolvente utilizado.

8. Procedimiento de preparación de compuestos según la reivindicación 6, caracterizado por la reacción:

7

?

donde X' representa un átomo de halógeno, N,N-dialquilamino o alcoxi, siendo R₁, R₂ e Y₁ a Y₆ tales como se han definido para los compuestos de fórmula (IV) aquí anteriormente.

9. Composiciones fungicidas, que comprenden como materia activa una cantidad eficaz de al menos un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 o una de sus sales aceptables en agricultura o un complejo metálico o metaloide de este compuesto igualmente aceptable en agricultura.

10. Composiciones fungicidas según la reivindicación 9, que comprenden, además de la materia activa según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 o una de sus sales aceptables en agricultura o un complejo metálico o metaloide de este compuesto igualmente aceptable en agricultura, un vehículo sólido o líquido aceptable en agricultura y/o un agente tensioactivo igualmente aceptable en agricultura.

11. Composiciones fungicidas según una de las reivindicaciones 9 ó 10, que comprenden de 0,05 a 95% en peso de materia activa.

12. Procedimiento de lucha a título preventivo o curativo contra los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado porque las hojas, los troncos de las plantas o el suelo donde brotan o son susceptibles de brotar estas plantas se tratan por aplicación, pulverización o inyección de una

79
27

cantidad agronómicamente eficaz y no fitotóxica de:

al menos un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 o una de sus sales aceptables en agricultura o un complejo metálico o metaloide de este compuesto igualmente aceptable en agricultura o una composición fungicida que comprende una materia activa según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 y/o

al menos uno de los compuestos siguientes:

- *trans*-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;
- *trans*-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etenil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;
- 3-metil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-trifluorometil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-fenil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-(2-tienil)-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- los 1-(metil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(trifluorometil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(fenil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-[(2-tienil)-quinolin-4-il]-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- endo-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-N-(9-azabicyclo[3,3,1]non-3-il)-1*H*-pirazol-3-carboxamida;
- 5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carbonitrilo;
- 4-acetil-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-1*H*-pirazol;
- ácido 5-metil-1-(4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carboxílico;
- ácido 5-ciclopropil-1-(4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carboxílico.

13. Procedimiento de tratamiento a título preventivo o curativo de los productos de la multiplicación de las plantas, así como de los vegetales resultantes, contra las enfermedades fúngicas, caracterizado porque dichos productos se recubren con una cantidad eficaz y no fitotóxica de:

el compuesto o la composición según una de las reivindicaciones precedentes y/o

al menos uno de los compuestos siguientes:

- *trans*-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;
- *trans*-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etenil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;

- 3-metil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-trifluorometil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-fenil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-(2-tienil)-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- los 1-(metil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(trifluorometil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(fenil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-[(2-tienil)-quinolin-4-il]-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
-

endo-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-N-(9-azabicyclo[3,3,1]non-3-il)-1H-pirazol-3-carboxamida;

- 5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carbonitrilo;
- 4-acetil-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-1H-pirazol;
- ácido 5-metil-1-(4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxílico;
- ácido 5-ciclopropil-1-(4-quinolinil)-1H-pirazol-4-carboxílico.

14. Procedimiento según una de las reivindicaciones 12 ó 13, en el que se tratan cereales, arroz, árboles frutales, árboles forestales, vid, cultivos oleaginosos, cultivos hortícolas, solanáceas o remolacha.

15. Procedimiento según una de las reivindicaciones 12 a 14, en el que se trata arroz, trigo, cebada, centeno, derivados del trigo, árboles frutales, maíz, algodón, lino, colza, vid, árboles forestales, guisantes, patatas o remolacha.

16. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15, en el que se trata trigo o cebada.

17. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 13 a 16, en el que se tratan las semillas de cereales, patatas, algodón, guisante, colza, maíz, lino o también las semillas de árboles forestales.

18. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 17, caracterizado porque las plantas son plantas modificadas genéticamente.

19. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 12 a 18, en el que la dosis de materia activa aplicada está comprendida entre 10 y 800 g de materia activa por hectárea, con preferencia entre 50 y 300 g de materia activa por hectárea en el caso de los tratamientos foliares.

20. Procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 13 a 18, en el que la dosis de materia activa aplicada está comprendida entre 2 y 200 g de materia activa por 100 kg de semillas, con preferencia entre 3 y 150 g por 100 kg en el caso de los tratamientos de las semillas.

81
to

RESUMEN

Compuestos de fórmula general (I):

7

en la cual R_1 , R_2 , R_3 , Y_1 , Y_2 , Y_3 , Y_4 , Y_5 e Y_6 son tales como se han definido en la descripción.

Procedimientos de tratamiento de las plantas por aplicación de estos compuestos.

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(54) TITULO: NUEVOS PIRAZOLES FUNGICIDAS.

Compuestos de fórmula general (I):

- R1 y R2 son diferentes y se eligen entre un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalqui-lo, heterociclilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquil-carbonilo, heterociclilcarbonilo, cicloalquil-oxycarbonilo, cicloalquilalquiloxi-carbonilo, heterociclil-oxycarbonilo, heterociclilalcoxycarbonilo, tioalquiltiocar-bonilo, alcoxitiocarbonilo, tioalquilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxilo, el radical nitro, el radical ciano,

el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $C(=O)NR_4R_5$, $C(=S)NR_4R_5$, un radical $C(=NR_4)R_5$, un átomo de halógeno, el radical sulfonilo, el radical sulfinilo, el radical sulfanilo, el radical fosforilo y el radical fosfona,

o bien,

R_1 y R_2 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_4R_5 ;

- R_3 se elige entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo, heterocicililcarbonilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquil-oxycarbonilo, cicloalquilalquiloxycarbonilo, heterocicililoxycarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, el radical hidroxilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical NR_4R_5 , $C(=O)NR_4R_5$, $C(=S)NR_4R_5$ y un radical $C(=NR_4)R_5$,

- R_4 y R_5 , idénticos o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cianoalquilo, alcoxialquilo, alcoxycarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalquilo, heterocicililalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cicloalquiloxycarbonilo, cicloalquilalquiloxycarbonilo, heterocicililoxycarbonilo, heterocicililalcoxycarbonilo, un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo y dialquilaminoalquilo, hidrazino,

o bien,

R_4 et R_5 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene de 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, amino y NR_7R_8 ;

- R_6 representa hidrógeno, un radical alquilo, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo y alcoxycarbonilalquilo,
- R_7 y R_8 , iguales o diferentes, se eligen entre hidrógeno, un radical alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alcoxisulfonilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, cianoalquilo,

alcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilalqui-lo, heterociclilalquilo, alquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, cicloalquiloxicarbo-nilo, cicloalquilalquiloxicarbonilo, heterocicliloxicarbonilo, heterociclilalcoxi-carbonilo,

un radical arilo, heteroarilo, arilcarbonilo, heteroarilcarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo,

el radical mercapto, el radical carboxi, el radical nitro, el radical ciano, el radical tiocianato, el radical azido, un radical OR_6 , amino, alquilamino, dialquilamino, aminoalquilo, alquilaminoalquilo dialquilaminoalquilo, hidrazino, o bien.

R7 y R8 pueden formar juntos un ciclo de 4 a 7 átomos, que contiene 2 a 3 átomos de oxígeno y/o nitrógeno, opcionalmente sustituido con uno o varios radicales elegidos entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y amino;

- los radicales Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ se eligen independientemente unos de otros entre el átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; el radical hidroxi, mercapto, nitro, tiocianato, azido, ciano o pentafluorosulfonilo, un radical alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alcoxialquilo, haloalc oxialquilo, alquiltioalquilo, haloalquiltioalquilo, cianoalquilo, cianoalco-xi, cianoalquiltio, alquilsulfinilo, haloalquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquil-sulfonilo, alcoxisulfonilo,
un grupo cicloalquilo, halocicloalquilo, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio,
un radical arilo o heteroarilo eventualmente sustituido,
un radical amino, N-alquilamino, N,N-dialquilamino, acilamino, aminoalquilo, N-alquilaminoalquilo, N,N-dialquilaminoalquilo, acilaminoalquilo,
el radical carboxi, el radical carbamoílo, un radical N-alquilcarbamoílo, N,N-dialquilcarbamoílo, alcoxicarbonilo y un radical alquilcarbonilo,
o bien
dos radicales adyacentes elegidos entre Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ también pueden formar, juntos y con los dos átomos de carbono a los que están unidos, un ciclo aromático de 6 miembros, o
dos radicales adyacentes elegidos entre Y₁, Y₂, Y₃, Y₄, Y₅ e Y₆ también pueden formar juntos un radical divalente metilen-di-oxi;
- el conjunto de los radicales definidos aquí anteriormente y que poseen una cadena hidrocarbonada (alquilo, alcoxi, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alquenilo, alquinilo, etc.) pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxi, mercapto, NR₄R₅, ciano, nitro, alquilo, alc oxialquilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alcoxi, alquiltio, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarbonilo, alquenilcarboni-loxi, alquinilcarbonilo, alquinilcarboniloxi, arilcarbonilo, arilcarboniloxi, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarboniloxi, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, halógenoalcoxi, perhalógenoalcoxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilo, heterocic lilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilcarboniloxi, heterocic lilcarbonilo, heterocic lilcarboniloxi, ariloxialquilcarboniloxi, alquilcarbonilalquilcarboniloxi,

alcoxicarbonilalquilcarboniloxi, arilcarbonilcar-boniloxi,
heteroarilcarbonilcarboniloxi, alcoxialcoxialquilcarboniloxi y
alquiltioalquilcarboniloxi,

- el conjunto de los radicales arilo y heteroarilo definidos aquí anteriormente pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios grupos o radicales, iguales o diferentes, elegidos entre hidroxilo, mercapto, oxo, ciano, nitro, cianato, tiocianato, formilo, propilen-diilo, amino, alquilamino, dialquilamino, pentafluorosulfonilo, arilo, heteroarilo, halógeno, alquilo, haloalquilo, perhaloalquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi, alquiltio, haloalcoxi, perhaloalcoxi, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alquilcarboniloxi, alquenilcarbo-nilo, alquenilcarboniloxi, alquinilcarbonilo, alquinilcarboniloxi, arilcarbonilo, arilcarboniloxi, heteroarilcarbonilo, heteroarilcarboniloxi, ariloxi, ariltio, heteroariloxi, heteroariltio, cicloalquilo, heterociclilo, cicloalquilcarbonilo y heterocicililcarbonilo,

sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, sus posibles fórmulas tautómeras,

así como las sales, N-óxidos y complejos metálicos y metaloides de los compuestos de fórmula (I) como se acaban de definir, con la excepción de los compuestos siguientes:

- trans-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;
- trans-(+/-)-6-[2-[1-(9-acridinil)-5-(4-fluorofenil)-3-(1-metiletil)-1*H*-pirazol-4-il]etenil]tetrahydro-4-hidroxi-2*H*-piran-2-ona;
- 3-metil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-trifluorometil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-fenil-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- 3-(2-tienil)-1-(4-metilquinolin-2-il)-5-trifluorometilpirazol;
- los 1-(metil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(trifluorometil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-(fenil-quinolin-4-il)-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- los 1-[(2-tienil)-quinolin-4-il]-3-metil-5-trifluorometilpirazoles;
- endo-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-N-(9-azabicyclo[3,3,1]non-3-il)-1*H*-pirazol-3-carboxamida;
- 5-amino-1-(7-cloro-4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carbonitrilo;
- 4-acetil-1-(7-cloro-4-quinolinil)-5-metil-1*H*-pirazol;
- ácido 5-metil-1-(4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carboxílico;
- ácido 5-ciclopropil-1-(4-quinolinil)-1*H*-pirazol-4-carboxílico.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REQUISITOS MINIMOS PARA ADM

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00049397 00000000 Folios: 90
Fecha (AMD): 2000-06-30 17:27:07
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION [X]

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante []
- Nombre e identificación del Inventor []
- Título o nombre de la Invención []
- Descripción 6 []
- Reivindicaciones 56 []
- Resumen 81 []
- Comprobante de Pago 3 []

COMPLETA [X]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

430.
2000/07/04

EXPEDIENTE 00-49397

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI [] NO [X] NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a).
- SI [X] NO [] NO APLICABLE [] Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94).
- SI [x] NO [] NO APLICABLE [] Presentó, en forma correcta, el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de Enero del 2000)
- SI [x] NO [] EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris.
- SI [] NO [x] NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.
- SI [] NO [x] NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).
- SI [] NO [x] CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS

OBSERVACIONES JURÍDICAS CONVENIO DE PARIS: Deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad. Debe allegar la traducción oficial del poder y el aval del Ministerio de Relaciones Exteriores del traductor oficial.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

SI [] NO [X] Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,

SI [] NO [X] Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C., 4 de Julio del 2000

EXAMINADOR JURIDICO.

202022

88

PRIMER EXAMEN DE FORMA

Radicación no 0-49397

Concepto Técnico no 1296 Clasificación Internacional de Patentes ADIN43/56

430.
2000/08/18

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | |
|--|--|
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94. |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94. |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☐ NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 18 de agosto de 2000

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

99
89

372
2000/08/18

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

1er examen de forma

CONCEPTO TÉCNICO No. 1296

EXPEDIENTE No. 0-49397

A01N43/56

El título debe complementarse indicando que se trata de los compuestos alquilpirazoles y su procedimiento de preparación.

La descripción está incompleta por lo tanto se deben presentar todas las fórmulas estructurales, la tabla y las reacciones a las cuales se hace referencia. Así mismo se debe aclarar que en los ejemplos se relaciona la preparación de los compuestos 11, 6 y 61, sin embargo en la descripción los compuestos no aparecen enumerados.

En el folio 60 de la reivindicación 1 aparece un espacio antes de " ... endo-1-(7-cloro-4-quinolinil)" por lo tanto se debe completar.

La reivindicación 1 es muy general, se presentan una infinidad de sustituyentes sobre la fórmula básica estructural que además no se anexa, y dichos sustituyentes pueden dar como resultados un número ilimitado de compuestos por lo tanto se debe limitar el alcance de la invención, adicionalmente se listan una serie de compuestos que son excepciones para lo cual se anota que en las reivindicaciones solamente se indica lo que se quiere proteger y de ninguna forma lo que no es susceptible de aplicación, en otras palabras, sólo se debe reivindicar lo que corresponde verdaderamente a la invención de tal forma que se limite el alcance de la invención.

Las reivindicaciones 2 y 3 no son coherentes ni claras, definen los significados de R1 y R2, R3 pero no corresponden a los que se definieron en la reivindicación principal 1, es de anotar que las reivindicaciones dependientes se realizan para precisar la materia que se define en la reivindicación independiente, por lo tanto no se puede salir de los ámbitos de esta última. Algunos ejemplos para R1 y R2 son alcoxialquilo, alquiltioalquilo, hidroxialquilo, N,N-dialquilaminoalcoxialquilo, CH₂NR₄R₅.

En las reivindicaciones no aparecen las fórmulas estructurales ni las reacciones, por lo tanto se debe presentar nuevo capítulo reivindicatorio completo.

Teniendo en cuenta lo anterior se debe presentar NUEVO CAPÍTULO REIVINDICATORIO COMPLETO de tal forma que sea claro y preciso.

Anexar nuevas tarjetas temático y de propietarios y el extracto para publicación con el resumen corregido.

Anexar artes finales de la fórmula estructural en tamaño 12x12 cm por duplicado y uno de 6x6 cm.

La solicitud se debe presentar en papel oficio.

Examinador Técnico de Patentes

Santa Fe de Bogotá, D.C. 18 de agosto de 2000

95
90

430.
2000/08/24

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 00-49397

AUTO 2286

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérese al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

ARTICULO SEGUNDO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los _____

22 AGO 2000

EL JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 24 AGO. 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI _____ NO _____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA