

Industria
SUPERIN

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175-00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

OKA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION
PCT- FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No.

10-134175

22. TITULO

**ÉSTERES Y TIOÉSTERES DEL ÁCIDO TIAZOL-4-
CARBOXÍLICO COMO AGENTES
FITOPROTECTORES**

CLASIFICACION
INTERNACIONAL

SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

MONHEIN, ALEMANIA

APODERADO

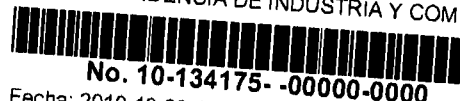
JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

Bogotá, D.C.,

30-11-2010

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175-00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 193

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

KA

1 SOLICITUD DE: ☒ Patente de Invención ☐ Patente de Modelo de Utilidad

☒ Capítulo I ☐ Capítulo II

2 SOLICITANTE (71) Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG
Dirección: Alfred-Nobel -Str. 50, 40789 MONHEIM, ALEMANIA
Nacionalidad o domicilio: MONHEIN, ALEMANIA
Lugar de Constitución: MONHEIN, ALEMANIA
Teléfono: Fax:
E-mail: IDENTIFICACIÓN
C.C. NIT
C.E. Otro
Cual:
Número:

3 REPRESENTANTE O APODERADO (72) Nombre: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS
Dirección: Avda. Carrera 24 No. 37 - 31 Of. 202 BOGOTA D.C., COLOMBIA
Teléfono: 2444096 Fax: 2442496
E-mail: IDENTIFICACIÓN
C.C. X NIT
C.E. Otro
Cuál
Número: 19.270.955 T.P. 43.308 C.S.J. BOGOTA

4 INVENTOR (ES) (72) Nombre:
Dirección: VER HOJA ANEXA
Nacionalidad o Domicilio:

5 PCT (86)
Solicitud Internacional No. PCT/EP2009/002850 Fecha: 18 - 04 - 09
Publicacion Internacional No. WO 2009/132785 A1 Fecha: 05 - 11 - 09

6 Titulo (54) ÉSTERES Y TIOÉSTERES DEL ÁCIDO TIAZOL-4-CARBOXÍLICO COMO AGENTES FITOPROTECTORES

7 Clasificación internacional (51) C07D 417/04 - C07D 417/14 - C07D 487/04

8	Prioridad	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
SI ☒ NO ☐	EP	30/04/2008	08155472.7	

9 Comprobante de pago No. Fecha:

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

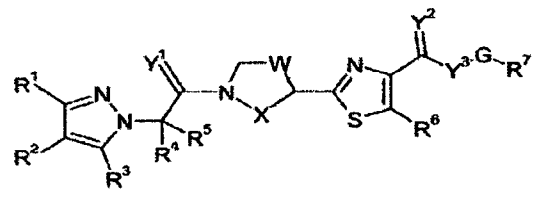
INVENTORES

- 1) **CRISTAU, Pierre**
Ehrenstrasse 96-98,
50672 Köln, ALEMANIA
Nacionalidad: Francesa
- 2) **HERRMANN, Stefan**
Virneburgstr. 4a,
40764 Langenfeld, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 3) **RAHN, Nicola**
Stresemannstrasse 17,
40210 Düsseldorf, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 4) **VOERSTE, Arnd**
Mozartstrasse 3-5,
50674 Köln, ALEMANIA,
Nacionalidad: Alemana
- 5) **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike**
Oberer Markweg 85,
56566 Neuwied, ALEMANIA,
Nacionalidad: Alemana
- 6) **TSUCHIYA, Tomoki**
Sonnenstrasse 64
40227 Düsseldorf, ALEMANIA,
Nacionalidad: Japonesa

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones
- ☐ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPER).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☒ Arte final 12X12 cm.
- ☐ De ser el caso, información de otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas total o parcialmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional, Nuevas Reivindicaciones
- ☒ Otros: Informe de Búsqueda de Antecedentes Internacional junto con la traducción
- ☒ Publicación Internacional No. WO 2009/132785 A1

FIGURA CARACTERISTICA



Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

FIRMA:

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 87,620
FECHA : OCTUBRE 19 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175-00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MARIO DELGADO ECHEVERRY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	49585815	19/10/2010	9,276,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	554,000.00
		TOTAL :	\$ 554,000.00

SON: QUINIENTOS CINCUENTA Y CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

Este recibo debe ser utilizado únicamente para trámites de Mario Delgado Echeverry e Hnos. Ltda.
Expediente: PC1/6P20091002850

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 76,854
FECHA : SEPTIEMBRE 14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175- -00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MARIO DELGADO ECHEVERRY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	150560815	14/09/2010	17,513,760.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	78,000.00
	TOTAL :	\$ 78,000.00

SON: SETENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 76,862
 FECHA : SEPTIEMBRE 14 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175-00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MARIO DELGADO ECHEVERRY	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	150560815	14/09/2010	17,513,760.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	26,000.00
	TOTAL :	\$ 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Marcas - Patentes
Modelos - Diseños
Nombres Comerciales - Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA - ICA
Acciones Judiciales - Administrativas
Derecho Comercial - Industrial
Asesoría - Contratos - Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial



Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. 22 Park Way No. 37 - 31 Of. 202
Tels. (571) 2444096 - 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com

Miembros ACPI - ASIPI - AIPPI

Abogados Consultores - Marcas y Patentes

The Undersigned José Antonio Hernández Rodríguez, citizen, adult and living in Spain, in my position of legal Representative of the company Bayer CropScience AG with headquarters in Alfred-Nobel-Strasse 50 (building 6100), 40789 Monheim, Germany, which was initially incorporated at Monheim, Germany, grant ample and sufficient power of attorney to: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS and/or CLEMENCIA DELGADO VILLEGAS, attorneys, adults, residing in Bogotá (Colombia), so that on our behalf and representation, carry out in Colombia and in any other Countries all types of errands and special procedures for the registration and renewal of all kinds of Product and Service trademarks, deposits of name and commercial logotype, industrial models and drawings, invention patents, utility models, Integrated circuits, name of domain, Copyrights, plant varieties, agricultural, veterinary and sanitary registries, capacity certificates, renewal, modification, transfer, assignment and expansions and to be responsible as general attorneys, for the supervision of all matters related to industrial and Intellectual property, being empowered to present and withdraw objections, to present appeals, to request testimonies, to receive documents, to pay legal fees, to approve exploitations, to agree on transactions on trademark agreements with third parties of legal entities, to abandon action, to substitute and to carry out all the necessary actions before any administrative authority of the aforementioned purposes in the event that such procedures shall be transferred unto a judicial field, the legal representatives are authorized to act as plaintiff or defendant before the competent authorities, having an ample power to settle, to submit to arbitration, to waive, to present appeals and all other necessary special faculties.

For that purpose, I kindly request to grant ample powers to our attorneys, who shall be able to exercise the functions independently or collectively.

The present power of attorney revokes and cancels any other previous powers of attorney given by the Company in the territory of the Colombian Republic.

Sincerely,

Atentamente se dirige a Usted José Antonio Hernández Rodríguez, ciudadano español, mayor y vecino de Madrid, para manifestarle que en mi condición de Representante legal de la firma Bayer CropScience AG domiciliada en Alfred-Nobel-Strasse 50 (building 6100), 40789 Monheim, Alemania, y constituida inicialmente en Monheim, Alemania, confiero poder general, amplio y suficiente a los Dres. JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS, y/o CLEMENCIA DELGADO VILLEGAS, Abogados, mayores y vecinos de Bogotá, D.C. (Colombia), para que en nuestro nombre y representación adelanten en Colombia y en otros países toda clase de diligencias y procedimientos especiales para el Registro y Renovación en su Despacho, de toda clase de Marcas de Producto y Servicio, Depósitos de Nombre y Enseña Comercial, Diseños Industriales y Patentes de Invención, Patentes modelo de Utilidad, Esquemas de Circuitos integrados, Nombres de dominio, Derechos de Autor, Variedades vegetales, registros agrícolas, veterinarios y sanitarios, certificados de capacidad, renovación, modificación, traspaso y ampliación de los mismos y atiendan como Apoderados generales todo asunto referente a la Propiedad Industrial e intelectual, quedando facultados para presentar y retirar Oposiciones; interponer recursos, solicitar testimonios, recibir documentos, cancelar costos legales, probar explotaciones, aceptar transacciones, llegar a acuerdos marcarios con terceras personas o entidades jurídicas, desistir, sustituir y hacer cuanto fuere necesario ante cualquier autoridad administrativa para los fines arriba indicados; y en caso de que el procedimiento debiera pasar a conocimiento judicial, quedan facultados para actuar como demandantes o demandados ante los Jueces que sean competentes, con poder amplio, pudiendo transar, someter a árbitros, desistir, interponer recursos y con todas las demás facultades especiales que fueren necesarias.

Con éste objeto, ruego le confieran personería suficiente a nuestros Apoderados quienes podrán obrar en forma conjunta o independiente e incluso sustituir el presente poder.

Atentamente,

3371530Y Madrid
ID Card No. issued in

Please, submit to a public deed by public notary

Notarial Certificate:

The undersigned Notary Public certifies that the preceding signature reading José Antonio Hernández Rodríguez is authentic: that signer is (Authorised signatory) of Bayer CropScience AG and that he is empowered to grant this power, and that said Company exists and is duly organized in accordance with the laws of Monheim, Germany.

All the foregoing facts are known to the Notary due to his having examined the respective documents to which he, the Notary, attests.

Granted and signed, at _____ on _____ 200_____

Notary Public. _____

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

=====

=====

=====

3371530Y Madrid
DNI

Certificación Notarial
El infrascripto Notario Público certifica que la firma que antecede a este documento es auténtica: que el firmante José Antonio Hernández Rodríguez es auténtico: que el firmante es (Autorizado signatory) de Bayer CropScience AG, que tiene facultades para otorgar este poder y que dicha compañía existe y es debidamente organizada de conformidad con las leyes de Monheim, Alemania.

Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los documentos respectivos de ello da fe.

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

Notario Público. _____

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

=====

=====

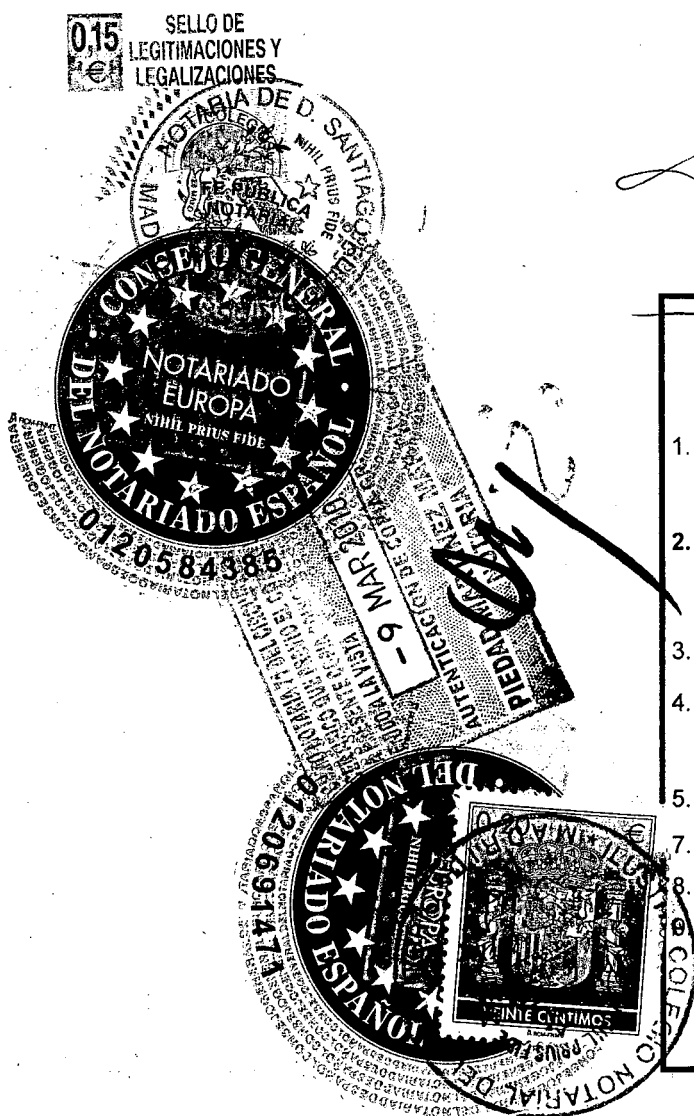
=====

LE...//

...//GITIMACIÓN: Yo, SANTIAGO RUBIO LINIERS, No-
tario del Ilustre colegio de Madrid con residencia
en esta Capital:-----

Conozco y considero legítima la firma que ante-
cede de don JOSÉ ANTONIO HERNÁNDEZ RODRÍGUEZ Y que he
levantado acta del presente documento con el número
901 ,de mi protocolo, a los efectos del artículo 207
del reglamento Notarial. En Madrid a siete de abril
de dos mil ocho. DOY FE.=.

Santiago



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

1. País: *España*
El presente documento público
2. Ha sido firmado por **D. Santiago Rubio Liniers**
3. Actuando en calidad de **NOTARIO**
4. Se halla sellado / timbrado con *el de su Notaría*

CERTIFICADO

5. En Madrid
6. El **10 . Abril . 2008**
7. Por el Decano del Colegio Notarial de Madrid.
8. Con el número **25048**
9. Sello / timbre: *[Firma]*

[Firma]
Dona M^a Nieves González de Echavarrí Díaz
Firma delegada del Decano

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
Business Planning and Administration
Law and Patents, Patents and Licensing
Alfred-Nobel-Str. 50
Building 6100
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 04 October 2010 (04.10.2010)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference BCS083033-WO	
International application No. PCT/EP2009/002850	International filing date (day/month/year) 18 April 2009 (18.04.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☐ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT Alfred-Nobel-Str. 50 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	E-mail address	
2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:		
☐ the person	☒ the name	☐ the address
☐ the nationality		
☐ the residence		
Name and Address BAYER CROPSCIENCE AG Alfred-Nobel-Str. 50 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	E-mail address ☐ Notifications by e-mail authorized	
3. Further observations, if necessary:		
4. A copy of this notification has been sent to:		
☒ the receiving Office	☐ the International Preliminary Examining Authority	
☐ the International Searching Authority	☒ the designated Offices concerned	
☐ the Authority(ies) specified for supplementary search	☐ the elected Offices concerned	
☐ other:		

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Rochaix Thomas
Facsimile No. +41 22 338 89 70	e-mail pt06.pct@wipo.int
	Telephone No. +41 22 338 74 06

ÉSTERES Y TIOÉSTERES DEL ÁCIDO TIAZOL-4-CARBOXÍLICO COMO
AGENTES FITOPROTECTORES

La invención se refiere a ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-
5 carboxílico o sus sales con actividad agroquímica, a su uso, a procedimientos
y agentes para combatir hongos dañinos fitopatógenos en y/o sobre plantas o
en y/o sobre semillas de plantas, a procedimientos para la preparación de tales
agentes y a las semillas tratadas, así como a su uso para combatir hongos
dañinos fitopatógenos en la agricultura, la horticultura y la silvicultura, en la
10 sanidad animal, en la protección de materiales y en los ámbitos doméstico e
higiénico. La presente invención se refiere asimismo a un procedimiento para
la preparación de los ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico.

Es conocido que determinadas amidas del ácido tiazol-4-carboxílico
sustituidas con piperidinilo se pueden usar como agentes fitoprotectores
15 fungicidas (véanse los documentos WO 07/014290, WO 08/091594). Sin
embargo, la eficacia fungicida de estos compuestos no siempre es suficiente,
concretamente cuando se aplican cantidades menores. Además, en muchos
casos el espectro de actividad de estas amidas es insuficiente. También se
describen algunos ésteres de ácido carboxílico como productos intermedios,
20 aunque no se describe ningún efecto biológico.

En el documento WO 04/058751 se describen ésteres y tioésteres del
ácido tiazol-4-carboxílico sustituidos con piperidinilo que se pueden usar como
fármacos para modificar la presión arterial.

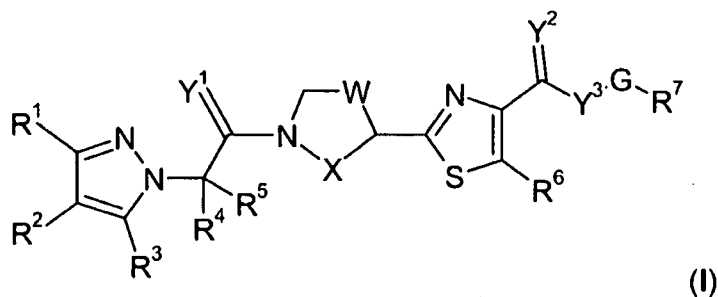
En el documento WO 05/003128 se describen otros ésteres y tioésteres
25 del ácido tiazol-4-carboxílico sustituidos con piperidinilo que se pueden usar

igualmente en medicina, en este caso como inhibidores de la proteína microsomal de transferencia de triglicéridos (inhibidores de la MTP). Sin embargo, no se describe ningún efecto sobre agentes patógenos fúngicos.

Puesto que los requisitos ecológicos y económicos que deben cumplir los agentes fitoprotectores modernos aumentan constantemente, por ejemplo en lo que al espectro de actividad, la toxicidad, la selectividad, la cantidad de aplicación, la generación de residuos y la fabricabilidad favorable se refiere, y puesto que además pueden surgir, por ejemplo, problemas de resistencias, existe el objetivo permanente de desarrollar nuevos agentes fitoprotectores que en al menos algunos aspectos presenten ventajas respecto a los conocidos.

Sorprendentemente se ha descubierto ahora que los objetivos mencionados se alcanzan, en al menos algunos aspectos, con los presentes ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico, y que éstos son adecuados como agentes fitoprotectores, en especial como fungicidas.

El objeto de la invención son compuestos de fórmula (I)



en la que los símbolos poseen los significados siguientes:

R¹ y R³ son independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, fenilo dado el caso

sustituido, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, (alquil-C₁-C₄)carbonilo, formilo, CR⁸=NOR⁹, CONR¹⁰R¹¹, (alcoxi-C₁-C₄)carbonilo, COOH, halógeno, hidroxilo o ciano,

- 5 R² es H, fenilo sustituido o no sustituido, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, (alquil-C₁-C₄)carbonilo, formilo, CR⁸=NOR⁹, CONR¹⁰R¹¹, (alcoxi-C₁-C₄)carbonilo, COOH, halógeno, hidroxilo, ciano, nitro o NR¹⁰R¹¹,

o

- 10 R¹ y R² o R² y R³ forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido, parcialmente saturado o insaturado, que puede contener hasta tres heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O y S, sin que se encuentren adyacentes dos átomos de oxígeno,

- 15 seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente entre alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, oxo, hidroxilo o halógeno,

R⁴ y R⁵ son independientemente H, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄,

o

- 20 R⁴ y R⁵ forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de 3 a 7 miembros saturado, sustituido o no sustituido, que puede contener hasta tres heteroátomos seleccionados entre N, O y S, sin que se encuentren adyacentes dos átomos de oxígeno,

seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente entre alquilo

- 25 C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, oxo, hidroxilo, halógeno,

- Y^1, Y^2, Y^3 representan independientemente azufre u oxígeno,
- X representa un enlace directo o una cadena carbonada C_1 a C_3 sustituida o no sustituida, en la que los átomos de carbono llevan como sustituyentes independientemente H, alquilo C_1-C_4 u oxo,
- 5 W representa una cadena carbonada C_1 a C_3 sustituida o no sustituida, en la que los átomos de carbono llevan como sustituyentes independientemente H, alquilo C_1-C_4 u oxo,
- R^6 representa H, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , (alquil- C_1-C_4)carbonilo, formilo, $CR^8=NOR^9$, $CONR^{10}R^{11}$, (alcoxi- C_1-C_4)carbonilo, COOH,
- 10 $NR^{10}R^{11}$, nitro, halógeno o ciano,
- G es $(C(R^{12})_2)_m$,
con $m = 0$ a 6,
- R^7 representa alquilo C_5-C_{10} , alqueno C_2-C_{16} , alquino C_2-C_{16} , cicloalquilo C_3-C_{15} , cicloalqueno C_5-C_{15} , heterociclilo C_3-C_{15} , arilo, heteroarilo o
- 15 $Si(\text{alquilo-}C_1-C_4)_3$ sustituido o no sustituido,
seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente de la lista siguiente:
- halógeno, ciano, nitro, nitroso, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , arilalquilo, arilhaloalquilo, hidroxilo, oxo, alcoxi C_1-C_4 , $O(\text{alquil-}C_1-C_6)_mO$ -alquilo
- 20 C_1-C_6 , O -cicloalquilo C_3-C_6 , O -fenilo, haloalcoxi C_1-C_4 , SH, tioalquilo C_1-C_6 , tiohaloalquilo C_1-C_6 , S-fenilo, SO_2 -alquilo C_1-C_6 , SO_2 -haloalquilo C_1-C_6 , SO -alquilo C_1-C_6 , SO -haloalquilo C_1-C_6 , CO_2H , (alquil- C_1-C_4)carbonilo, (haloalquil- C_1-C_4)carbonilo, formilo, $CR^8=NOR^9$, $CONR^{10}R^{11}$, (alcoxi- C_1-C_4)carbonilo, COOH, $NR^{10}R^{11}$, ciclopropilamino, CH_2COCH_3 , $(CH_2)_mO$ -alquilo C_1-C_6 , CH_2OH ,
- 25 CH_2SMe , $(CH_2)_2SMe$, cicloalquilo C_3-C_6 , 1-metoxiciclopropilo, 1-

clorociclopropilo, ciclohexilmetilo, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, Si(alquilo-C₁-C₄)₃, fenilo o bencilo,

o

dos sustituyentes adyacentes forman un anillo de dioxolano o de dioxano
5 sustituido, dado el caso, con metilo o halógeno,

R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ son independientemente H, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

o

R¹⁰ y R¹¹ forman, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo
de 3 a 7 miembros saturado, sustituido o no sustituido, que puede
10 contener hasta dos heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O
y S, sin que se encuentren adyacentes dos átomos de oxígeno,

seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente entre alquilo
C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, halógeno u oxo,

R¹² es igual o diferente e independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄,
15 alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄,

o

dos o cuatro R¹² en dos átomos de carbono adyacentes, respectivamente,
representan enlaces directos,

así como sus sales con actividad agroquímica.

20 Los ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I) de
acuerdo con la invención, así como sus sales con actividad agroquímica, son
excelentemente adecuados para combatir hongos dañinos fitopatógenos. Los
compuestos de acuerdo con la invención antes mencionados muestran una
alta eficacia fungicida y se pueden usar en la protección de plantas, en los
25 ámbitos doméstico e higiénico, así como en la protección de materiales.

Los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes tanto en forma pura como en mezclas de las diferentes formas isoméricas posibles, en especial de estereoisómeros, tales como los isómeros E y Z, treo y eritro, endo o exo, así como los ópticos, tales como los isómeros R y S o los atropisómeros, pero también, dado el caso, de tautómeros. Se reivindican los isómeros E y Z, los isómeros treo y eritro, así como los ópticos, cualquier mezcla de estos isómeros y las formas tautoméricas posibles.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

- 10 R^1 y R^3 son independientemente H, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, hidroxilo, ciano o fenilo,
- R^2 es H, fenilo, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , halógeno, hidroxilo, ciano o $NR^{10}R^{11}$,
- 15 o
- R^1 y R^2 forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de fenilo,
- R^4 y R^5 son independientemente H, alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o haloalquilo C_1-C_3 ,
- 20 o
- R^4 y R^5 forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropilo,
- Y^1 e Y^2 representan oxígeno,
- Y^3 representa azufre u oxígeno,
- 25 X representa un enlace directo, CH_2 o CH_2CH_2 ,

- W representa CH_2 , CH_2CH_2 o $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$,
- R^6 representa H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, NH_2 , NHMe , NMe_2 , cloro, flúor o ciano,
- G es $(\text{C}(\text{R}^{12})_2)_m$,
- 5 con $m = 0$ a 4 ,
- R^7 representa alquilo $\text{C}_5\text{-C}_{10}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{16}$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_{16}$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{15}$, cicloalquenilo $\text{C}_5\text{-C}_{15}$, heterociclilo $\text{C}_3\text{-C}_{15}$, arilo, hetarilo o $\text{Si}(\text{alquilo-C}_1\text{-C}_4)_3$ sustituido o no sustituido,
- seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente de la lista
- 10 siguiente:
- flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, CF_3 , CFH_2 , CF_2H , C_2F_5 , CCl_3 , hidroxilo, OMe , OEt , OPr , OisoPr , OBu , OsecBu , OisoBu , OtercBu , $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$, $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_3$, O-ciclohexilo, O-ciclopentilo, O-ciclopropilo, O-fenilo, OCF_3 , OCF_2H , OCH_2CF_3 , OCF_2CF_3 , SH , SMe , SEt , SCF_3 , SCF_2H , S-
- 15 fenilo, SO_2Me , SO_2CF_3 , SOMe , SOEt , CO_2H , CO_2CH_3 , CO_2Et , CO_2Pr , CO_2isoPr , CO_2tercBu , COMe , COCF_3 , NH_2 , NHMe , NMe_2 , NHet , NEt_2 , NHPr , NHisoPr , NHnBu , NHtercBu , NHisoBu , NHsecBu , ciclopropilamino, morfolinilo, piperidinilo, piperazinilo, pirrolidinilo, aziridinilo, azetidinilo, formilo, CH_2COCH_3 , CH_2OMe , $(\text{CH}_2)_2\text{OMe}$, $(\text{CH}_2)_3\text{OMe}$, CH_2OH , CH_2SMe , $(\text{CH}_2)_2\text{SMe}$, metilo, etilo,
- 20 propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, 1-metoxiciclopropilo, 1-clorociclopropilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclohexilmetilo, prop-2-en-1-ilo, 1-metilprop-2-en-1-ilo, but-3-en-1-ilo, trimetilsililmetilo, fenilo, bencilo, $-\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{C}\equiv\text{CH}$,
- 25 o

dos sustituyentes adyacentes forman un anillo de dioxolano o de dioxano sustituido, dado el caso, con metilo o halógeno,

R^{10} y R^{11} son independientemente H, metilo, etilo, isopropilo o ciclopropilo,

o

- 5 R^{10} y R^{11} forman, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo de aziridinilo, de azetidinilo, de pirrolidinilo, de piperidinilo o de morfolinilo,

R^{12} es igual o diferente e independientemente H, metilo, etilo, cloro, flúor, trifluorometilo, metoxi o ciclopropilo,

- 10 o

dos o cuatro R^{12} en dos átomos de carbono adyacentes, respectivamente, representan enlaces directos,

así como sus sales con actividad agroquímica.

Se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que uno

- 15 o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

R^1 representa alquilo C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 ,

R^2 representa H, haloalquilo C_1-C_2 o halógeno,

o

R^1 y R^2 forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un

- 20 anillo de fenilo,

R^3 representa H, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 o fenilo,

R^4 representa H, alquilo C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 ,

R^5 representa H, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 o ciclopropilo,

o

- 25 R^4 y R^5 forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo

de ciclopropilo,

- Y¹ representa oxígeno,
 Y² representa oxígeno,
 Y³ representa azufre u oxígeno,
 5 X representa CH₂ o CH₂CH₂,
 W representa CH₂, CH₂CH₂ o CH₂CH₂CH₂,
 R⁶ representa H o metilo,
 G es (C(R¹²)₂)_m,
 con m = 0 a 4,
 10 R⁷ representa alquilo C₅-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₆, alquinilo C₂-C₁₆, cicloalquilo C₃-C₁₅, cicloalquenilo C₅-C₁₅, heterociclilo C₃-C₁₅, arilo, hetarilo o Si(alquilo C₁-C₄)₃,

seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente de la lista siguiente:

- 15 flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, CF₃, hidroxilo, OMe, O-fenilo, OCF₃, OCF₂H, OCH₂CF₃, OCF₂CF₃, SMe, S-fenilo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, fenilo, bencilo, -CH=CH₂, -CH₂CH=CH₂ o -C≡CH,
 R¹² es igual o diferente e independientemente H, metilo o etilo,
 20 así como sus sales con actividad agroquímica.

Se prefieren muy especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

- R¹ representa metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo o pentafluoroetilo,
 25 R² representa H o cloro,

o

R¹ y R² forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de fenilo,

5 R³ representa H, metilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo o fenilo,

R⁴ representa H o metilo,

R⁵ representa H, metilo o ciclopropilo,

o

10 R⁴ y R⁵ forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de ciclopropilo,

Y¹ representa oxígeno,

Y² representa oxígeno,

Y³ representa azufre u oxígeno,

X representa CH₂ o CH₂CH₂,

15 W representa CH₂, CH₂CH₂ o CH₂CH₂CH₂,

R⁶ representa H o metilo,

G representa un enlace directo, CH₂, CH₂CH₂, CH(CH₃), CH(CH₂CH₃) o CH(CF₃),

20 R⁷ representa metilo, terc-butilo, heptan-3-ilo, octilo, (1Z)-prop-1-en-1-ilo, (E)-2-feniletlenilo, hex-1-en-3-ilo, difenilmetilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decahidronaftalen-1-ilo, 1,4-dioxaespiro[4.5]dec-8-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 25 ciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo,

ciclopentilo, 1-etinilciclopentilo, ciclohexilo, 2-metilciclohexilo, 2,6-dimetilciclohexilo, 4-terc-butilciclohexilo, 5-metil-2-(propan-2-il)-ciclohexilo, 3-metil-5-(propan-2-il)ciclohexilo, 1-cianociclohexilo, 1-etinilciclohexilo, cicloheptilo, ciclopropil(fenil)metilo, (1S,2R)-1,7,7-trimetilbiciclo[2.2.1]hept-2-ilo, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-bromofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-nitrofenilo, 2-(trifluorometil)fenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, 4-(trifluorometil)fenilo, 2-(trifluorometoxi)fenilo, 4-(trifluorometoxi)fenilo, 4-terc-butilfenilo, bifenil-2-ilo, bifenil-3-ilo, bifenil-4-ilo, 3-fenoxifenilo, 4-fenoxifenilo, 2-[1-metoxi-2-(metilamino)-2-oxoetil]fenilo, 2-[(metilamino)(oxo)acetil]fenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, feniletinilo, 2-tienilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-5-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, trifluorometilo, morfolin-4-ilo, piperidin-1-ilo, pirrolidin-1-ilo, 4-metilpiperazin-1-ilo, dimetilamino o trimetilsililo,

así como sus sales con actividad agroquímica.

Los más preferidos son los compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

R¹ representa metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo o pentafluoroetilo,

R² representa H o cloro,

R³ representa H, metilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo o fenilo,

- R^4 representa H o metilo,
 R^5 representa H o metilo,
 Y^1 representa oxígeno,
 Y^2 representa oxígeno,
5 Y^3 representa azufre u oxígeno,
 X representa CH_2 o CH_2CH_2 ,
 W representa CH_2 o CH_2CH_2 ,
 R^6 representa H,
 G representa un enlace directo, CH_2 , CH_2CH_2 , $CH(CH_3)$ o $CH(CH_2CH_3)$,
10 R^7 representa heptan-3-ilo, octilo, (1Z)-prop-1-en-1-ilo, (E)-2-feniletlenilo, hex-1-en-3-ilo, difenilmetilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decahidro-naftalen-1-ilo, 1,4-dioxaspiro
15 [4.5]dec-8-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, ciclopropilo, ciclopentilo, 1-etinilciclopentilo, ciclohexilo, 2-metilciclohexilo, 2,6-dimetilciclohexilo, 4-terc-butilciclohexilo, 5-metil-2-(propan-2-il)-ciclohexilo, 3-metil-5-(propan-2-il)ciclohexilo, 1-cianociclohexilo, 1-etinilciclohexilo, cicloheptilo, ciclopropil(fenil)metilo,
20 (1S,2R)-1,7,7-trimetilbiciclo[2.2.1]hept-2-ilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-nitrofenilo, 2-(trifluorometil)-
25 fenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, 4-(trifluorometil)fenilo, 2-(trifluorometoxi)-

fenilo, 4-(trifluorometoxi)fenilo, 4-terc-butilfenilo, bifenil-2-ilo, bifenil-3-ilo, bifenil-4-ilo, 3-fenoxifenilo, 4-fenoxifenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, feniletinilo, 2-tienilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-5-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 5 trifluorometilo, dimetilamino o trimetilsililo, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:
R¹ representa alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₂,
10 R² representa H y
R³ representa alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₂,
presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:
R¹ representa metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo o pentafluoroetilo,
R² representa H y
20 R³ representa metilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo o fenilo,
presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en
25 la que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

X representa CH_2CH_2 y

W representa CH_2 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 5 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

Y^3 representa oxígeno,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 10 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^6 representa H,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

G representa CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$ o $\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)$,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 20 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa alquilo $\text{C}_5\text{-C}_{10}$,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 25 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en

la que

R^7 representa alquilo C_5-C_8 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 5 Asimismo se prefieren muy especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa heptan-3-ilo u octilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 10 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa alquenilo C_2-C_{16} ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa alquenilo C_2-C_6 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 20 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa (1Z)-prop-1-en-1-ilo o hex-1-en-3-ilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 25 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en

la que

R^7 representa alquino C_2-C_{16} ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 5 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa alquino C_2-C_6 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 10 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa cicloalquilo C_3-C_{15} ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa cicloalquilo C_3-C_8 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 20 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 25 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en

la que

R^7 representa cicloalquenilo C_5-C_{15} ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 5 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa cicloalquenilo C_5-C_8 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 10 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa heterociclilo C_3-C_{15} ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa heterociclilo C_5-C_6 ,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 20 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa arilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 25 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en

la que

R⁷ representa fenilo, o naftilo o indenilo saturado o parcial o totalmente insaturado, sustituido o no sustituido,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R⁷ representa fenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decahidronaftalen-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R⁷ representa hetarilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R⁷ representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo,

imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, 5 piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazin-2-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, benzimidazol-1-ilo, benzimidazol-2-ilo, benzimidazol-4-ilo, benzimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, 10 indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 15 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, 20 isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

25 R^7 representa piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-

6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-5-ilo o 1,3-benzoxazol-4-ilo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 5 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa $\text{Si}(\text{alquilo } C_1-C_4)_3$,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 10 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa $\text{Si}(\text{alquilo } C_1-C_2)_3$,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 15 Asimismo se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que

R^7 representa trimetilsililo,

presentando los demás sustituyentes uno o varios de los significados antes mencionados, así como sus sales con actividad agroquímica.

- 20 Dependiendo del tipo de sustituyentes antes definidos, los compuestos de fórmula (I) presentan propiedades ácidas o básicas y pueden formar sales, dado el caso también sales internas, o aductos con ácidos inorgánicos u orgánicos o con bases o iones metálicos. Si los compuestos de fórmula (I) llevan amino, alquilamino u otros grupos que inducen propiedades básicas,
- 25 estos compuestos se pueden hacer reaccionar con ácidos para dar sales o se

generan directamente como sales en la síntesis. Si los compuestos de fórmula (I) llevan hidroxilo, carboxilo u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos se pueden hacer reaccionar con bases para dar sales. Las bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxidos, carbonatos, hidrogenocarbonatos de los metales alcalinos y alcalinotérreos, especialmente los de sodio, potasio, magnesio y calcio, así como amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias con grupos alquilo C_1-C_4 , mono-, di- y trialcanolaminas de alcoholes C_1-C_4 , colina y clorocolina.

Las sales que se puede obtener de este modo presentan igualmente propiedades fungicidas.

Ejemplos de ácidos inorgánicos son hidrácidos halogenados, tales como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico, y sales ácidas tales como $NaHSO_4$ y $KHSO_4$. Como ácidos orgánicos se consideran, por ejemplo, ácido fórmico, ácido carbónico y ácidos alcanoicos, tales como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico, así como ácido glicólico, ácido tiociánico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con restos alquilo lineales o ramificados con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o arildisulfónicos (restos aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que llevan uno o dos grupos ácido sulfónico), ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con restos alquilo lineales o ramificados con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfónicos o arildifosfónicos (restos aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que llevan uno o dos restos ácido fosfónico), pudiendo llevar los restos alquilo o arilo sustituyentes adicionales,

por ejemplo ácido p-toluenosulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc..

Como iones metálicos se consideran, en particular, los iones de los elementos del segundo grupo principal, especialmente calcio y magnesio, del
5 tercer y cuarto grupo principal, especialmente aluminio, estaño y plomo, así como de los subgrupos uno a ocho, especialmente cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, cinc y otros. Se prefieren especialmente los iones metálicos de los elementos del cuarto periodo. Los metales pueden estar presentes con sus diferentes valencias.

10 Los grupos dado el caso sustituidos pueden estar mono- o polisustituidos, en los que en el caso de las polisustituciones los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

En las definiciones de los símbolos dadas en las fórmulas precedentes se han usado términos colectivos que son representativos de los sustituyentes
15 siguientes:

Halógeno: Flúor, cloro, bromo y yodo;

Arilo: Sistema de anillos mono-, bi- o tricíclico de 5 a 15 miembros, no sustituido o, dado el caso, sustituido y parcial o totalmente insaturado, con hasta 3 miembros de anillo seleccionados de los grupos C(=O), (C=S), en el
20 que al menos uno de los anillos del sistema de anillos está totalmente insaturado, como, por ejemplo (pero sin limitarse a), benceno, naftaleno, tetrahidronaftaleno, antraceno, indano, fenantreno, azuleno.

Alquilo: Restos hidrocarbonados saturados, lineales o ramificados con 1 a 10 átomos de carbono, como, por ejemplo (pero sin limitarse a), metilo,
25 etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo,

pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 5 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, 1-metilhexilo, octilo, 1,1-dimetilhexilo, 2-etilhexilo, 1-etilhexilo, nonilo, 1,2,2-trimetilhexilo, decilo.

Haloalquilo: Grupos alquilo lineales o ramificados con 1 a 4 átomos de carbono (como los que se han mencionado anteriormente), en los que los 10 átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar sustituidos parcial o totalmente por átomos de halógeno tales como los que se han mencionado anteriormente, por ejemplo (pero sin limitarse a) haloalquilo C_1-C_2 , como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, 15 clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

Alquenilo: Restos hidrocarbonados insaturados, lineales o ramificados 20 con 2 a 16 átomos de carbono y al menos un enlace doble en una posición cualquiera, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) alquenilo C_2-C_6 , como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 25 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-

metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

15 **Alquínilo:** Grupos hidrocarbonados lineales o ramificados con 2 a 16 átomos de carbono y al menos un enlace triple en una posición cualquiera, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) alquínilo C_2-C_6 , como etínilo, 1-propínilo, 2-propínilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propínilo, 1-pentínilo, 2-pentínilo, 3-pentínilo, 4-pentínilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propínilo, 1-etil-2-propínilo, 1-hexínilo, 2-hexínilo, 3-hexínilo, 4-hexínilo, 5-hexínilo, 1-metil-2-pentínilo, 1-metil-3-pentínilo, 1-metil-4-pentínilo, 2-metil-3-pentínilo, 2-metil-4-pentínilo, 3-metil-1-pentínilo, 3-metil-4-pentínilo, 4-metil-1-pentínilo, 4-metil-2-pentínilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-

butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

Alcoxi: Restos alcoxi saturados, lineales o ramificados con 1 a 4 átomos de carbono, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) alcoxi C₁-C₄, como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi,
5 1,1-dimetiletoxi;

Haloalcoxi: Grupos alcoxi lineales o ramificados con 1 a 4 átomos de carbono (como los que se han mencionado anteriormente), en los que los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar sustituidos parcial o totalmente por átomos de halógeno tales como los que se han mencionado
10 anteriormente, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) haloalcoxi C₁-C₂, como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2-difluoroetoxi,
15 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi;

Tioalquilo: Restos alquiltio saturados, lineales o ramificados con 1 a 6 átomos de carbono, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) alquil-C₁-C₆-tio, como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-
20 metilpropiltio, 1,1-dimetileltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio,
25 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio;

Tiohaloalquilo: Grupos alquiltio lineales o ramificados con 1 a 6 átomos de carbono (como los que se han mencionado anteriormente), en los que los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden estar sustituidos parcial o totalmente por átomos de halógeno tales como los que se han mencionado anteriormente, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) haloalquil-C₁-C₂-tio, como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoroetiltio y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio;

Cicloalquilo: Grupos hidrocarbonados mono-, bi- o tricíclicos saturados con 3 a 12 miembros de carbono en los anillos, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo, biciclo[1,0,1]butano, decalinilo, norbornilo;

Cicloalquenilo: Grupos hidrocarbonados mono-, bi- o tricíclicos no aromáticos con 5 a 15 miembros de carbono en los anillos y con al menos un enlace doble, como, por ejemplo (pero sin limitarse a) ciclopenten-1-ilo, ciclohexen-1-ilo, ciclohepta-1,3-dien-1-ilo, norbornen-1-ilo;

(Alcoxi)carbonilo: Un grupo alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono (como los que se han mencionado anteriormente) que está unido al esqueleto a través de un grupo carbonilo (-CO-);

Heterociclilo: Heterociclo saturado o parcialmente insaturado de tres a quince miembros que contiene entre uno y cuatro heteroátomos del grupo formado por oxígeno, nitrógeno o azufre: Heterociclos mono-, bi- o

- tríclicos que, además de los miembros de carbono de los anillos, contienen entre uno y tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o de azufre; si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, éstos no se encuentran directamente adyacentes; como, por
- 5 ejemplo (pero sin limitarse a) oxiranilo, aziridinilo, 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-
- 10 tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-
- 15 ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-
- 20 isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-
- 25 dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-

dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo;

Hetarilo: Sistema de anillos mono-, bi- o tricíclico de 5 a 15 miembros, no sustituido o, dado el caso, sustituido y parcial o totalmente insaturado, en el que al menos uno de los anillos del sistema de anillos está totalmente insaturado, y que **contiene entre uno y cuatro heteroátomos del grupo formado por oxígeno, nitrógeno o azufre**; si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, éstos no se encuentran directamente adyacentes;

como, por ejemplo (sin limitarse a)

- 15 - **heteroarilo de 5 miembros que contiene entre uno y cuatro átomos de nitrógeno o entre uno y tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno:** Grupos heteroarilo de 5 miembros en el anillo que pueden contener, además de los átomos de carbono, entre uno y cuatro átomos de nitrógeno o entre uno y tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros del anillo, por ejemplo 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo,
- 25

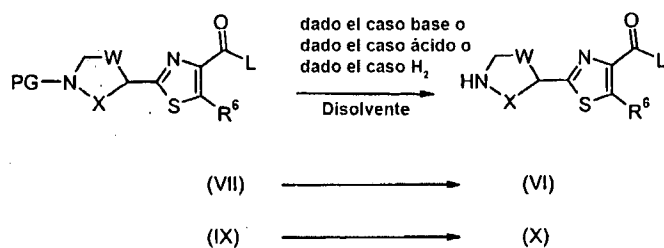
1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

- **heteroarilo benzocondensado de 5 miembros que contiene entre uno y tres átomos de nitrógeno o un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o de azufre:** Grupos heteroarilo de 5 miembros en el anillo que pueden contener, además de los átomos de carbono, entre uno y cuatro átomos de nitrógeno o entre uno y tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno como miembros del anillo, y en los que dos miembros de carbono adyacentes en el anillo o un miembro de nitrógeno y uno de carbono adyacente en el anillo pueden estar puenteados por un grupo buta-1,3-dien-1,4-diilo, en el que uno o dos átomos de C pueden estar sustituidos por átomos de N; por ejemplo bencindolilo, bencimidazolilo, benzotiazolilo, benzopirazolilo, benzofurilo;
- **heteroarilo de 5 miembros unido a través de nitrógeno que contiene entre uno y cuatro átomos de nitrógeno, o heteroarilo benzocondensado de 5 miembros unido a través de nitrógeno que contiene entre uno y tres átomos de nitrógeno:** Grupos heteroarilo de 5 miembros en el anillo que pueden contener, además de los átomos de carbono, entre uno y cuatro átomos de nitrógeno o entre uno y tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo, y en los que dos miembros de carbono adyacentes en el anillo o un miembro de nitrógeno y uno de carbono adyacente en el anillo pueden estar puenteados por un grupo buta-1,3-dien-1,4-diilo, en el que uno o dos átomos de C pueden estar sustituidos por átomos de N, estando unidos estos anillos al esqueleto a través de uno de los miembros de nitrógeno del anillo, por ejemplo 1-pirrolilo, 1-pirazolilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1-imidazolilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-1-ilo;

- **heteroarilo de 6 miembros que contiene entre uno y tres o entre uno y cuatro átomos de nitrógeno:** Grupos heteroarilo de 6 miembros en el anillo que pueden contener, además de los átomos de carbono, entre uno y tres o entre uno y cuatro átomos de nitrógeno como miembros del anillo, por ejemplo 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo.

- No se incluyen aquellas combinaciones que violan las leyes físicas y que el experto habría excluido por ello en base a sus conocimientos técnicos.
- 10 Quedan excluidas, por ejemplo, las estructuras cíclicas con tres o varios átomos de O adyacentes.

- Otro objeto de la presente invención es un procedimiento para la preparación de los ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I) de acuerdo con la invención, que comprende al menos uno de los pasos (a) a (e) siguientes:
- 15 (a) Reacción de compuestos de fórmula (VII) o (IX) para dar compuestos de fórmula (VI) o (X), dado el caso en presencia de un disolvente y, dado el caso, en presencia de un ácido o, dado el caso, en presencia de una base o, dado el caso, en presencia de una fuente de hidrógeno, conforme al siguiente
- 20 esquema de reacción (esquema 1):



en el que

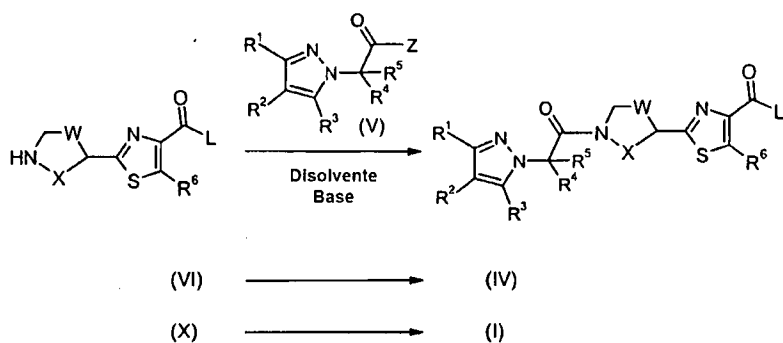
L = -O-alquilo C_1 - C_2 para los compuestos de fórmula (VII) y (VI),

L = $-Y^3-G-R^7$ para los compuestos de fórmula (IX) y (X),

- 5 PG = acetilo, alcoxi- C_1 - C_4 -carbonilo, bencilo o benciloxycarbonilo,
 W, X y R^6 son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

(b) Reacción de compuestos de fórmula (VI) o (X) con compuestos de fórmula (V) para dar compuestos de fórmula (IV) o (I), dado el caso en presencia de un reactivo de acoplamiento, una base y un disolvente, conforme

- 10 al siguiente esquema de reacción (esquema 2):



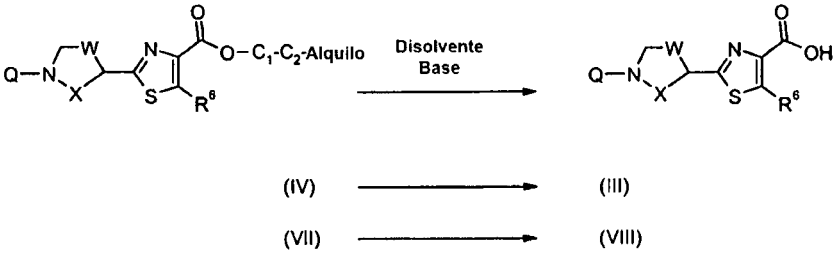
en el que

Z = Cl o OH,

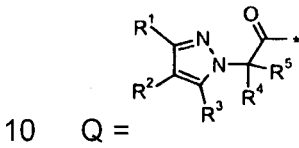
L = -O-alquilo C_1 - C_2 para los compuestos de fórmula (VI) y (IV),

L = -Y³-G-R⁷ para los compuestos de fórmula (X) y (I),
W, X, Y³, G, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

- (c) Reacción de compuestos de fórmula (IV) o (VII) para dar compuestos de
5 fórmula (III) o (VIII) por saponificación, respectivamente, en presencia de una base y, dado el caso, en presencia de un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 3):



en el que



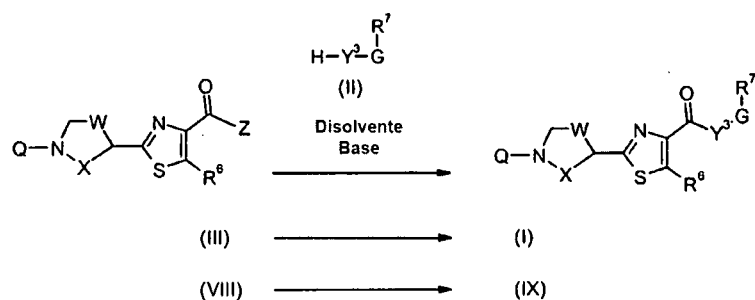
para los compuestos de fórmula (IV) y (III),

Q = acetilo, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, bencilo o benciloxycarbonilo (equivale a PG)
para los compuestos de fórmula (VII) y (VIII),

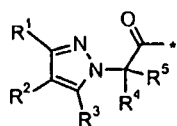
W, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

- 15 (d) Reacción de compuestos de fórmula (III) o (VIII) con compuestos de fórmula (II) para dar compuestos de fórmula (I) o (IX), dado el caso en presencia de un reactivo de acoplamiento, una base y un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 4):

33



en el que



Q = para los compuestos de fórmula (III) y (I),

Q = acetilo, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, bencilo o benciloxycarbonilo (equivale a PG)

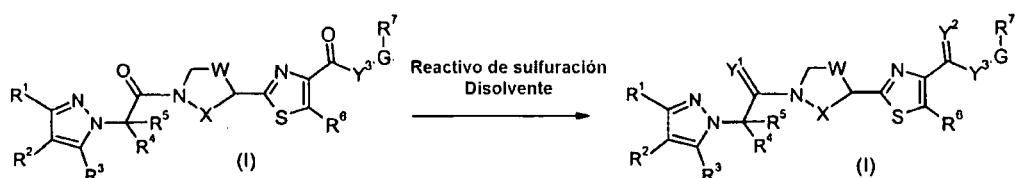
5 para los compuestos de fórmula (VIII) y (IX),

Z = OH o cloro,

W, X, Y³, G, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

(e) Reacción de compuestos de fórmula (I) para dar compuestos de fórmula

10 (I) en presencia de un reactivo de sulfuración y, dado el caso, en presencia de un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 5):



en el que

Y¹ = azufre u oxígeno,

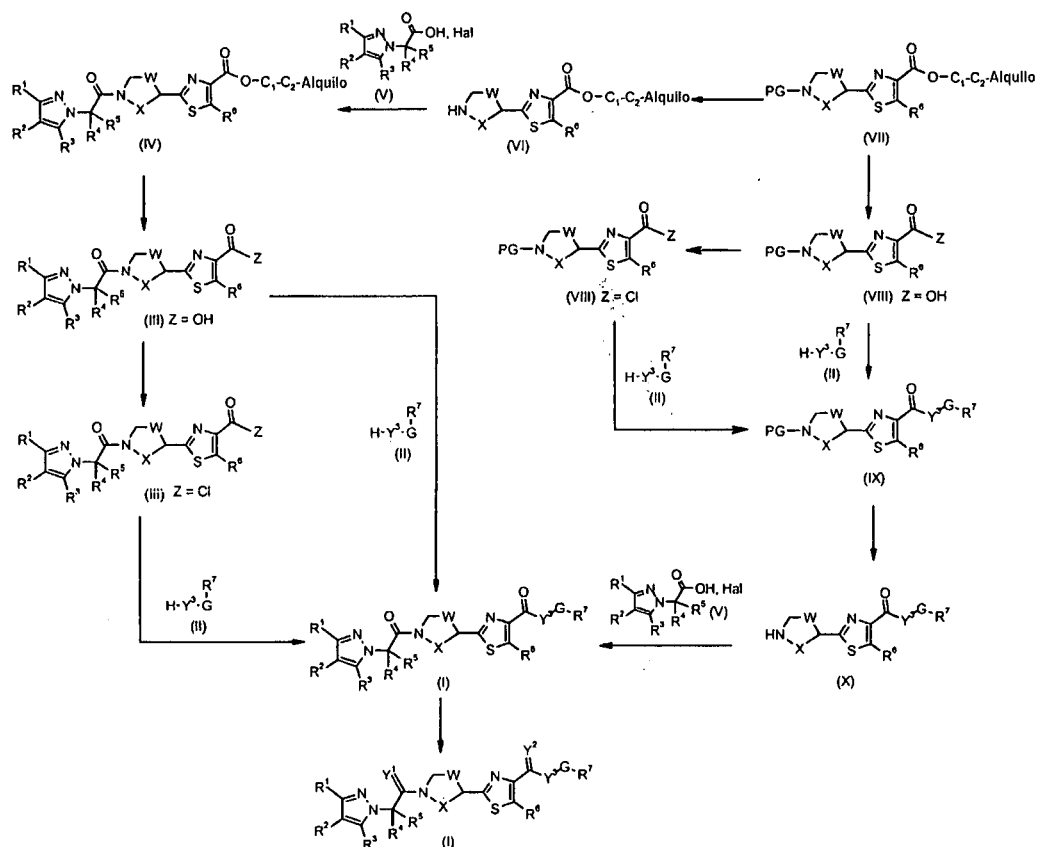
Y^2 = azufre u oxígeno,

W, X, Y^3 , G, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

5 El esquema 6 proporciona una vista de conjunto general de las rutas de síntesis.

El grupo protector de los compuestos de fórmula (VII) se elimina, obteniéndose compuestos de fórmula (VI) o la sal correspondiente (esquema 1). Un compuesto de fórmula (VI) o una sal correspondiente se acopla con un sustrato de fórmula (V), de modo que se obtienen compuestos de fórmula (IV) (esquema 2). La saponificación de los compuestos de fórmula (IV) genera ácidos carboxílicos de fórmula (III) (esquema 3), a la que sigue una reacción de acoplamiento en presencia de un alcohol o tiol de fórmula general (II), obteniéndose compuestos de fórmula (I) (esquema 4). De forma alternativa, la saponificación del compuesto de fórmula (VII) genera un ácido carboxílico de fórmula general (VIII) (esquema 3), a la que sigue una reacción de acoplamiento en presencia de un alcohol o tiol de fórmula general (II), obteniéndose un compuesto de fórmula (IX) (esquema 4). El grupo protector, designado con PG, de un compuesto de fórmula (IX) se elimina, generándose un compuesto de fórmula (X) o la sal correspondiente (esquema 1). Un compuesto de fórmula (X) o una sal correspondiente se acopla con un sustrato de fórmula (V), de modo que se sintetiza un compuesto de fórmula (I) (esquema 2). A un compuesto de fórmula (I) se le añade un reactivo de sulfuración para generar un compuesto de fórmula (I) (Y^1 = azufre u oxígeno, Y^2 = azufre u oxígeno) (esquema 5).

25 **Esquema 6**



El esquema 1 muestra una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (VI) a partir de los compuestos (VII) correspondientes.

Un compuesto de fórmula (VII) se convierte en un compuesto de fórmula (VI) mediante procedimientos adecuados para la eliminación de grupos protectores, descritos en la bibliografía (*Protective Groups in Organic Synthesis*; tercera edición; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; 494-653, y las referencias allí citadas).

Los grupos protectores terc-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo se pueden eliminar en medio ácido (por ejemplo con ácido clorhídrico o ácido trifluoroacético). Los grupos protectores acetilo se pueden eliminar en

condiciones básicas (por ejemplo con carbonato de potasio o carbonato de cesio). Los grupos protectores bencílicos se pueden eliminar de forma hidrogenolítica con hidrógeno en presencia de un catalizador (por ejemplo paladio sobre carbón activado).

- 5 Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, 10 cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo acetonitrilo), ésteres de ácidos carboxílicos (por ejemplo acetato de etilo), amidas (por ejemplo N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, agua y ácido acético, o la reacción se puede realizar 15 en mezclas de dos o varios de estos disolventes.

- Los ácidos que se pueden usar para esta reacción de desprotección de grupos t-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo son, por ejemplo, ácido trifluoroacético, ácido clorhídrico u otros ácidos, como los que se describen en la bibliografía (*"Protective Groups in Organic Synthesis"*; tercera edición; 20 Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; pág. 494-653).

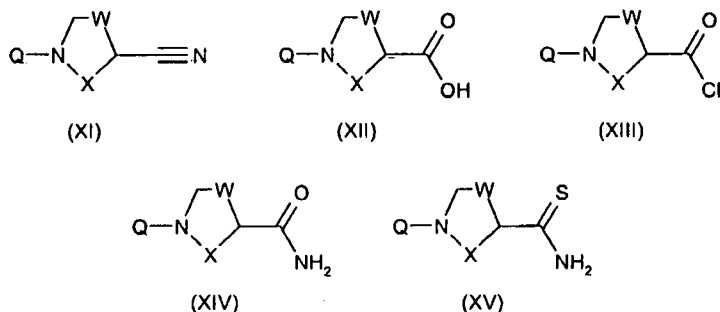
- La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 150°C, preferentemente a temperatura ambiente, pero también se puede realizar a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero 25 generalmente se encuentra entre media hora y 72 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (VI) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía, o, si se desea, también se pueden usar en el paso siguiente sin
5 purificación previa. Además es posible aislar el compuesto de fórmula general (VI) en forma de sal, por ejemplo en forma de sal del ácido clorhídrico o del ácido trifluoroacético.

El mismo procedimiento se usa para convertir un compuesto de fórmula (IX) en un compuesto de fórmula (X).

10 Los ésteres alquílicos C₁-C₂ (VII) son conocidos y se pueden preparar a partir de precursores disponibles en el mercado y según los protocolos descritos en la bibliografía, por ejemplo a partir de nitrilos de fórmula (XI), ácidos carboxílicos de fórmula (XII), cloruros de ácidos carboxílicos de fórmula (XIII), amidas de fórmula (XIV) o tioamidas de fórmula (XV) (figura 1). Un
15 procedimiento preferido es la síntesis de tiazoles según Hantz a partir de (XIV) y halopiruvato de etilo o de metilo, disponible en el mercado, en etanol o en N,N-dimetilformamida a temperatura ambiente y en presencia de, por ejemplo, trietilamina (para ejemplos véanse el documento WO 07/014290 y las referencias allí citadas).

20 **Figura 1**



con

Q = H o grupos protectores de amino sensibles a ácido, como, por ejemplo, t-butoxicarbonilo (tBoc) o benciloxicarbonilo (Cbz), o un grupo protector bencílico, por ejemplo bencilo (Bn).

W y X son como se han definido anteriormente para la fórmula (I).

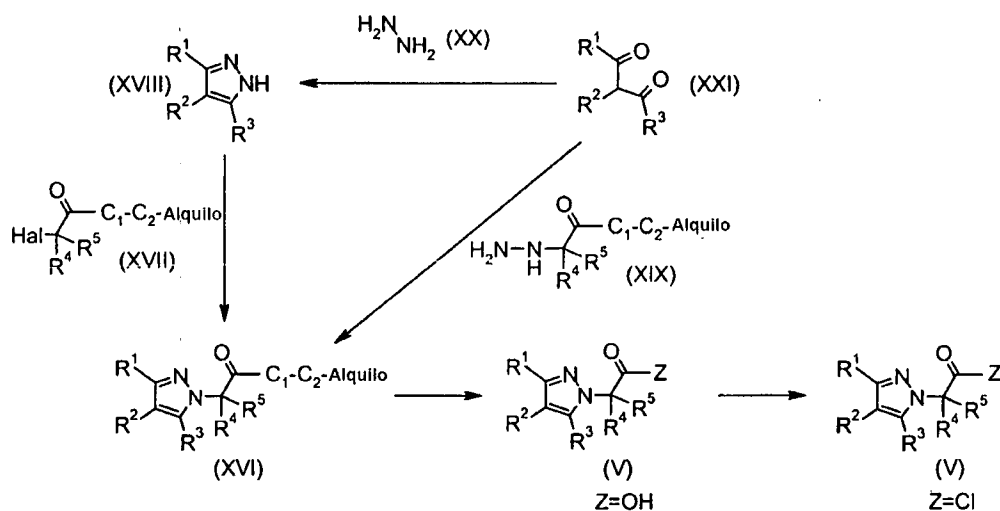
El esquema 2 muestra una posibilidad de sintetizar compuestos de fórmula (IV) a partir de los compuestos (VI) correspondientes.

Un compuesto de fórmula (IV) se sintetiza mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto de fórmula (VI) con un sustrato de fórmula (V), con Z = Cl, dado el caso en presencia de un neutralizador de ácido / una base.

Los haluros de ácido (V) (Z = Cl) o los ácidos carboxílicos correspondientes (V) (Z = OH) se pueden adquirir en el mercado o se pueden sintetizar según procedimientos descritos en la bibliografía (para ejemplos véanse el documento WO 07/014290 y las referencias allí citadas). El esquema 7 muestra un procedimiento preferido. Los pirazoles (XVIII) se pueden preparar a reflujo a partir de dicetonas (XXI) e hidrazina (XX), disponible en el mercado, o de la sal HCl correspondiente en etanol o en N,N-dimetilformamida, dado el caso en presencia de bases, por ejemplo

trietilamina. Los compuestos (XVI) se pueden preparar por alquilación de compuestos (XVIII) con α -haloésteres (XVII), disponibles en el mercado, en acetonitrilo o en N,N-dimetilformamida a temperatura ambiente y en presencia de bases, por ejemplo de carbonato de potasio. De forma alternativa, los compuestos (XVI) se pueden preparar a reflujo directamente a partir de dicetonas (XXI) e hidrazina (XIX), disponible en el mercado, o de las sales HCl correspondientes en etanol o en N,N-dimetilformamida, dado el caso en presencia de bases, por ejemplo de trietilamina. Los ácidos carboxílicos (V) (Z = OH) se pueden preparar por saponificación de los ésteres (XVI) en mezclas de THF/ agua con hidróxido de litio a temperatura ambiente. Además se puede sintetizar un sustrato de fórmula general (V), con Z = Cl, a partir del ácido correspondiente (Z = OH) por cloración usando procedimientos conocidos en la bibliografía (por ejemplo, *Tetrahedron* **2005**, 61, 10827-10852, y la bibliografía allí citada).

15 Esquema 7



- Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno) y nitrilos (por ejemplo acetonitrilo), o la reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son tetrahidrofurano y diclorometano.
- 10 Se usa al menos un equivalente de un neutralizador de ácido/ una base (por ejemplo base de Hünig, trietilamina o neutralizadores de ácido poliméricos disponibles en el mercado) en relación con el material de partida de fórmula general (V). Si el material de partida es una sal, se necesitan al menos dos equivalentes del neutralizador de ácido.
- 15 La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 100°C, preferentemente de 20°C a 30°C, pero también se puede realizar a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.
- 20 Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (IV) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía, o, dado el caso, también se pueden usar en el paso siguiente sin purificación previa.
- 25 De forma alternativa, un compuesto de fórmula (IV) también se puede

sintetizar a partir del compuesto de fórmula (VI) correspondiente con un sustrato de fórmula (V), con $Z = OH$, y en presencia de un reactivo de acoplamiento, de forma análoga a los protocolos descritos en la bibliografía (por ejemplo, *Tetrahedron* **2005**, 61, 10827-10852, y las referencias allí citadas).

Los reactivos de acoplamiento adecuados son, por ejemplo, reactivos de acoplamiento peptídico (como, por ejemplo, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida en mezcla con 4-dimetilaminopiridina, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida en mezcla con 1-hidroxibenzotriazol, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, etc.).

Dado el caso se puede usar en la reacción una base, por ejemplo trietilamina o base de Hünig.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo acetonitrilo) y amidas (por ejemplo N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), o la reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes. El disolvente preferido es diclorometano.

La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 100°C, preferentemente de 0°C a 30°C, pero también se puede realizar a la

temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (IV) de la
5 mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía, o, dado el caso, también se pueden usar en el paso siguiente sin purificación previa.

De forma análoga se pueden convertir los compuestos de fórmula (X)
10 en los compuestos de fórmula (I).

El esquema 3 muestra una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (III) a partir de los compuestos (IV) correspondientes.

El ácido carboxílico de fórmula (III) se puede sintetizar por saponificación del éster alquílico C₁-C₂ de fórmula (IV) correspondiente. Se
15 puede usar, por ejemplo, el procedimiento descrito en el documento WO 2007/014290.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico,
20 tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono) e hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno), o la reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes.

25 Los hidróxidos de metal alcalino adecuados son, por ejemplo, LiOH,

NaOH o KOH, normalmente en presencia de agua junto con un codisolvente, preferentemente THF y/o metanol, para facilitar la disolución del éster. El material de partida y el hidróxido de metal alcalino se usan en cantidades equimolares, pero el hidróxido de metal alcalino también se puede usar, dado el caso, en exceso. La sal carboxilato generada se convierte en el ácido libre por tratamiento con un ligero exceso de ácidos minerales, como, por ejemplo, ácido clorhídrico o ácido sulfúrico.

La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 60°C, pero también se puede realizar a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (III) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.

De forma análoga se pueden convertir los compuestos de fórmula (VII) en los compuestos de fórmula (VIII).

El esquema 4 muestra una posibilidad de sintetizar los compuestos de fórmula (I) a partir de los compuestos (III) correspondientes.

Un compuesto de fórmula (I) se sintetiza por medio de una reacción de acoplamiento de un compuesto de fórmula (III) con un sustrato de fórmula (II) por cloración usando procedimientos conocidos en la bibliografía (por ejemplo, *Tetrahedron* **2005**, 61, 10827-10852, y la bibliografía allí citada), dado el caso en presencia de un neutralizador de ácido/ una base.

Los sustratos de fórmula general (II) se pueden adquirir en el mercado o se pueden sintetizar mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, "The Chemistry of Functional Groups"; "The Chemistry of the Thiol Group"; John Wiley & Sons, **1974**, 163-269, y las referencias allí citadas).

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno) y nitrilos (por ejemplo acetonitrilo), o la reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son tetrahidrofurano y diclorometano.

Se usa al menos un equivalente de un neutralizador de ácido/ una base (por ejemplo base de Hünig, trietilamina o neutralizadores de ácido poliméricos disponibles en el mercado) en relación con el material de partida de fórmula general (II). Si el material de partida es una sal, se necesitan al menos dos equivalentes del neutralizador de ácido.

La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 100°C, preferentemente de 20°C a 30°C, pero también se puede realizar a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (I) de la

mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía, o, dado el caso, también se pueden usar en el paso siguiente sin purificación previa.

- 5 De forma alternativa, un compuesto de fórmula (I) también se puede sintetizar de forma análoga a los protocolos descritos en la bibliografía (por ejemplo, *Tetrahedron* **2005**, 61, 10827-10852, y la bibliografía allí citada) a partir del compuesto de fórmula (III) ($Z = OH$) correspondiente con un sustrato de fórmula (II) en presencia de un reactivo de acoplamiento.
- 10 Los reactivos de acoplamiento adecuados son, por ejemplo, reactivos de acoplamiento peptídico (como, por ejemplo, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida en mezcla con 4-dimetilaminopiridina, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida en mezcla con 1-hidroxibenzotriazol, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio, hexafluorofosfato de O-(7-
- 15 azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, etc.).

Dado el caso se puede usar en la reacción una base, por ejemplo trietilamina o base de Hünig.

- Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo
- 20 metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo acetonitrilo) y
- 25 amidas (por ejemplo N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), o la

reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son N,N-dimetilformamida y diclorometano.

La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 100°C, preferentemente de 0°C a 30°C, pero también se puede realizar a la
5 temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (I) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En
10 caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía, o, dado el caso, también se pueden usar en el paso siguiente sin purificación previa.

El mismo proceso se puede usar para convertir un compuesto de fórmula general (VIII) en un compuesto de fórmula general (IX).

15 El esquema 5 muestra una posibilidad de sintetizar compuestos de fórmula (I), en los que Y^1 e $Y^2 = S$, a partir de los compuestos (I) correspondientes, en los que Y^1 e $Y^2 = O$.

A un compuesto de fórmula (I) se le añade un reactivo de sulfuración, por ejemplo el reactivo de Lawesson o, por ejemplo, pentasulfuro de fósforo,
20 para generar un compuesto de fórmula (I) (Y^1 e $Y^2 = \text{azufre}$). Se puede aplicar, por ejemplo, el procedimiento descrito en *Tetrahedron Lett* **2002**, 43, (3), 371-373.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción, por ejemplo alcoholes (por ejemplo
25 metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo éter dietílico,

tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo diclorometano, cloroformo, tetraclorocarbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo acetonitrilo),
5 ésteres de ácidos carboxílicos (por ejemplo acetato de etilo) y amidas (por ejemplo N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), y la reacción se puede realizar en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son cloroformo, tolueno y 1,2-dimetoxietano.

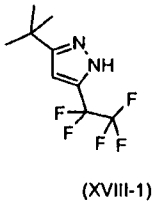
Los reactivos de sulfuración adecuados son, por ejemplo, el reactivo de
10 Lawesson (véanse *Tetrahedron* **1986**, 42, 6555-6564, *Tetrahedron Lett.* **1993**, 46, 7459-7462) y pentasulfuro de fósforo. El material de partida y el reactivo de sulfuración se usan en cantidades equimolares, aunque el reactivo de sulfuración también se puede usar, dado el caso, en exceso.

La reacción se realiza normalmente a temperaturas de 0°C a 150°C,
15 preferentemente de 0°C a 100°C, pero también se puede realizar a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero generalmente se encuentra entre unos pocos minutos y 48 horas.

Una vez concluida la reacción se separan los compuestos (I) de la
20 mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.

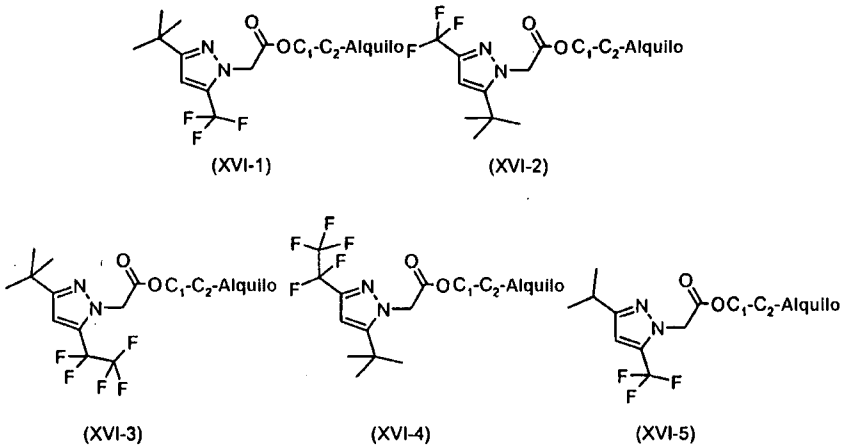
El compuesto de fórmula (XVIII-1)

48



y sus sales son nuevos.

Los compuestos de fórmula (XVI-1), (XVI-2), (XVI-3), (XVI-4) y (XVI-5)

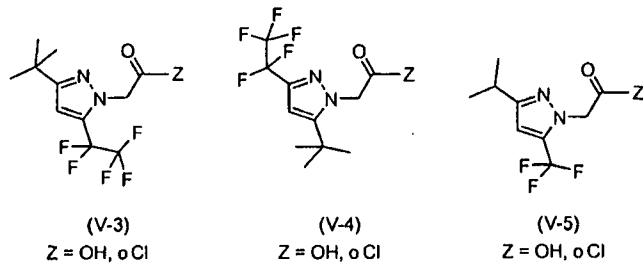
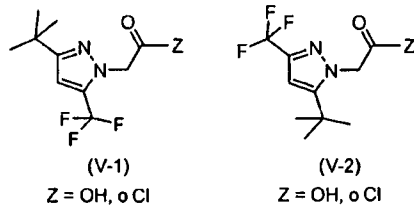


5 Alquil = alquilo

y sus sales son nuevos.

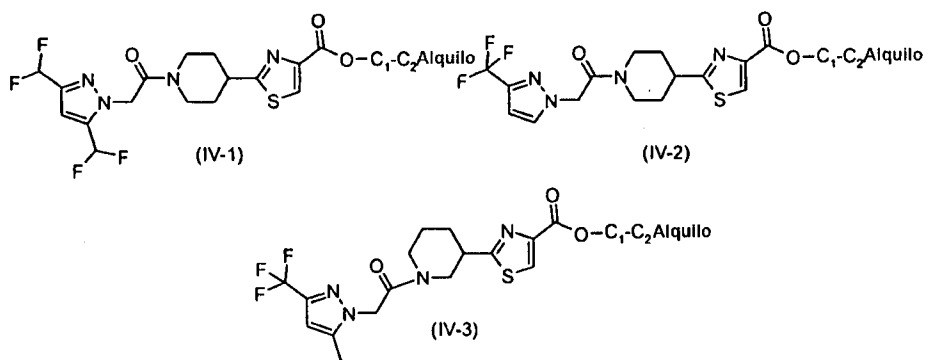
Los compuestos de fórmula (V-1), (V-2), (V-3), (V-4) y (V-5)

49



y sus sales son nuevos.

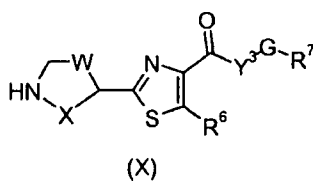
Los compuestos de fórmula (IV-1), (IV-2) y (IV-3)



5 y sus sales son nuevos.

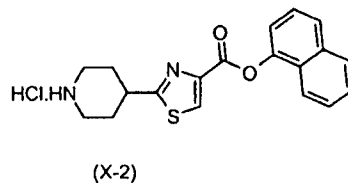
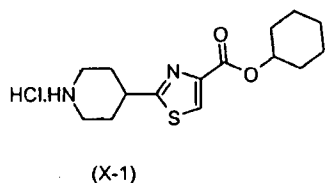
Los compuestos de fórmula (III-1), (III-2) y (III-3)

Los compuestos de fórmula (X)



en los que los símbolos poseen los significados siguientes:

- W, X, Y³, G, R⁶ y R⁷ poseen los significados generales, preferidos,
 5 especialmente preferidos o muy especialmente preferidos antes indicados,
 y sus sales son nuevos.



Otro objeto de la invención es el uso no médico de los ésteres y
 tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la invención o de
 10 mezclas de ellos para combatir microorganismos no deseados.

Otro objeto de la invención es un agente para combatir
 microorganismos no deseados que comprende al menos un éster o tioéster del
 ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la presente invención.

La invención se refiere además a un procedimiento para combatir
 15 microorganismos no deseados, caracterizado porque los ésteres y tioésteres
 del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la invención se esparcen sobre
 los microorganismos y/o por su hábitat.

La invención se refiere asimismo a semillas tratadas con al menos un
 éster o tioéster del ácido tiazol-4-carboxílico.

Un último objeto de la invención es un procedimiento para proteger las semillas contra microorganismos no deseados mediante el uso de semillas tratadas con al menos un éster o tioéster del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la presente invención.

- 5 Las sustancias de acuerdo con la invención presentan un potente efecto microbicida y se pueden usar para combatir microorganismos no deseados, tales como hongos y bacterias, en la protección de plantas y en la protección de materiales.

- 10 Los ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I) de acuerdo con la invención poseen excelentes propiedades fungicidas y se pueden usar, por ejemplo, en la protección de plantas para combatir plasmodioforomicetos, oomicetos, quitridiomicetos, zigomicetos, ascomicetos, basidiomicetos y deuteromicetos.

- 15 Los bactericidas se pueden usar, por ejemplo, en la protección de plantas para combatir pseudomonadáceas, rizobiáceas, enterobacteriáceas, corinebacteriáceas y estreptomiceráceas.

- 20 Los agentes fungicidas de acuerdo con la invención se pueden usar de forma curativa o protectora para combatir hongos fitopatógenos. Por lo tanto, la invención también se refiere a procedimientos curativos y protectores para combatir hongos fitopatógenos mediante el uso de los principios activos o agentes de acuerdo con la invención, que se esparcen sobre las semillas, la planta o partes de la planta, los frutos o el suelo en el que crecen las plantas.

- 25 Los agentes de acuerdo con la invención para combatir hongos fitopatógenos en la protección de plantas comprenden una cantidad eficaz pero no fitotóxica de los principios activos de acuerdo con la invención.

“Cantidad eficaz pero no fitotóxica” se refiere a una cantidad del agente de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar satisfactoriamente o eliminar por completo la micosis de la planta y, al mismo tiempo, no conlleva síntomas de fitotoxicidad dignos de mención. Esta cantidad de aplicación
5 generalmente puede variar en un amplio intervalo. Depende de varios factores, por ejemplo del hongo que se ha de combatir, de la planta, de las condiciones climáticas y de los ingredientes de los agentes de acuerdo con la invención.

De acuerdo con la invención, se pueden tratar todas las plantas y partes de las plantas. Por plantas se entienden en este caso todas las plantas y
10 poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (que incluyen las plantas de cultivo presentes en la naturaleza). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante procedimientos de cultivo y de optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante
15 combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por derechos de protección de variedades. Por partes de plantas se entienden todas las partes aéreas y subterráneas y órganos de las plantas, tales como brote, hoja, flor y raíz, citándose a modo de ejemplo hojas, acículas, tallos,
20 troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, bulbos y rizomas. Entre las partes de plantas se encuentran también los productos cosechados y el material reproductor vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, bulbos, rizomas, esquejes y semillas.

Como plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención son de
25 mencionar las siguientes: algodón, lino, vides, fruta, verduras, como *Rosaceae*

sp. (por ejemplo frutas de pepita, tales como manzana y pera, pero también frutas de hueso, tales como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones, y bayas, tales como fresas), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.*, (por ejemplo, bananeros y plantaciones de plátanos), *Rubiaceae sp.* (por ejemplo, café), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo, limones, naranjas y pomelos), *Solanaceae sp.* (por ejemplo, tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo, lechuga), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (por ejemplo, pepino), *Alliaceae sp.* (por ejemplo, puerro, cebolla), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, guisantes), plantas útiles principales, tales como *Gramineae sp.* (por ejemplo, maíz, césped, cereales tales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Brassicaceae sp.* (por ejemplo, repollo, lombarda, brécol, coliflor, coles de Bruselas, Pak Choi, colinabo, rábano encarnado, así como colza, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae sp.* (por ejemplo, judía, cacahuetes), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, haba de soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelgas, betarraga), plantas útiles y plantas ornamentales en jardines y bosques; así como las especies modificadas genéticamente de estas plantas. De acuerdo con la invención se tratan preferentemente cereales.

A modo de ejemplo, pero sin limitarse a ellos, son de mencionar algunos agentes patógenos causantes de enfermedades fúngicas que se pueden tratar de acuerdo con la invención:

Enfermedades causadas por los agentes patógenos del mildiú en polvo,

como, por ejemplo, especies de *Blumeria*, por ejemplo *Blumeria graminis*; especies de *Podosphaera*, por ejemplo *Podosphaera leucotricha*; especies de *Sphaerotheca*, por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*; especies de *Uncinula*, por ejemplo *Uncinula necator*;

- 5 enfermedades causadas por los agentes patógenos de la roya, como, por ejemplo, especies de *Gymnosporangium*, por ejemplo *Gymnosporangium sabinae*; especies de *Hemileia*, por ejemplo *Hemileia vastatrix*; especies de *Phakopsora*, por ejemplo *Phakopsora pachyrhizi* y *Phakopsora meibomiae*; especies de *Puccinia*, por ejemplo *Puccinia recondita* o *Puccinia triticina*;
- 10 especies de *Uromyces*, por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;

- enfermedades causadas por agentes patógenos del grupo de los oomicetos, como, por ejemplo, especies de *Bremia*, por ejemplo *Bremia lactucae*, especies de *Peronospora*, por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*; especies de *Phytophthora*, por ejemplo *Phytophthora infestans*;
- 15 especies de *Plasmopara*, por ejemplo *Plasmopara viticola*; especies de *Pseudoperonospora*, por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*; especies de *Pythium*, por ejemplo *Pythium ultimum*;

- enfermedades de mancha foliar y marchitez foliar causadas, por
- 20 ejemplo, por especies de *Alternaria*, por ejemplo *Alternaria solani*; especies de *Cercospora*, por ejemplo *Cercospora beticola*; especies de *Cladosporium*, por ejemplo *Cladosporium cucumerinum*; especies de *Cochliobolus*, por ejemplo *Cochliobolus sativus* (forma de los conidios: *Drechslera*, sin.: *Helminthosporium*); especies de *Colletotrichum*, por ejemplo *Colletotrichum lindemuthianum*;
- 25 especies de *Cycloconium*, por ejemplo *Cycloconium*

- oleaginum*; especies de *Diaporthe*, por ejemplo *Diaporthe citri*; especies de *Elsinoe*, por ejemplo *Elsinoe fawcettii*; especies de *Gloeosporium*, por ejemplo *Gloeosporium laeticolor*, especies de *Glomerella*, por ejemplo *Glomerella cingulata*; especies de *Guignardia*, por ejemplo *Guignardia bidwelli*; especies
- 5 de *Leptosphaeria*, por ejemplo *Leptosphaeria maculans*; especies de *Magnaporthe*, por ejemplo *Magnaporthe grisea*; especies de *Microdochium*, por ejemplo *Microdochium nivale*; especies de *Mycosphaerella*, por ejemplo *Mycosphaerella graminicola* y *M. fijiensis*; especies de *Phaeosphaeria*, por ejemplo *Phaeosphaeria nodorum*; especies de *Pyrenophora*, por ejemplo
- 10 *Pyrenophora teres*; especies de *Ramularia*, por ejemplo *Ramularia collo-cygni*; especies de *Rhynchosporium*, por ejemplo *Rhynchosporium secalis*; especies de *Septoria*, por ejemplo *Septoria apii*; especies de *Typhula*, por ejemplo *Typhula incarnata*; especies de *Venturia*, por ejemplo *Venturia inaequalis*;
- enfermedades de las raíces y de los tallos causadas, por ejemplo, por
- 15 especies de *Corticium*, por ejemplo *Corticium graminearum*; especies de *Fusarium*, por ejemplo *Fusarium oxysporum*; especies de *Gaeumannomyces*, por ejemplo *Gaeumannomyces graminis*; especies de *Rhizoctonia*, por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Tapesia*, por ejemplo *Tapesia acuformis*; especies de *Thielaviopsis*, por ejemplo *Thielaviopsis basicola*;
- 20 enfermedades de la espiga y de la panícula (incluidas las mazorcas de maíz) causadas, por ejemplo, por especies de *Alternaria*, por ejemplo *Alternaria spp.*; especies de *Aspergillus*, por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Cladosporium*, por ejemplo *Cladosporium cladosporioides*; especies de *Claviceps*, por ejemplo *Claviceps purpurea*; especies de *Fusarium*, por ejemplo
- 25 *Fusarium culmorum*; especies de *Gibberella*, por ejemplo *Gibberella zeae*;

especies de *Monographella*, por ejemplo *Monographella nivalis*; especies de *Septoria*, por ejemplo *Septoria nodorum*;

enfermedades causadas por ustilaginales, como, por ejemplo, especies de *Sphacelotheca*, por ejemplo *Sphalothecareiliana*; especies de *Tilletia*, por
5 ejemplo *Tilletia caries*, *T. controversa*; especies de *Urocystis*, por ejemplo *Urocystis occulta*; especies de *Ustilago*, por ejemplo *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*;

podredumbre parda causada, por ejemplo, por especies de *Aspergillus*, por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Botrytis*, por ejemplo *Botrytis*
10 *cinerea*; especies de *Penicillium*, por ejemplo *Penicillium expansum* y *P. purpurogenum*; especies de *Sclerotinia*, por ejemplo *Sclerotonia sclerotiorum*;

especies de *Verticilium*, por ejemplo *Verticilium alboatrum*;

podredumbres y marchiteces de la semilla y procedentes del suelo, así como enfermedades de las plantas nacidas de semillas causadas, por ejemplo,
15 por especies de *Fusarium*, por ejemplo *Fusarium culmorum*; especies de *Phytophthora*, por ejemplo *Phytophthora cactorum*; especies de *Pythium*, por ejemplo *Pythium ultimum*; especies de *Rhizoctonia*, por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Sclerotium*, por ejemplo *Sclerotium rolfsii*;

tumores, agallas y escobas de bruja causados, por ejemplo, por
20 especies de *Nectria*, por ejemplo *Nectria galligena*;

podredumbres causadas, por ejemplo, por especies de *Monilinia*, por ejemplo *Monilinia laxa*;

deformaciones de hojas, flores y frutos causadas, por ejemplo, por especies de *Taphrina*, por ejemplo *Taphrina deformans*;

25 enfermedades degenerativas de plantas leñosas causadas, por ejemplo,

por especies de *Esca*, por ejemplo *Phaemoniella clamydospora* y *Phaeoacremonium aleophilum* y *Fomitiporia mediterranea*;

enfermedades de las flores y de las semillas causadas, por ejemplo, por especies de *Botrytis*, por ejemplo *Botrytis cinerea*;

- 5 enfermedades de los tubérculos causadas, por ejemplo, por especies de *Rhizoctonia*, por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Helminthosporium*, por ejemplo *Helminthosporium solani*;

enfermedades causadas por agentes patógenos bacterianos, como, por ejemplo, especies de *Xanthomonas*, por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv.

- 10 *oryzae*; especies de *Pseudomonas*, por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; especies de *Erwinia*, por ejemplo *Erwinia amylovora*.

Preferentemente se pueden combatir las siguientes enfermedades de las habas de soja:

- Micosis en hojas, tallos, vainas y semillas causadas, por ejemplo, por
- 15 mancha foliar por *Alternaria* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), antracnosis (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), mancha parda (*Septoria glycines*), mancha y marchitez foliar por *Cercospora* (*Cercospora kikuchii*), marchitez foliar por *Choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispora* (sin.)), mancha foliar por *Dactuliophora* (*Dactuliophora glycines*), mildiú
- 20 (*Peronospora manshurica*), marchitez por *Drechslera* (*Drechslera glycini*), mancha foliar ojo de rana (*Cercospora sojina*), mancha foliar por *Leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), mancha foliar por *Phyllostica* (*Phyllostica sojaecola*), tizón de la vaina y del tallo (*Phomopsis sojae*), mildiú en polvo (*Microsphaera diffusa*), mancha foliar por *Pyrenochaeta* (*Pyrenochaeta*
- 25 *glycines*), marchitez de las partes aéreas, del follaje y del tejido por *Rhizoctonia*

(*Rhizoctonia solani*), roya (*Phakopsora pachyrhizi*; *Phakopsora meibomia*), roña (*Sphaceloma glycines*), marchitez foliar por *Stemphylium* (*Stemphylium botryosum*), mancha en diana (*Corynespora cassicola*);

micosis en las raíces y en la base del tallo causadas, por ejemplo, por podredumbre negra de las raíces (*Calonectria crotalariae*), podredumbre de carbón (*Macrophomina phaseolina*), tizón o marchitez, podredumbre de las raíces y podredumbre de la vaina y del cuello por *Fusarium* (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), podredumbre de las raíces por *Mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*),
 10 *Neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfecta*), tizón de la vaina y del tallo (*Diaporthe phaseolorum*), cancro del tallo (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora megasperma*), podredumbre parda del tallo (*Phialophora gregata*), podredumbre por *Pythium* (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium*
 15 *myriotylum*, *Pythium ultimum*), podredumbre de las raíces, descomposición del tallo y caída de las plántulas por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), descomposición del tallo por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), marchitez sureña por *Sclerotinia* (*Sclerotinia rolfsii*), podredumbre de las raíces por *Thielaviopsis* (*Thielaviopsis basicola*).

20 Los principios activos de acuerdo con la invención también presentan un excelente efecto fortificante en las plantas. Por lo tanto, son adecuados para la movilización de las defensas propias de la planta contra la infestación por microorganismos no deseados.

Por sustancias fitofortificantes (inductoras de resistencia) se entienden
 25 en el presente contexto aquellas sustancias que son capaces de estimular el

sistema de defensa de las plantas de tal manera que las plantas tratadas desplieguen, cuando son inoculadas posteriormente con microorganismos no deseados, una amplia resistencia a estos microorganismos.

Por microorganismos no deseados se entienden en el presente caso
5 hongos y bacterias fitopatógenos. Las sustancias de acuerdo con la invención se pueden usar, pues, para proteger las plantas contra la infestación por los agentes causantes de daño antes mencionados durante un cierto periodo de tiempo después del tratamiento. El periodo de tiempo en el cual se produce protección se extiende generalmente a entre 1 y 10 días, preferentemente a
10 entre 1 y 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos.

La buena tolerancia de las plantas a los principios activos en las concentraciones necesarias para combatir las enfermedades de las plantas permite el tratamiento de las partes aéreas de las plantas, de las plántulas y
15 semillas y del suelo.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar con especial éxito para combatir enfermedades en la viticultura, la fruticultura y el cultivo de hortalizas, por ejemplo contra especies de *Botrytis*, *Venturia*, *Sphaerotheca*, *Podosphaera*, *Phytophthora* y *Plasmopara*.

20 Los principios activos de acuerdo con la invención también son adecuados para incrementar el rendimiento de la cosecha. Además, son poco tóxicos y presentan una buena tolerabilidad para las plantas.

Los compuestos de acuerdo con la invención dado el caso también se pueden usar, a determinadas concentraciones o cantidades de aplicación,
25 como herbicidas, detoxificantes, reguladores del crecimiento o agentes para

mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos los agentes contra viroides), o como agentes contra MLO (organismo semejante a micoplasma) y RLO (organismo semejante a rickettsia). Dado el caso también se pueden usar
5 como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos de acuerdo con la invención dado el caso también se pueden usar, a determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, como herbicidas, para modificar el crecimiento de las plantas, así como para
10 combatir parásitos animales. Dado el caso también se pueden usar como productos intermedios y precursores para la síntesis de otros principios activos.

Por la buena tolerabilidad para las plantas, la toxicidad favorable para animales de sangre caliente y la buena compatibilidad con el medio ambiente, los principios activos de acuerdo con la invención son adecuadas para proteger
15 las plantas y los órganos vegetales, para aumentar el rendimiento de la cosecha, para mejorar la calidad de los productos cosechados y para combatir parásitos animales, en especial insectos, arácnidos, helmintos, nemátodos y moluscos, que aparecen en la agricultura, la horticultura, la cría de animales, en bosques, jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos
20 almacenados y de materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden usar preferentemente como agentes fitoprotectores.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos o agentes se lleva a cabo directamente o actuando sobre su entorno, hábitat o depósito de almacenamiento, mediante
25 los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión,

aspersión, rociado, riego, difusión, pulverización, nebulización, esparcimiento, espumación, recubrimiento, extensión, vertido (empapado), riego por goteo y, en el caso del material reproductor, especialmente en el caso de semillas, también por desinfección en seco, desinfección en húmedo, desinfección en
5 suspensión, incrustación, recubrimiento mono- o multicapa, etc. Asimismo es posible esparcir los principios activos según el procedimiento de ultra bajo volumen o inyectar la preparación de principios activos o el principio activo propiamente dicho en el suelo.

Los principios activos de acuerdo con la invención también se pueden
10 usar como defoliantes, desecantes, destructores de hierbas y, en especial, como destructores de malas hierbas. Por malas hierbas se entienden, en el sentido más amplio, todas las plantas que crecen en lugares en los que no son deseadas. El hecho de que las sustancias de acuerdo con la invención actúen como herbicidas totales o selectivos depende esencialmente de la cantidad
15 aplicada.

Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden usar, además, en la protección de materiales para proteger materiales técnicos contra la infestación y destrucción por microorganismos no deseados, por ejemplo por hongos.

20 Por materiales técnicos se entienden en el presente contexto materiales no vivos que han sido preparados para el uso en la técnica. Los materiales técnicos que se han de proteger contra alteración o destrucción microbiana mediante los principios activos de acuerdo con la invención pueden ser, por ejemplo, adhesivos, colas, papel y cartón, productos textiles, cuero, madera,
25 pinturas y artículos de plástico, lubricantes refrigeradores y otros materiales

que puedan ser infestados o descompuestos por microorganismos. En el marco de los materiales que se han de proteger son de mencionar asimismo partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos de agua de refrigeración, que puedan verse afectadas por la proliferación de microorganismos. En el marco de la presente invención son de mencionar como materiales técnicos preferentemente adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes refrigeradores y líquidos transmisores de calor, con especial preferencia madera. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención pueden prevenir efectos negativos tales como pudrición, descomposición, descoloración, desteñido o enmohecimiento.

El procedimiento de acuerdo con la invención para combatir hongos no deseados también se puede usar para proteger los denominados productos almacenados. Por "productos almacenados" se entienden en este caso sustancias naturales de origen vegetal o animal o sus productos derivados que se han obtenido de la naturaleza y para los cuales se desea una protección a largo plazo. Los productos almacenados de origen vegetal, como, por ejemplo, plantas o partes de plantas, tales como tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutos, granos, se pueden proteger en estado recién cosechado o tras procesarlos mediante secado (previo), humectación, trituración, molienda, prensado o tostadura. Los productos almacenados comprenden también madera útil, bien sin tratar, como madera de construcción, postes de conducción eléctrica y barreras, o bien en forma de productos acabados, tales como muebles. Los productos almacenados de origen animal son, por ejemplo, pelajes, cuero, pieles y cabello. Los principios activos de acuerdo con la invención pueden prevenir efectos negativos tales como pudrición,

descomposición, descoloración, desteñido o enmohecimiento.

Como microorganismos que pueden provocar una degradación o alteración de los materiales técnicos son de mencionar, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Los principios activos
5 de acuerdo con la invención actúan preferentemente contra hongos, en especial mohos, hongos que descolorean madera y destruyen madera (basidiomicetos), así como contra organismos mucilaginosos y algas. Son de mencionar a modo de ejemplo microorganismos de los géneros siguientes:
Alternaria, como *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, como *Aspergillus niger*;
10 *Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, como *Coniophora puetana*; *Lentinus*, como *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, como *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, como *Polyporus versicolor*, *Aureobasidium*, como *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, como *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, como *Trichoderma viride*; *Escherichia*, como *Escherichia coli*;
15 *Pseudomonas*, como *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, como *Staphylococcus aureus*.

La presente invención se refiere asimismo a un agente para combatir microorganismos no deseados que comprende al menos uno de los ésteres o tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la invención.
20 Preferentemente se trata de agentes fungicidas que contienen coadyuvantes, disolventes, vehículos, agentes tensioactivos o extensores que se pueden usar en la agricultura.

"Vehículo" se refiere de acuerdo con la invención a una sustancia orgánica o inorgánica, natural o sintética con la que están mezclados o unidos
25 los principios activos para mejorar la aplicabilidad, sobre todo para la

aplicación sobre plantas o partes de plantas o semillas. El vehículo, que puede ser sólido o líquido, generalmente es inerte y deberá poderse usar en la agricultura.

- Como vehículos sólidos se consideran: por ejemplo, sales de amonio y
- 5 harinas minerales naturales, tales como caolines, alúmina, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y harinas minerales sintéticas, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para gránulos se consideran: por ejemplo, rocas naturales quebradas y fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez,
- 10 sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y gránulos de material orgánico, tales como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se consideran: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de polioxietileno y ácido graso, éteres de
- 15 polioxietileno y alcohol graso, por ejemplo éteres alquilarilpoliglicólicos, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteínas; como dispersantes se consideran sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres de alcohol y POE y/o POP, ésteres de ácido y/o POP-POE, éteres alquilarílicos y/o de POP-POE,
- 20 aductos de grasa y/o POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o -azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o de arilo o los aductos de éter de OP correspondientes. Asimismo son adecuados oligo- o polímeros de, por ejemplo, monómeros vinílicos, ácido acrílico, OE y/u OP solos o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas.
- 25 Igualmente se pueden usar lignina y sus derivados de ácido sulfónico,

celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.

Los principios activos se pueden incorporar en formulaciones habituales, tales como soluciones, emulsiones, polvos para proyección, suspensiones
5 basadas en agua y aceite, polvos, productos para espolvorear, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para esparcir, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

10 Los principios activos se pueden usar como tales, en forma de sus formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de ellas, tales como soluciones listas para el uso, emulsiones, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, polvos para proyección, pastas, polvos solubles, productos para espolvorear, gránulos solubles, gránulos para esparcir,
15 concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas. La aplicación se efectúa de manera habitual, por ejemplo por riego, aspersión, rociado, esparcimiento, pulverización, espumación, recubrimiento, etc.
20 Asimismo es posible esparcir los principios activos según el procedimiento de ultra bajo volumen o inyectar la preparación de principios activos o el principio activo propiamente dicho en el suelo. También se pueden tratar las semillas de las plantas.

Las formulaciones mencionadas se pueden preparar de manera
25 conocida en sí, por ejemplo mezclando los principios activos con al menos un

extensor, disolvente o diluyente habitual, emulsionante, dispersante y/o aglutinante o fijador, humectante, repelente de agua, dado el caso con desecantes y estabilizadores frente a UV y, dado el caso, colorantes y pigmentos, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas, así como con otros coadyuvantes de procesamiento.

Los agentes de acuerdo con la invención no sólo comprenden formulaciones que ya están listas para el uso y que se pueden esparcir con un aparato adecuado sobre la planta o las semillas, sino también concentrados comerciales que se han de diluir con agua antes del uso.

Los principios activos de acuerdo con la invención pueden estar presentes como tales o en sus formulaciones (comerciales), así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con otros principios activos (conocidos), tales como insecticidas, sustancias atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, fertilizantes, detoxificantes o semioquímicos.

Como coadyuvantes se pueden usar aquellas sustancias que son adecuadas para conferir al agente mismo y/o a las preparaciones derivadas de él (por ejemplo, caldos de pulverización, desinfectantes para semillas) propiedades especiales, tales como propiedades técnicas determinadas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se consideran: extensores, disolventes y vehículos.

Como extensores son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y apolares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos,

alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, dado el caso, también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y
5 lactonas simples y sustituidas, las sulfonas y los sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

Con extensores o vehículos gaseosos licuados se designan aquellos líquidos que son gaseosos a temperatura normal y presión normal, por ejemplo gases propelentes en aerosol, tales como hidrocarburos halogenados, así
10 como butano, propano, nitrógeno y oxígeno.

En las formulaciones se pueden usar adhesivos, tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en polvo, gránulos o en forma de látex, tales como goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales, tales como cefalinas y lecitinas, y
15 fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

En el caso de usar agua como extensor también se pueden usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Como disolventes líquidos se consideran fundamentalmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos
20 alifáticos clorados, tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales
25 como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

Los agentes de acuerdo con la invención pueden contener adicionalmente otros componentes, como, por ejemplo, sustancias tensioactivas. Como sustancias tensioactivas se consideran emulsionantes y/o espumantes, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estas sustancias tensioactivas. Ejemplos de ellas son sales del ácido poliacrílico, sales del ácido lignosulfónico, sales del ácido fenolsulfónico o del ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres del ácido fosfórico con alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo éteres alquilarilpoliglicólicos, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, hidrolizados de proteínas, lejías lignina-sulfíticas de desecho y metilcelulosa. La presencia de una sustancia tensioactiva es necesaria cuando uno de los principios activos y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y cuando la aplicación se realiza en agua. La proporción de sustancias tensioactivas se encuentra entre 5 y 40 por ciento en peso del agente de acuerdo con la invención.

Se pueden usar colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrociano y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica, y oligonutrientes, tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Otros aditivos pueden ser sustancias odoríferas, aceites minerales o vegetales, dado el caso modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes), tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

- 5 Asimismo pueden estar contenidos estabilizadores, tales como estabilizadores frente al frío, conservantes, antioxidantes, productos antisolares u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

Dado el caso también pueden estar contenidos otros componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, aglutinantes, adhesivos,
10 espesantes, sustancias tixotrópicas, sustancias que fomentan la penetración, estabilizadores, secuestrantes, formadores de complejos. En general, los principios activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido que se use usualmente con fines de formulación.

- Las formulaciones contienen en general entre 0,05 y 99% en peso, 0,01
15 y 98% en peso, preferentemente entre 0,1 y 95% en peso, con especial preferencia entre 0,5 y 90% de principio activo, con muy especial preferencia entre 10 y 70 por ciento en peso.

Las formulaciones antes descritas se pueden usar en un procedimiento de acuerdo con la invención para combatir microorganismos no deseados en el
20 que los ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la invención se esparcen sobre los microorganismos y/o por su hábitat.

- Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar como tales o en sus formulaciones, también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, para, por ejemplo, ampliar el
25 espectro de actividad o prevenir el desarrollo de resistencias.

Como parejas de mezcla se consideran, por ejemplo, fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas o también bactericidas conocidos (véase también "Pesticide Manual", 13ª ed.).

También es posible mezclarlos con otros principios activos conocidos, tales como herbicidas, o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, detoxificantes o semioquímicos.

La aplicación se efectúa de manera habitual, adaptada a las formas de aplicación.

La invención comprende asimismo un procedimiento para el tratamiento de semillas.

Otro aspecto de la presente invención se refiere, en particular, a semillas tratadas con al menos uno de los ésteres o tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de acuerdo con la invención. Las semillas de acuerdo con la invención se usan en procedimientos para la protección de semillas contra parásitos animales y/u hongos dañinos fitopatógenos. En éstos se usan semillas tratadas con al menos un principio activo de acuerdo con la invención.

Los principios activos y agentes de acuerdo con la invención también son adecuados para el tratamiento de semillas. Una gran parte del daño causado por los organismos dañinos en las plantas de cultivo se produce por infestación de las semillas durante el almacenamiento o después de la siembra, así como durante y después de la germinación de la planta. Esta fase es especialmente crítica puesto que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son especialmente sensibles, y un daño tan sólo pequeño puede provocar la muerte de la planta. Por lo tanto, existe un interés especial en proteger las semillas y la planta en germinación mediante el uso de agentes

adecuados.

El combate de parásitos animales y/u hongos dañinos fitopatógenos mediante el tratamiento de las semillas de las plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de continuas mejoras. Aún así surge una serie de problemas en el tratamiento de las semillas que no siempre se pueden solucionar de forma satisfactoria. Así, resulta deseable desarrollar procedimientos para la protección de las semillas y de la planta en germinación que hagan innecesaria, o al menos reduzcan claramente, la aplicación adicional de agentes fitoprotectores después de la siembra o después de la preemergencia de las plantas. Asimismo es deseable optimizar la cantidad de principio activo usado para que las semillas y la planta en germinación sean protegidas lo mejor posible de la infestación por hongos fitopatógenos sin dañar la planta misma con el principio activo usado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de las semillas también deberían incluir las propiedades fungicidas intrínsecas de las plantas transgénicas para lograr una protección óptima de las semillas y de la planta en germinación con un uso mínimo de agentes fitoprotectores.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento para la protección de semillas y plantas en germinación contra la infestación por parásitos animales y/u hongos dañinos fitopatógenos mediante el tratamiento de las semillas con un agente de acuerdo con la invención. La invención se refiere igualmente al uso de los agentes de acuerdo con la invención para el tratamiento de semillas para proteger las semillas y la planta en germinación contra hongos fitopatógenos. La invención también se refiere a semillas tratadas con un agente de acuerdo con la invención para protegerlas

de hongos fitopatógenos.

El combate de parásitos animales y/u hongos dañinos fitopatógenos que dañan las plantas después de la preemergencia se produce en primer lugar mediante el tratamiento del suelo y de las partes aéreas de la planta con
5 agentes fitoprotectores. Debido a las objeciones manifestadas en relación con la posible influencia de los agentes fitoprotectores sobre el medio ambiente y la salud de hombres y animales, se realizan esfuerzos por reducir la cantidad de principios activos esparcidos.

Una de las ventajas de la presente invención reside en que, gracias a las
10 propiedades sistémicas especiales de los agentes de acuerdo con la invención, el tratamiento de las semillas con estos agentes no sólo protege las semillas mismas contra parásitos animales y/u hongos dañinos fitopatógenos, sino también las plantas resultantes después de la preemergencia. De este modo se puede suprimir el tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la
15 siembra o poco después.

Igualmente ha de considerarse ventajoso que los principios activos o agentes de acuerdo con la invención también se puedan usar, en particular, en semillas transgénicas, de forma que la planta nacida de estas semillas sea capaz de expresar una proteína que actúa contra los parásitos. El tratamiento
20 de tales semillas con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención permite combatir determinados parásitos ya por medio de la expresión de, por ejemplo, la proteína insecticida. Sorprendentemente se puede observar un efecto sinérgico adicional, el cual aumenta adicionalmente la efectividad de la protección contra la infestación con parásitos.

25 Los agentes de acuerdo con la invención son adecuados para la

protección de las semillas de cualquier variedad vegetal que se use en la agricultura, en invernaderos, en bosques o en la horticultura. En particular, se trata de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, habas, café, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, hortalizas (como tomate, pepino, cebollas y lechuga), césped y plantas ornamentales. De especial importancia es el tratamiento de las semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz y arroz.

De especial importancia es el tratamiento de semillas transgénicas con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención, como se describirá también más adelante. Esto se refiere a las semillas de plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o de una proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo presente en las semillas transgénicas puede proceder, por ejemplo, de microorganismos de las especies *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. Este gen heterólogo procede preferentemente de *Bacillus sp.*, en el que el producto génico posee un efecto contra el barrenador del maíz (European corn borer) y/o gusano occidental de la raíz del maíz. El gen heterólogo procede con especial preferencia de *Bacillus thuringiensis*.

En el marco de la presente invención, el agente de acuerdo con la invención se aplica sobre las semillas solo o en una formulación adecuada. Las semillas se tratan preferentemente en un estado en el que son tan estables que no se producen daños durante la aplicación. En general, el tratamiento de las semillas se puede efectuar en cualquier momento entre la cosecha y la

siembra. Habitualmente se usan semillas que se han separado de la planta y de las que se han eliminado los espádices, las cáscaras, los tallos, la envoltura, la lana o el sarcocarpio. Así, por ejemplo, se pueden usar semillas que se han cosechado, limpiado y secado hasta un contenido en humedad inferior a 15% en peso. De forma alternativa, también se pueden usar semillas que se han tratado, por ejemplo, con agua después del secado y que se han vuelto a secar.

En general, en el tratamiento de las semillas se debe prestar atención a que la cantidad del agente de acuerdo con la invención aplicada sobre las semillas y/o de los aditivos adicionales se elija de tal manera, que no perjudique la germinación de las semillas ni dañe la planta resultante. Esto debe observarse sobre todo en el caso de principios activos que pueden mostrar efectos fitotóxicos a determinadas cantidades de aplicación.

Los agentes de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente, es decir, sin que contengan componentes adicionales y sin dilución. En general, es preferible aplicar los agentes sobre las semillas en forma de una formulación adecuada. Las formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos para el experto y se describen, por ejemplo, en los siguientes documentos: US 4,272,417 A, US 4,245,432 A, US 4,808,430 A, US 5,876,739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Los principios activos que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden incorporar en las formulaciones desinfectantes habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, estiércol semilíquido u otras masas envolventes para semillas, así como en

formulaciones de ULV (ultra bajo volumen).

Estas formulaciones se preparan de manera conocida mezclando los principios activos o las combinaciones de principios activos con aditivos habituales, como, por ejemplo, extensores y disolventes o diluyentes habituales, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran todos los colorantes habituales para tales propósitos. Se pueden usar tanto pigmentos poco solubles en agua como colorantes hidrosolubles. Como ejemplos son de mencionar los colorantes conocidos bajo los nombres de rodamina B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. pigmento solvente rojo 1.

Como humectantes que pueden estar contenidos en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran todas las sustancias que fomentan la humectación, habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente se pueden usar naftalenosulfonatos de alquilo, tales como naftalenosulfonatos de diisopropilo o de diisobutilo.

Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente se pueden usar dispersantes no iónicos o aniónicos, o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos

adecuados son de mencionar, en particular, polímeros de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno, éteres alquilfenolpoliglicólicos, así como éteres tristririlfenolglucólicos y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son, en especial, sulfonatos de lignina, sales del ácido poliacrílico y condensados de sulfonato de arilo y formaldehído.

Como antiespumantes pueden estar contenidas en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente se pueden usar antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención todas las sustancias que se pueden usar para tales fines en los agentes agroquímicos. A modo de ejemplo son de mencionar diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran todas las sustancias que se pueden usar para tales fines en los agentes agroquímicos. Preferentemente se consideran derivados de celulosa, derivados del ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y ácido silícico altamente disperso.

Como adhesivos que pueden estar contenidos en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran todos los aglutinantes habituales que se pueden usar en los desinfectantes. Preferentemente son de mencionar polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

Como giberelinas que pueden estar contenidas en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se consideran preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, usándose con especial preferencia el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas
5 (véase R. Wegler, "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pág. 401-412).

Las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar bien directamente o bien tras diluirlas previamente con agua para el tratamiento de todo tipo de semillas. Así, los concentrados o
10 las preparaciones que se pueden obtener a partir de ellos por dilución con agua se pueden usar para la desinfección de semillas de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de semillas de maíz, arroz, colza, guisantes, habas, algodón, girasol y remolacha, o también de semillas de hortalizas de la más diversa naturaleza. Las formulaciones desinfectantes que
15 se pueden usar de acuerdo con la invención o sus preparaciones diluidas también se pueden usar para la desinfección de semillas de plantas transgénicas. En este caso, al cooperar con las sustancias generadas por expresión, también pueden aparecer efectos sinérgicos adicionales.

Para el tratamiento de las semillas con las formulaciones desinfectantes
20 que se pueden usar de acuerdo con la invención o con las preparaciones elaboradas a partir de ellas por adición de agua se consideran todos los aparatos mezcladores que se pueden usar habitualmente para la desinfección. Concretamente, para la desinfección se procede introduciendo las semillas en un mezclador, añadiendo la cantidad deseada en cada caso de las
25 formulaciones desinfectantes, bien como tales o bien tras diluirlas previamente

con agua, y mezclando hasta obtener una distribución uniforme de la formulación sobre las semillas. Dado el caso sigue un proceso de secado.

La cantidad de aplicación de las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se puede variar en un amplio
5 intervalo. Se rige por el contenido correspondiente de los principios activos en las formulaciones y por las semillas. Las cantidades de aplicación de la combinación de principios activos se encuentran generalmente entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

10 Además, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención también muestran excelentes efectos antimicóticos. Poseen un muy amplio espectro de actividad antimicótica, especialmente contra dermatofitos y adelomicetos, moho y hongos difásicos (por ejemplo contra especies de *Candida*, como *Candida albicans*, *Candida glabrata*), así como contra
15 *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus*, como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton*, como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de *Microsporon*, como *Microsporon canis* y *audouinii*. El listado de estos hongos no constituye de ninguna manera una limitación del espectro micótico cubierto, sino que tiene únicamente carácter
20 explicativo.

Por lo tanto, los principios activos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden usar en aplicaciones tanto médicas como no médicas.

Los principios activos se pueden usar como tales, en forma de sus formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de ellas, tales
25 como soluciones listas para el uso, suspensiones, polvos para proyección,

pastas, polvos solubles, productos para espolvorear y gránulos. La aplicación se efectúa de manera habitual, por ejemplo por riego, aspersión, rociado, esparcimiento, pulverización, espumación, recubrimiento, etc. Asimismo es posible esparcir los principios activos según el procedimiento de ultra bajo volumen o inyectar la preparación de principios activos o el principio activo propiamente dicho en el suelo. También se pueden tratar las semillas de las plantas.

Cuando los principios activos de acuerdo con la invención se usan como fungicidas, las cantidades de aplicación se pueden variar en un amplio intervalo en función del tipo de aplicación. La cantidad de aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención se encuentra

- para el tratamiento de partes de la planta, por ejemplo de hojas: entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 10 y 1.000 g/ha, con especial preferencia entre 50 y 300 g/ha (si se aplican por riego o goteo se puede incluso reducir la cantidad de aplicación, sobre todo cuando se usan sustratos inertes, tales como lana mineral o perlita);
- para el tratamiento de semillas: entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas, con especial preferencia entre 2,5 y 25 g por 100 kg de semillas, con muy especial preferencia entre 2,5 y 12,5 g por 100 kg de semillas;
- para el tratamiento del suelo: entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000 g/ha.

Estas cantidades de aplicación sólo se mencionan a modo de ejemplo y de forma no limitante del alcance de la invención.

En cuanto a las parejas de mezcla adicionales posibles se remite a los

insecticidas y fungicidas antes mencionados.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar al mismo tiempo para la protección de objetos contra incrustaciones, en especial cascos de barcos, tamices, redes, edificios, instalaciones de muelle y dispositivos de
5 señalización que entran en contacto con agua marina o salobre.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar como agentes antiincrustantes solos o en combinación con otros principios activos.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención se puede usar para el tratamiento de organismos modificados genéticamente (OMG), por
10 ejemplo de plantas o semillas. Las plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado un gen heterólogo de forma estable en el genoma. La expresión "gen heterólogo" se refiere esencialmente a un gen que se prepara o ensambla en el exterior de la planta y que, al introducirlo en el genoma del núcleo celular, en el genoma del
15 cloroplasto o en el genoma mitocondrial, confiere a la planta transformada propiedades agronómicas nuevas o mejoradas u otras propiedades, de manera que exprese una proteína o un polipéptido de interés o regule a la baja o desconecte (por ejemplo, por medio de la tecnología antisentido, la tecnología de cosupresión o la tecnología de ARNi [interferencia por ARN]) otro gen
20 presente en la planta u otros genes presentes en la planta. Un gen heterólogo presente en el genoma se denomina también transgén. Un transgén definido por su presencia específica en el genoma de la planta se denomina evento de transformación o transgénico.

Dependiendo de las especies vegetales o las variedades vegetales, su
25 emplazamiento y sus condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de

- vegetación, alimentación), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede producir efectos superaditivos ("sinérgicos"). Así, por ejemplo, se pueden obtener los siguientes efectos que superan los efectos realmente esperados: menores cantidades de aplicación y/o mayor espectro de actividad
- 5 y/o mayor eficacia de los principios activos y de las composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia frente a sequía o frente al contenido de sales en el agua o en el suelo, mayor tasa de floración, facilitación de la cosecha, aceleración de la maduración, mayores
- 10 rendimientos, mayor tamaño de los frutos, mayor altura de las plantas, color verde más intenso de la hoja, flor más temprana, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor estabilidad al almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados.
- 15 En ciertas cantidades de aplicación, las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención también pueden ejercer un efecto fortificante sobre las plantas. Por lo tanto, son adecuadas para movilizar el sistema de defensa vegetal contra el ataque de hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados. Dado el caso, esto puede ser una de las
- 20 razones de la mayor eficacia de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo frente a hongos. En el presente contexto, las sustancias fortificantes de las plantas (inductoras de resistencia) también deben incluir aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa vegetal de tal manera que las plantas tratadas
- 25 presenten, cuando son inoculadas a continuación con hongos y/o

microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados, un grado de resistencia considerable frente a estos hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados. En el presente caso se entiende por hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados hongos, bacterias y virus fitopatógenos.

- 5 Por lo tanto, las sustancias de acuerdo con la invención se pueden usar para proteger las plantas contra el ataque de los agentes patógenos mencionados durante un cierto periodo de tiempo después de tratamiento. El periodo de tiempo durante el cual se alcanza un efecto protector abarca en general 1 a 10 días, preferentemente 1 a 7 días después del tratamiento de las plantas con los
- 10 principios activos.

Entre las plantas y las variedades de plantas que se tratan preferentemente de acuerdo con la invención se encuentran todas las plantas que disponen de material genético que confiere a estas plantas características especialmente útiles y ventajosas (independientemente de si éstas se han

15 obtenido por cultivo y/o por biotecnología).

Las plantas y variedades de plantas que también se tratan preferentemente de acuerdo con la invención son resistentes a uno o varios factores de estrés biótico, es decir, estas plantas presentan una mejor defensa contra parásitos animales y microbianos; tales como nemátodos, insectos,

20 ácaros, hongos, bacterias, virus y/o viroides fitopatógenos.

Las plantas y variedades de plantas que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son aquellas plantas que son resistentes a uno o varios factores de estrés abiótico. Entre las condiciones de estrés abiótico se pueden encontrar, por ejemplo, sequía, condiciones de frío y calor, estrés

25 osmótico, humedad excesiva por estancamiento, alto contenido de sales en el

suelo, mayor exposición a minerales, condiciones de ozono, condiciones de luz intensa, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes fosforados o evitación de sombra.

Las plantas y variedades de plantas que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son aquellas plantas que se caracterizan por propiedades que mejoran la cosecha. En estas plantas, una mayor cosecha puede deberse, por ejemplo, a una fisiología mejorada de la planta, un crecimiento mejorado de la planta y un desarrollo mejorado de la planta, tal como eficacia para aprovechar el agua, eficacia para retener el agua, mejor aprovechamiento del nitrógeno, mayor asimilación de carbono, fotosíntesis mejorada, mayor poder germinativo y maduración acelerada. También puede influir en la cosecha una arquitectura mejorada de la planta (en condiciones de estrés y no estrés), entre otras cosas una floración temprana, el control de la floración para la producción de semillas híbridas, el vigor del brote, el tamaño de la planta, el número y largo de los internudos, el crecimiento de la raíz, el tamaño de la semilla, el tamaño del fruto, el tamaño de las vainas, el número de vainas o espigas, el número de semillas por vaina o espiga, la masa de la semilla, un mayor relleno de semilla, una menor pérdida de semillas, menos vainas que revientan y estabilidad. Otras características de la cosecha incluyen la composición de las semillas, como el contenido en carbohidratos, el contenido en proteínas, el contenido en aceite y la composición del aceite, el valor nutritivo, la reducción de los compuestos no nutritivos, la mejor procesabilidad y la mejor estabilidad al almacenamiento.

Las plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas híbridas que ya expresan las características de la heterosis o del efecto

híbrido, lo que en general aumenta la cosecha, aumenta el vigor, mejora la salud y mejora la resistencia a factores de estrés biótico y abiótico. Tales plantas se crean típicamente cruzando una línea parental endogámica de polen estéril (la pareja de cruzamiento femenina) con otra línea parental endogámica de polen fértil (la pareja de cruzamiento masculina). Las semillas híbridas se recogen típicamente de las plantas de polen estéril y se venden a reproductores. A veces se pueden producir plantas de polen estéril (por ejemplo en el caso del maíz) por emasculación (es decir, eliminación mecánica de los órganos sexuales masculinos o de las flores masculinas); sin embargo, es más habitual que la esterilidad del polen se base en determinantes genéticos presentes en el genoma de la planta. En este caso, especialmente cuando en el caso del producto deseado que se quiere cosechar de las plantas híbridas se trata de las semillas, normalmente es conveniente asegurar que se restablece por completo la fertilidad del polen en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen. Esto se puede lograr asegurando que las parejas de cruzamiento masculinas poseen los genes correspondientes de restablecimiento de la fertilidad capaces de restablecer la fertilidad del polen en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen. Los determinantes genéticos para la esterilidad del polen pueden estar localizados en el citoplasma. Se han descrito ejemplos de esterilidad citoplasmática del polen (CMS) en, por ejemplo, especies de *Brassica*. No obstante, los determinantes genéticos para la esterilidad del polen también pueden estar localizados en el genoma del núcleo celular. También se pueden obtener plantas de polen estéril con procedimientos de biotecnología vegetal, tales

como ingeniería genética. En el documento WO 89/10396 se describe un medio especialmente conveniente para la generación de plantas de polen estéril, en el que se expresa selectivamente, por ejemplo, una ribonucleasa, tal como una barnasa, en las células del tapetum de los estambres. La fertilidad se
5 puede restablecer entonces en las células del tapetum por expresión de un inhibidor de la ribonucleasa, tal como barstar.

Las plantas o variedades de plantas (que se obtienen con procedimientos de biotecnología vegetal, tal como la ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a
10 herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes a uno o varios herbicidas predeterminados. Tales plantas se pueden obtener bien por transformación genética o bien por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tal tolerancia a herbicidas.

Las plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a
15 glifosato, es decir, plantas que se han hecho tolerantes al herbicida glifosato o a sus sales. Así, por ejemplo, se pueden obtener plantas tolerantes a glifosato por transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Ejemplos de tales genes EPSPS son el gen AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*,
20 el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.*, los genes que codifican una EPSPS de petunia, una EPSPS de tomate o una EPSPS de *Eleusine*. También puede tratarse de una EPSPS mutada. Las plantas tolerantes a glifosato también se pueden obtener por expresión de un gen que codifica una enzima glifosato-oxidorreductasa. Las plantas tolerantes a glifosato también se pueden
25 obtener por expresión de un gen que codifica una enzima glifosato-

acetiltransferasa. Las plantas tolerantes a glifosato también se pueden obtener por selección de las plantas que contienen mutaciones naturales de los genes antes mencionados.

Otras plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, plantas que se han hecho tolerantes a herbicidas que inhiben la enzima glutamina sintasa, tal como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Tales plantas se pueden obtener por expresión de una enzima que detoxifica el herbicida o un mutante de la enzima glutamina sintasa resistente a la inhibición. Una enzima con efecto detoxificante es, por ejemplo, una enzima que codifica una fosfinotricina-acetiltransferasa (como, por ejemplo, la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Se han descrito plantas que expresan una fosfinotricina-acetiltransferasa exógena.

Otras plantas tolerantes a herbicidas son también plantas que se han hecho tolerantes a los herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvato-dioxigenasa (HPPD). En el caso de las hidroxifenilpiruvato-dioxigenasas se trata de enzimas que catalizan la reacción en la que se transforma para-hidroxifenilpiruvato (HPP) en homogentisato. Las plantas que son tolerantes a los inhibidores de la HPPD se pueden transformar con un gen que codifica una enzima HPPD resistente presente en la naturaleza o con un gen que codifica una enzima HPPD mutada. También se puede lograr una tolerancia a los inhibidores de la HPPD por transformación de plantas con genes que codifican determinadas enzimas que permiten la formación de homogentisato pese a la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de la HPPD. La tolerancia de las plantas a los inhibidores de la HPPD también se puede mejorar transformando las plantas, además de con un gen que codifica una enzima HPPD tolerante, con un gen que codifica una enzima prefenato-

deshidrogenasa.

Otras plantas resistentes a herbicidas son plantas que se han hecho tolerantes a inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS). Entre los inhibidores de la ALS conocidos se encuentran, por ejemplo, herbicidas de tipo
5 sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidina, pirimidiniloxi(tio)benzoato y/o sulfonilaminocarboniltriazolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (conocida también como acetohidroxiácido-sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas o grupos de herbicidas. En la publicación internacional WO 1996/033270 se describe la generación de
10 plantas tolerantes a sulfonilurea y de plantas tolerantes a imidazolinona. Se han descrito otras plantas tolerantes a imidazolinona. Otras plantas tolerantes a sulfonilurea y a imidazolinona también se describen, por ejemplo, en el documento WO 2007/024782.

Otras plantas que son tolerantes a imidazolinona y/o a sulfonilurea se
15 pueden obtener por mutagénesis inducida, selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o cultivo de mutaciones.

Las plantas o variedades de plantas (obtenidas según procedimientos de biotecnología vegetal, tales como la ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes
20 a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes a la infestación por determinados insectos objetivo. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tal resistencia a insectos.

La expresión "planta transgénica resistente a insectos" abarca en el
25 presente contexto cualquier planta que contenga al menos un transgén que

comprende una secuencia codificante que codifica lo siguiente:

- 1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una parte insecticida de ella, como las proteínas cristalinas insecticidas descritas online en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), o partes
5 insecticidas de ellas, por ejemplo proteínas de las clases de proteínas Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae o Cry3Bb o partes insecticidas de ellas; o
- 2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte de ella que actúa como insecticida en presencia de una segunda proteína cristalina
10 diferente de *Bacillus thuringiensis* o de una parte de ella, como la toxina binaria compuesta por las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o
- 3) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de dos proteínas cristalinas insecticidas diferentes de *Bacillus thuringiensis*, como, por ejemplo, un híbrido de las proteínas de 1) anteriores o un híbrido de las proteínas de 2)
15 anteriores, por ejemplo la proteína Cry1A.105, producida por el evento de maíz MON98034 (documento WO 2007/027777); o
- 4) una proteína según los puntos 1) a 3) anteriores en la que algunos, en especial 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otro aminoácido para lograr una mayor eficacia insecticida frente a una especie de insecto objetivo
20 y/o para ampliar el espectro de las especies de insecto objetivo correspondientes y/o por modificaciones inducidas en el ADN codificante durante la clonación o transformación, como la proteína Cry3Bb1 en los eventos de maíz MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el evento de maíz MIR 604;
- 25 5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus*

cereus o una parte insecticida de ella, como las proteínas insecticidas vegetativas (vegetative insecticidal proteins, VIP) expuestas en http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

- 5 6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que actúa como insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, como la toxina binaria compuesta por las proteínas VIP1A y VIP2A;
- 7) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de diferentes
- 10 proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, como un híbrido de las proteínas de 1) o un híbrido de las proteínas de 2) anteriores; o
- 8) una proteína según uno de los puntos 1) a 3) anteriores en la que algunos, en especial 1 a 10, aminoácidos han sido sustituidos por otro aminoácido para lograr una mayor eficacia insecticida frente a una especie de
- 15 insecto objetivo y/o para ampliar el espectro de las especies de insecto objetivo correspondientes y/o por modificaciones inducidas en el ADN codificante durante la clonación o transformación (en las que se conserva la codificación de una proteína insecticida), como la proteína VIP3Aa en el evento del algodón COT 102.
- 20 Entre las plantas transgénicas resistentes a insectos naturalmente también se encuentra en el presente contexto cualquier planta que comprenda una combinación de genes que codifican las proteínas de una de las clases 1 a 8 antes mencionadas. En una forma de realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de una de las
- 25 clases 1 a 8 antes mencionadas, para ampliar el espectro de las especies de

insecto objetivo correspondiente o para retrasar el desarrollo de resistencia de los insectos a las plantas usando diferentes proteínas que son insecticidas para la misma especie de insecto objetivo pero que presentan un modo de acción diferente, como la unión a diferentes puntos de unión del receptor en el insecto.

5 Las plantas o variedades de plantas (obtenidas según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son tolerantes a factores de estrés abiótico. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tal resistencia al estrés.

10 Entre las plantas especialmente útiles con tolerancia al estrés se encuentran las siguientes:

a. Plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o actividad del gen para la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células vegetales o plantas.

15 b. Plantas que contienen un transgén que fomenta la tolerancia al estrés y es capaz de reducir la expresión y/o actividad de los genes que codifican la PARP de las plantas o células vegetales.

c. Plantas que contienen un transgén que fomenta la tolerancia al estrés y codifica una enzima funcional en plantas de la ruta biosintética de recuperación de nicotinamida-adenina-dinucleótido, entre ellas la nicotinamidasasa, la nicotinafosforribosil-transferasa, la ácido nicotínico-mononucleótido-adeniltransferasa, la nicotinamida-adenina-dinucleótido-sintetasa o la nicotinamida-fosforribosil-transferasa.

25 Las plantas o variedades de plantas (obtenidas según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también se pueden

tratar de acuerdo con la invención presentan modificaciones en la cantidad, calidad y/o estabilidad al almacenamiento del producto cosechado y/o propiedades modificadas de componentes determinados del producto cosechado, como, por ejemplo:

- 5 1) Plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado que está alterado en cuanto a sus propiedades físico-químicas, en particular respecto al contenido en amilosa o la relación amilosa/ amilopectina, el grado de ramificación, la longitud de cadena media, la distribución de las cadenas laterales, el comportamiento de viscosidad, la solidez del gel, el tamaño de
10 grano del almidón y/o la morfología del grano de almidón en comparación con el almidón sintetizado en células vegetales o plantas silvestres, de manera que este almidón modificado es más apropiado para determinadas aplicaciones.
- 2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros de carbohidratos distintos de almidón o polímeros de carbohidratos distintos de almidón cuyas
15 propiedades están alteradas en comparación con las plantas silvestres sin modificación genética. Ejemplos son plantas que producen polifruktosa, en particular de tipo inulina y levano, plantas que producen alfa-1,4-glucanos, plantas que producen alfa-1,4-glucanos con ramificaciones alfa-1,6 y plantas que producen alternano.
- 20 3) Plantas transgénicas que producen hialuronano.

Las plantas o variedades de plantas (obtenidas según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas tales como las plantas de algodón que presentan fibras con propiedades modificadas. Tales plantas se
25 pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que

contienen una mutación que confiere tales propiedades modificadas de las fibras; entre ellas se encuentran:

- a) plantas tales como las plantas de algodón que contienen una forma modificada de los genes de la síntesis de celulosa,
- 5 b) plantas tales como las plantas de algodón que contienen una forma modificada de los ácidos nucleicos homólogos a rsw2 o rsw3;
- c) plantas tales como las plantas de algodón con una expresión aumentada de la sacarosa-fosfato-sintasa;
- d) plantas tales como las plantas de algodón con una expresión aumentada
10 de la sacarosa-sintasa;
- e) plantas tales como las plantas de algodón en las que está modificado el momento de la regulación del paso de los plasmodesmos en la base de la célula fibrosa, por ejemplo por regulación a la baja de la β -1,3-glucanasa selectiva de fibras;
- 15 f) plantas tales como las plantas de algodón con fibras de reactividad modificada, por ejemplo por expresión del gen de la N-acetilglucosamina-transferasa, también nodC, y de genes de la quitina-sintasa.

Las plantas o variedades de plantas (obtenidas según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también se pueden
20 tratar de acuerdo con la invención son plantas tales como la colza o plantas de *Brassica* relacionadas que presentan una composición de aceite con propiedades modificadas. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tales propiedades modificadas del aceite; entre ellas se encuentran:

- 25 a) plantas tales como las plantas de colza que producen aceite con un alto

contenido en ácido oleico;

b) plantas tales como las plantas de colza que producen aceite con un bajo contenido en ácido linolénico;

c) plantas tales como las plantas de colza que producen aceite con un bajo contenido en ácidos grasos saturados.

Las plantas transgénicas especialmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas con uno o varios genes que codifican una o varias toxinas, y son las plantas transgénicas ofrecidas bajo los siguientes nombres comerciales: YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, habas de soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), BiteGard® (por ejemplo maíz), BT-Xtra® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón), Nucotn 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Las plantas tolerantes a herbicidas que cabe mencionar son, por ejemplo, variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se ofrecen bajo los siguientes nombres comerciales: Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, haba de soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinona) y SCS® (tolerancia a sulfonilurea), por ejemplo maíz. Entre las plantas resistentes a herbicidas (plantas cultivadas de forma tradicional para obtener tolerancia a herbicidas) que cabe mencionar se encuentran las variedades ofrecidas bajo el nombre de Clearfield® (por ejemplo maíz).

Las plantas transgénicas especialmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que contienen eventos de transformación o una combinación de eventos de transformación y que se exponen, por

ejemplo, en los documentos de diferentes administraciones nacionales o regionales (véanse, por ejemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Las plantas expuestas se pueden tratar de forma especialmente
5 ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de fórmula general (I) o con las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos antes indicados para los principios activos o las mezclas también se aplican al tratamiento de estas plantas. Cabe señalar en particular el tratamiento de las plantas con los compuestos o las mezclas expuestas
10 especialmente en el presente texto.

Así pues, los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden usar para proteger las plantas contra la infestación por los organismos causantes de daño mencionados durante un cierto periodo de tiempo después del tratamiento. El periodo de tiempo en el cual se produce
15 protección se extiende generalmente a entre 1 y 28 días, preferentemente a entre 1 y 14 días, con especial preferencia a entre 1 y 10 días, con muy especial preferencia a entre 1 y 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos, o hasta 200 días después del tratamiento de las semillas.

20 La preparación y el uso de los principios activos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se desprenden de los ejemplos siguientes. Sin embargo, la invención no está limitada a estos ejemplos.

Generalidades: Todos los pasos de purificación o separación cromatográfica se realizan, salvo que se indique lo contrario, en gel de sílice y
25 con un gradiente de disolventes de acetato de etilo/ ciclohexano 0:100 a

acetato de etilo/ ciclohexano 100:0.

Generalidades: Todos los pasos de purificación o separación cromatográfica se realizan, salvo que se indique lo contrario, en gel de sílice y con un gradiente de disolventes de acetato de etilo/ hexano 0:100 a acetato de etilo/ hexano 100:0.

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (XVIII):

3-terc-Butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol (XVIII-1)

A una solución de 1,1,1,2,2-pentafluoro-6,6-dimetilheptano-3,5-diona (10,1 g) en etanol (100 ml) se añade a temperatura ambiente hidrazina hidrato (2,06 g). La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente. Tras eliminar los disolventes a presión reducida se obtiene 3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol (7,9 g, 79%).

logP (pH 2,7): 3,23

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,30 (s, 9H), 6,40 (s, 1H), 13,3 (s, 1H)

EM (ESI): 243 ([M+H]⁺)

5-terc-Butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (XVIII-2)

A 1,1,1-trifluoro-5,5-dimetilhexano-2,4-diona (14,1 g) se añade hidrazina hidrato (3,61 g) de forma análoga al ejemplo XVIII-1. Se obtiene 5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (10,7 g, 77%).

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,30 (s, 9H), 6,39 (s, 1H), 13,1 (s, 1H)

EM (ESI): 192 ([M]⁺)

3-Isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol (XVIII-3)

A 1,1,1-trifluoro-5-metilhexano-2,4-diona (24,9 g) se añade hidrazina hidrato (6,84 g) de forma análoga al ejemplo XVIII-1. Se obtiene 3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol (19 g, 78%).

^1H -RMN (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,23 (d, 6H), 3,02 (septete, 1H), 6,39 (s, 1H), 13,1 (s, 1H)

EM (ESI): 178 ($[\text{M}]^+$)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (XVI):

- 5 **[3-terc-Butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-1) y [5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-2)**

A una solución de 5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (XVIII-2, 10,7 g) en acetonitrilo (150 ml) se añade carbonato potásico (15,4 g). Después se añade gota a gota bromoacetato de etilo (13,9 g) a temperatura ambiente. La
10 mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente, después se filtra y se concentra a presión reducida. El residuo se purifica por cromatografía. Se obtienen [3-terc-butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (7,84 g, 50%) y [5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (4,53 g, 29%).

- 15 **[3-terc-Butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-1)**

logP (pH 2,7): 3,89

^1H -RMN (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,18 (t, 3H), 1,26 (s, 9H), 4,15 (c, 2H), 5,06 (s, 2H), 6,79 (s, 1H)

EM (ESI): 279 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

- 20 **[5-terc-Butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-2)**

logP (pH 2,7): 3,48

^1H -RMN (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,20 (t, 3H), 1,31 (s, 9H), 4,17 (c, 2H), 5,18 (s, 2H), 6,47 (s, 1H)

EM (ESI): 279 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

- 25 **[3-terc-Butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-3) y [5-**

terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-4)

Se hace reaccionar 3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol (XVIII-1, 7,90 g) con bromoacetato de etilo (8,17 g) de forma análoga a los ejemplos XVI-1 y XVI-2. Tras la purificación cromatográfica se obtienen [3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (2,50 g, 23%) y [5-terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (4,80 g, 45%).

[3-terc-Butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-3)

logP (pH 2,7): 4,45

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,18 (t, 3H), 1,26 (s, 9H), 4,15 (c, 2H), 5,07 (s, 2H), 6,75 (s, 1H)

EM (ESI): 329 ([M+H]⁺)

[5-terc-Butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-4)

logP (pH 2,7): 4,05

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,18 (t, 3H), 1,32 (s, 9H), 4,16 (c, 2H), 5,20 (s, 2H), 6,47 (s, 1H)

EM (ESI): 329 ([M+H]⁺)

[3-Isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-5)

Se hace reaccionar 3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol (XVIII-3, 19,3 g) con bromoacetato de etilo (27,1 g) de forma análoga a los ejemplos XVI-1 y XVI-2. Se obtiene [3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (26,2 g, 92%).

logP (pH 2,7): 3,22

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,18-1,22 (m, 3H), 1,20 (d, 6H), 3,0 (septete, 1H), 4,17 (c, 2H), 5,11 (s, 2H), 6,54 (s, 1H)

EM (ESI): 265 ([M+H]⁺)

[4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-6)

Se hace reaccionar 4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol (14,9 g) con bromoacetato de etilo (20,3 g) de forma análoga a los ejemplos XVI-1 y XVI-2. Se obtiene [4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (19,5 g, 89%).

logP (pH 2,7): 3,11

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,22 (t, 3H), 2,25 (s, 3H), 4,18 (c, 2H), 5,24 (s, 2H)

EM (ESI): 271 ([M+H]⁺)

10 Preparación de las sustancias de partida de fórmula (V):**Ácido [3-terc-butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-1)**

A una solución de [3-terc-butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-1, 7,80 g) en tetrahidrofurano (80 ml) se añade gota a gota a temperatura ambiente una solución de hidróxido de litio monohidrato (2,35 g) en agua (20 ml). La mezcla de reacción se agita durante 2 horas. Tras eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se ajusta lentamente a pH 2-3 a 0°C con ácido clorhídrico diluido (1 M). Tras la filtración y el secado se obtiene ácido [3-terc-butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético en forma de sólido blanco (7,1 g, 100%).

20 logP (pH 2,7): 2,45

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,26 (s, 9H), 4,95 (s, 2H), 6,76 (s, 1H)

EM (ESI): 251 ([M+H]⁺)

Ácido [5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-2)

Se hace reaccionar [5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-2, 4,50 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el

25 de etilo (XVI-2, 4,50 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el

secado se obtiene ácido [5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (3,9 g, 95%).

logP (pH 2,7): 2,45

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,26 (s, 9H), 4,95 (s, 2H), 6,76 (s, 1H)

5 EM (ESI): 251 ([M+H]⁺)

Ácido [3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-3)

Se hace reaccionar [3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-3, 2,50 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el secado se obtiene ácido [3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acético

10 (1,8 g, 79%).

logP (pH 2,7): 2,92

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,27 (s, 9H), 4,96 (s, 2H), 6,72 (s, 1H)

EM (ESI): 301 ([M+H]⁺)

Ácido [5-terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-4)

15 Se hace reaccionar [5-terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-4, 4,80 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el secado se obtiene ácido [5-terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-il]acético (3,5 g, 80%).

logP (pH 2,7): 2,75

20 ¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,33 (s, 9H), 5,09 (s, 2H), 6,45 (s, 1H)

EM (ESI): 301 ([M+H]⁺)

Ácido [3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-5)

Se hace reaccionar [3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-5, 26,2 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el secado

25 se obtiene ácido [3-isopropil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (22 g,

94%).

logP (pH 2,7): 2,05

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,21 (d, 6H), 2,99 (septete, 1H), 4,99 (s, 2H), 6,51 (s, 1H)

5 EM (ESI): 237 ([M+H]⁺)

Ácido [4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (V-6)

Se hace reaccionar [4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetato de etilo (XVI-6, 18,0 g) de forma análoga al ejemplo V-1. Tras la filtración y el secado se obtiene ácido [4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (15,5 g, 96%).

logP (pH 7,8): 0,68

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 2,24 (s, 3H), 3,13 (sa, 1H), 5,04 (s, 2H)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (VI):

Cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-1)

15 A una solución de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (25,0 g) en éter dietílico (200 ml) se añade gota a gota a 0°C y bajo argón una solución de cloruro de hidrógeno 2 molar en éter dietílico (370 ml). La mezcla de reacción se agita a 0°C y después se calienta lentamente a temperatura ambiente. Tras agitar durante la noche se elimina el

20 disolvente y el exceso de cloruro de hidrógeno. Se obtiene cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (20,0 g, 98%).

logP (pH 2,7): 0,42

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,97-2,04 (m, 2H), 2,18-2,23 (m, 2H), 2,98-3,08 (m, 2H), 3,31-3,39 (m, 2H), 3,42 (m, 1H), 4,30 (c, 2H), 8,39

25 (s, 1H), 8,90 (sa, 1H), 9,13 (sa, 1H).

EM (ESI): 241 ([M-Cl]⁺)

Cloruro de 3-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-2)

Se hace reaccionar 3-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (13,8 g) de forma análoga al ejemplo VI-1. Se obtiene
 5 cloruro de 3-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (10,4 g, 93%).

logP (pH 2,7): 0,54

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,75-1,82 (m, 1H), 1,87-1,92 (m, 2H), 2,17-2,20 (m, 1H), 2,90-2,94 (m, 1H), 3,10-3,25 (m, 1H), 3,25-3,28 (m, 1H), 3,57 (m, 1H), 3,62 (m, 1H), 4,30 (c, 2H), 8,43 (s, 1H), 9,29-9,34 (m, 2H).

10 EM (ESI): 241 ([M-Cl]⁺)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (IV):

2-(1-{{3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-1)

A. una solución de ácido [3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético
 15 (8,00 g) en diclorometano (200 ml) se añaden cloruro de oxalilo (6,91 g) y una gota de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente y después se elimina el exceso de cloruro de oxalilo a presión reducida. El residuo se vuelve a disolver en diclorometano (20 ml) y se añade a una solución de cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-
 20 il]piperidinio (VI-1, 7,53 g) y base de Hünig (10,6 g) en diclorometano (80 ml). La mezcla de reacción se agita durante 24 horas a temperatura ambiente, se vierte sobre una mezcla de hielo y agua, se neutraliza con una solución saturada de bicarbonato y se extrae con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan mediante sulfato sódico y se concentran a presión reducida.
 25 El residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 2-(1-{{3,5-bis(difluorometil)-

1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (10 g, 63%).

logP (pH 2,7): 2,52

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,55-1,85 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 3,20-3,60 (m, 4H), 3,99 (sa, 1H), 4,30 (c, 2H), 5,35 (s, 2H), 6,83-7,30 (m, 3H), 8,37 (s, 1H).

EM (ESI): 449 ([M+H]⁺)

2-(1-{[3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-2)

Se hace reaccionar cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-1, 5,50 g) con ácido [3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (3,86 g) de forma análoga al ejemplo IV-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (5,1 g, 62%).

logP (pH 2,7): 2,41

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,63 (sa, 1H), 1,75 (sa, 1H), 2,05-2,15 (m, 2H), 2,88 (sa, 1H), 3,26 (sa, 1H), 3,36 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,30 (c, 2H), 4,35 (sa, 1H), 5,28 (s, 2H), 6,67 (d, 1H), 7,85 (dd, 1H), 8,36 (s, 1H).

EM (ESI): 417 ([M+H]⁺)

2-(1-{[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-3-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-3)

Se hace reaccionar cloruro de 3-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-2, 5,32 g) con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (4,00 g) de forma análoga al ejemplo IV-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

il]acetil}piperidin-3-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (5,7 g, 69%).

logP (pH 2,7): 2,78

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,29 (t, 3H), 1,50-1,74 (m, 2H), 1,79-1,89 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 3,18 (m, 1H), 3,39 (m, 0,5H), 3,69 (m, 0,5H), 3,86-3,89 (m, 1H), 4,00 (m, 0,5H), 4,30 (c, 2H), 4,45 (m, 0,5H), 4,90 (m, 1H), 5,25-5,30 (m, 2H), 6,44 (s, 1H), 8,40 (s, 1H).

EM (ESI): 431 ([M+H]⁺)

2-{1-[2-(3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-il)-2-metilpropanoil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-4)

10 Se hace reaccionar cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-1, 8,23 g) con ácido 2-(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)-2-metilpropanoico (5,42 g) de forma análoga al ejemplo IV-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-{1-[2-(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)-2-metilpropanoil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (9,64 g, 80%).

15 logP (pH 7,8): 2,34

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,29 (t, 3H), 1,41 (m, 2H), 1,66 (s, 6H), 1,90 (m, 2H), 2,11 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 2,81 (m, 2H), 3,22 (m, 1H), 3,59 (m, 1H), 4,10 (m, 1H), 4,28 (c, 2H), 5,89 (s, 1H), 8,32 (s, 1H).

EM (ESI): 405 ([M+H]⁺)

20 **2-(1-{[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-5)**

Se hace reaccionar cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-1, 4,65 g) con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (3,50 g) de forma análoga al ejemplo IV-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

25 cromatográfica se obtiene 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (5,00 g, 69%).

logP (pH 2,7): 2,62

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,62 (sa, 1H), 1,80 (sa, 1H), 2,06-2,16 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,88 (sa, 1H), 3,28 (sa, 1H), 3,37 (m, 1H), 3,99 (sa, 1H), 4,30 (c, 2H), 4,33 (sa, 1H), 5,22 (sa, 2H), 6,45 (s, 1H), 8,37 (s, 1H).

EM (ESI): 431 ([M+H]⁺)

2-(1-{[4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-6)

Se hace reaccionar cloruro de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (VI-1, 5,50 g) con ácido [4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (4,82 g) de forma análoga al ejemplo IV-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (6,00 g, 65%).

logP (pH 2,7): 3,17

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,31 (t, 3H), 1,61 (sa, 1H), 1,81 (sa, 1H), 2,05-2,15 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,88 (sa, 1H), 3,27 (sa, 1H), 3,37 (m, 1H), 3,95 (sa, 1H), 4,30 (c, 2H), 4,32 (sa, 1H), 5,27-5,35 (3, 2H), 8,37 (s, 1H).

EM (ESI): 465 ([M+H]⁺)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (III):

Ácido 2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-1)

Se disuelve 2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-1, 13,3 g) en tetrahidrofurano (80 ml). Después se añade el LiOH monohidrato (1,86 g) disuelto en agua (20 ml). Al

cabo de 3 horas se añade agua, se ajusta a pH 2-3 con ácido clorhídrico diluido (1 M), después se extrae con acetato de etilo y todas las fases orgánicas se secan con sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el disolvente se elimina por destilación. Se obtiene ácido 2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (11,7 g, 94%).

logP (pH 2,7): 1,71

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,55-1,85 (m, 2H), 2,09-2,13 (m, 2H), 2,80-3,30 (m, 3H), 3,36 (m, 1H), 3,99 (sa, 1H), 4,30 (sa, 1H), 5,34 (s, 2H), 6,85 (s, 1H), 6,98 (t, 1H), 7,14 (t, 1H), 8,29 (s, 1H).

EM (ESI): 421 ([M+H]⁺)

Ácido 2-(1-{[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-2)

Se hace reaccionar 2-(1-{[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-2, 5,20 g) de forma análoga al ejemplo III-1. Tras el secado se obtiene ácido 2-(1-{[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (4,6 g, 95%).

logP (pH 2,7): 1,65

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,64 (sa, 1H), 1,76 (sa, 1H), 2,05-2,15 (m, 2H), 2,88 (sa, 1H), 3,23 (sa, 1H), 3,36 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,34 (sa, 1H), 5,28 (s, 2H), 6,67 (d, 1H), 7,85 (dd, 1H), 8,29 (s, 1H).

EM (ESI): 389 ([M+H]⁺)

Ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-3-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-3)

Se hace reaccionar 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}-

piperidin-3-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-3, 5,70 g) de forma análoga al ejemplo III-1. Tras el secado se obtiene ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-3-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (5,4 g, 100%).

logP (pH 2,7): 1,90

- 5 $^1\text{H-RMN}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,48-1,88 (m, 4H), 2,20 (s, 3H), 3,38 (m, 0,5H), 3,60 (m, 0,5H), 3,87 (m, 2H), 4,01 (m, 0,5H), 4,45 (m, 0,5H), 5,24-5,28 (m, 3H), 6,44 (s, 1H) 8,32 (s, 1H).

EM (ESI): 403 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

- Ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4)**

- 10 Se hace reaccionar 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-5, 5,10 g) de forma análoga al ejemplo III-1. Tras el secado se obtiene ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (4,63 g, 97%).

- 15 logP (pH 2,7): 1,82

$^1\text{H-RMN}$ (DMSO- d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,62 (sa, 1H), 1,79 (sa, 1H), 2,06-2,16 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,88 (sa, 1H), 3,28 (sa, 1H), 3,37 (m, 1H), 3,99 (sa, 1H), 4,33 (sa, 1H), 5,21 (sa, 2H), 6,45 (d, 1H), 8,30 (s, 1H).

EM (ESI): 403 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

- 20 **Ácido 2-(1-{[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-5)**

- 25 Se hace reaccionar 2-(1-{[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de etilo (IV-6, 6,00 g) de forma análoga al ejemplo III-1. Tras el secado se obtiene ácido 2-(1-{[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico

(3,10 g, 55%).

logP (pH 2,7): 2,26

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,61 (sa, 1H), 1,81 (sa, 1H), 2,05-2,17 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,89 (sa, 1H), 3,27 (sa, 1H), 3,37 (m, 1H), 3,95 (sa, 1H), 4,32 (sa, 1H), 5,27-5,34 (m, 2H), 8,29 (s, 1H).

EM (ESI): 437 ([M+H]⁺)

Preparación de los compuestos de fórmula (I):

2-(1-{{3,5-bis(Difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (I-811)

10 A una solución de ácido 2-(1-{{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-1, 7,00 g) en diclorometano (80 ml) se añade a temperatura ambiente ciclohexanol (2,17 g), dimetilaminopiridina (0,20 g) y 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (3,35 g). La mezcla se agita durante la noche y después se añade agua. La fase acuosa se separa y se extrae con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan con sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el disolvente se elimina por destilación. El residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 2-(1-{{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (2,83 g, 34%).

20 logP (pH 2,7): 3,64

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,29-1,90 (m, 12H), 2,09-2,12 (m, 2H), 2,88 (sa, 1H), 3,25 (sa, 1H), 3,39 (m, 1H), 4,01 (sa, 1H), 4,30 (sa, 1H), 4,88-4,93 (m, 1H), 5,35 (s, 2H), 6,85 (s, 1H), 6,96 (t, 1H), 7,14 (t, 1H), 8,34 (s, 1H).

EM (ESI): 503 ([M+H]⁺)

25 **2-(1-{{3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-**

4-carboxilato de 1-naftilo (I-813)

Se hace reaccionar ácido 2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-1, 7,00 g) con 1-naftol (3,12 g) de forma análoga al ejemplo I-811. Tras la purificación cromatográfica se
5 obtiene 2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (4,0 g, 44%).

logP (pH 2,7): 3,64

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,70 (sa, 1H), 1,87 (sa, 1H), 2,18 (m, 2H), 2,91 (sa, 1H), 3,31 (sa, 1H), 3,48 (m, 1H), 4,03 (sa, 1H), 4,36 (sa, 1H), 5,36 (s,
10 2H), 6,85 (s, 1H), 6,97 (t, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,54-7,61 (m, 3H), 7,89 (m, 2H), 8,01 (m, 1H), 8,84 (s, 1H).

EM (ESI): 547 ([M+H]⁺)

2-(1-[[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (I-227)

15 A una solución de ácido 2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 200 mg) en diclorometano (2 ml) se añaden cloruro de oxalilo (189 mg) y una gota de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente y después se elimina el exceso de cloruro de oxalilo a
20 presión reducida. El residuo se vuelve a disolver en diclorometano (2 ml) y se añade a una solución de 1-naftol (79 mg) y piridina (489 mg) en diclorometano (4 ml). La mezcla se agita durante una hora a temperatura ambiente y después se añade ácido clorhídrico diluido (1 M). La fase acuosa se separa y se extrae con acetato de etilo, y después se secan las fases orgánicas reunidas con
25 sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el disolvente se elimina por

destilación. El residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 2-(1-([5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (100 mg, 38%).

logP (pH 2,7): 3,75

- 5 ^1H -RMN (CD_3CN , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,72-2,00 (m, 2H), 2,19-2,27 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,92 (sa, 1H), 3,34 (sa, 1H), 3,42 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,49 (sa, 1H), 5,06 (sa, 2H), 6,37 (s, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,52-7,60 (m, 3H), 7,86 (d, 1H), 7,92-7,99 (m, 2H), 8,55 (s, 1H).

EM (ESI): 529 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

- 10 **2-(1-([5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo (I-224).**

A una solución de ácido 2-(1-([5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 380 mg) en tetrahidrofurano (2,5 ml) se añaden a temperatura ambiente 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ol (155
15 mg) y trifenilfosfina (758 mg). La mezcla se agita durante 5 minutos a 0°C y bajo argón y después se añade gota a gota diazen-1,2-dicarboxilato de dietilo (383 mg). La mezcla de reacción se calienta lentamente a temperatura ambiente. Al cabo de 2 horas se elimina el disolvente a presión reducida y el residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 2-(1-([5-metil-3-
20 (trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo (196 mg, 39%).

logP (pH 2,7): 4,01

- ^1H -RMN (DMSO-d_6 , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,52-1,88 (m, 3H), 1,88-2,15 (m, 4H), 2,22 (s, 3H), 2,70-2,99 (m, 4H), 3,25 (sa, 1H), 3,38 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,33 (sa,
25 1H), 5,21 (sa, 2H), 6,12 (t, 1H), 6,44 (s, 1H), 7,15-7,19 (m, 2H), 7,21-7,30 (m,

2H), 8,35 (s, 1H).

EM (ESI): 403 ([M+H-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ol]⁺)

2-(1-{[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (I-220)

5 Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 6,00 g) con ciclohexanol (1,94 g) de forma análoga al ejemplo I-811. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (5,00 g,
10 69%).

logP (pH 2,7): 3,74

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,25-1,48 (m, 3H), 1,50-2,00 (m ancho, 2H), 1,50-1,51 (m, 3H), 1,70-1,80 (m, 2H), 1,85-1,92 (m, 2H), 2,06-2,16 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,88 (sa, 1H), 3,28 (sa, 1H), 3,38 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,34
15 (sa, 1H), 4,91 (septete, 1H), 5,21 (sa, 2H), 6,44 (s, 1H), 8,34 (s, 1H).

EM (ESI): 485 ([M+H]⁺)

2-(1-{[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 2-bromobencilo (I-820)

Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4,
20 100 mg) con (2-bromofenil)metanol (49,0 mg) de forma análoga al ejemplo I-811. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 2-bromobencilo (123 mg, 89%).

25 logP (pH 2,7): 3,80

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,62 (sa, 1H), 1,80 (sa, 1H), 2,07-2,19 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,88 (sa, 1H), 3,27 (sa, 1H), 3,38 (m, 1H), 3,99 (sa, 1H), 4,43 (sa, 1H), 5,22 (sa, 2H), 5,38 (s, 2H), 6,44 (s, 1H), 7,32 (td, 1H), 7,43 (td, 1H), 7,56 (dd, 1H), 7,67 (dd, 1H), 8,46 (s, 1H).

5 EM (ESI): 571, 573 ([M+H]⁺)

2-(1-{{3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 3,3-dimetilbutilo (I-767)

Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-{{3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-2, 200 mg) con 3,3-dimetilbutan-1-ol (68,0 mg) de forma análoga al ejemplo I-811. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{{3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 3,3-dimetilbutilo (98 mg, 40%).
logP (pH 2,7): 3,82

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 0,96 (s, 9H), 1,50-1,85 (m ancho + t, 4H),
15 2,06-2,13 (m, 2H), 2,88 (sa, 1H), 3,28 (sa, 1H), 3,38 (m, 1H), 3,98 (sa, 1H), 4,31 (t, 2H), 4,34 (sa, 1H), 5,28 (sa, 2H), 6,66 (d, 1H), 7,85 (s, 1H), 8,34 (s, 1H).
EM (ESI): 473 ([M+H]⁺)

2-(1-{{5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbotioato de S-(4-fluorobencilo) (I-27)

20 Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-{{5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 200 mg) con (4-fluorofenil)metanotiol (78,0 mg) de forma análoga al ejemplo I-227. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{{5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il}acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbotioato de S-(4-fluorobencilo) (110 mg, 42%).
25

logP (pH 2,7): 4,00

¹H-RMN (CD₃CN, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,64-1,88 (m ancho, 2H), 2,12-2,18 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,92 (sa, 1H), 3,30 (sa, 1H), 3,33 (m, 1H), 3,97 (sa, 1H), 4,24 (s, 2H), 4,41 (sa, 1H), 5,04 (sa, 2H), 6,36 (s, 1H), 7,00-7,07 (m, 2H), 7,36-7,42 (m, 2H), 8,11 (s, 1H).

EM (ESI): 527 ([M+H]⁺)

2-(1-[[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbotioato de S-ciclohexilo (I-76)

Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 200 mg) con ciclohexanotiol (64,0 mg) de forma análoga al ejemplo I-227. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbotioato de S-(ciclohexilo) (110 mg, 44%).

logP (pH 2,7): 4,51

¹H-RMN (CD₃CN, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,30-1,40 (m, 2H), 1,42-1,90 (m, 10H), 2,12-2,19 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,91 (sa, 1H), 3,30 (sa, 1H), 3,34 (m, 1H), 3,65 (m, 1H), 3,95 (sa, 1H), 4,44 (sa, 1H), 5,04 (sa, 2H), 6,36 (s, 1H), 8,05 (s, 1H).

EM (ESI): 501 ([M+H]⁺)

2-(1-[[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbotioato de S-1-naftilo (I-77)

Se hace reaccionar una solución de ácido 2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxílico (III-4, 200 mg) con naftaleno-1-tiol (88,0 mg) de forma análoga al ejemplo I-227. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-

pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de S-1-naftilo (100 mg, 37%).

logP (pH 2,7): 4,22

¹H-RMN (CD₃CN, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,74-1,90 (m, 2H), 2,20-2,26 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,93 (sa, 1H), 3,34 (sa, 1H), 3,42 (m, 1H), 4,04 (sa, 1H), 4,48 (sa, 1H), 5,07 (sa, 2H), 6,37 (s, 1H), 7,54-7,60 (m, 3H), 7,80 (dd, 1H), 7,98 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H), 8,13 (s, 1H), 8,20 (dd, 1H).

EM (ESI): 545 ([M+H]⁺)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (VIII):

10 **Ácido 2-[1-(terc-butoxicarbonil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxílico (VIII-1)**

A una solución de 4-[4-(etoxicarbonil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (24,0 g) en tetrahidrofurano (240 ml) y agua (60 ml) se añade a temperatura ambiente hidróxido de litio monohidrato (8,88 g) en una sola porción. La mezcla se agita durante 4 horas y después se mezcla con ácido clorhídrico diluido (1 M) (100 ml) y acetato de etilo (100 ml). La fase acuosa se separa y se extrae con acetato de etilo, y después se secan las fases orgánicas reunidas con sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el disolvente se elimina por destilación. Se obtiene ácido 2-[1-(terc-butoxicarbonil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxílico (21 g, 94%).

logP (pH 2,7): 2,04

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,41 (s, 9H), 1,59 (cd, 2H), 2,02 (dd, 2H), 2,91 (m, 2H), 3,23 (m, 1H), 3,97-4,02 (m, 2H), 8,27 (s, 1H).

EM (ESI): 256 ([M+H-C(CH₃)₃]⁺)

25 **Preparación de las sustancias de partida de fórmula (IX):**

4-{4-[(Ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (IX-1)

A una solución de ácido 2-[1-(terc-butoxicarbonil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxílico (VIII-1, 2,90 g) en diclorometano (30 ml) se añade a
5 temperatura ambiente ciclohexanol (1,21 g), dimetilaminopiridina (113 mg) y 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (1,87 g). La mezcla se agita durante la noche a temperatura ambiente y después se le añade agua. La fase acuosa se separa y se extrae con acetato de etilo, y después se secan las fases orgánicas reunidas con sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el
10 disolvente se elimina por destilación. El residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 4-{4-[(ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (2,63 g, 72%).

logP (pH 2,7): 4,62

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,13-1,81 (m + s, 21H), 2,02 (m, 2H), 2,90
15 (m, 2H), 3,40 (m, 1H), 3,98-4,01 (m, 2H), 4,90 (m, 1H), 8,32 (s, 1H).

EM (ESI): 339 ([M+2H-C(CH₃)₃]⁺)

4-{4-[(1-Naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (IX-2)

Se hace reaccionar una solución de ácido 2-[1-(terc-butoxicarbonil)-
20 piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxílico (VIII-1, 12,0 g) con 1-naftol (7,20 g) de forma análoga al ejemplo IX-1. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (12,3 g, 73%).

logP (pH 2,7): 4,50

25 ¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,42 (s, 9H), 1,67 (cd, 2H), 2,10 (dd, 2H),

2,95 (m, 2H), 3,35 (m, 1H), 4,00-4,08 (m, 2H), 7,45 (dd, 1H), 7,55-7,62 (m, 3H), 7,89 (d, 2H), 8,01 (dd, 1H), 8,83 (s, 1H).

EM (ESI): 383 ($[M+2H-C(CH_3)_3]^+$)

Preparación de las sustancias de partida de fórmula (X):

5 Cloruro de 4-{4-[(ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (X-1)

A una solución de 4-{4-[(ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (IX-1, 2,63 g) en dioxano (20 ml) se añade gota a gota a 0°C y bajo argón una solución de cloruro de hidrógeno 2 molar en éter dietílico (50 ml). La mezcla de reacción se agita a 0°C y después se calienta
10 lentamente a temperatura ambiente. Tras agitar durante la noche se eliminan el disolvente y el exceso de cloruro de hidrógeno. Se obtiene cloruro de 4-{4-[(ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (2,19 g, 99%).

logP (pH 2,7): 1,25

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,15-1,55 (m, 6H), 1,71-1,75 (m, 2H),
15 1,85-1,90 (m, 2H), 1,98-2,04 (m, 2H), 2,20 (dd, 2H), 3,01-3,03 (m, 2H), 3,14-3,34 (m, 2H), 3,40 (m, 1H), 4,90 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 9,05 (sa, 1H), 9,25 (sa, 1H).

EM (ESI): 295 ($[M-Cl]^+$)

Cloruro de 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (X-2)

20 Se hace reaccionar 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de terc-butilo (IX-2, 3,20 g) de forma análoga al ejemplo X-1. Después del secado se obtiene cloruro de 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (2,93 g, 100%).

logP (pH 2,7): 1,42

25 ¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm} : 2,02-2,15 (m, 2H), 2,25-2,34 (m, 2H),

3,00-3,12 (m, 2H), 3,34-3,40 (m, 2H), 3,51 (m, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,53-7,62 (m, 3H), 7,89 (d, 2H), 8,00-8,05 (m, 1H), 8,87 (s, 1H), 9,05 (sa, 1H), 9,25 (sa, 1H).

EM (ESI): 339 ([M-Cl]⁺)

Preparación de los compuestos de fórmula (I):

5 2-(1-{{[3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (I-772)

Se disuelven ácido [3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (288 mg) y la base de Hünig (323 mg) en diclorometano (10 ml) y se agitan durante 30 min a temperatura ambiente. Se añade cloruro de 4-{4-
10 [(ciclohexiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (X-1, 330 mg) y la mezcla se agita otros 5 min antes de añadir hexafluorofosfato de bromo-tris-pirrolidinofosfonio (559 mg). La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente. Tras eliminar el disolvente a presión reducida se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 2-(1-{{[3,5-bis(trifluorometil)-
15 1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (348 mg, 65%).

logP (pH 2,7): 4,39

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,20-1,60 (m, 8H), 1,71-1,75 (m, 2H), 1,85-1,88 (m, 2H), 2,04 (m, 2H), 2,90 (sa, 1H), 3,30 (sa, 1H), 3,38 (m, 1H), 3,95
20 (sa, 1H), 4,30 (sa, 1H), 4,91 (m, 1H), 5,48 (sa, 2H), 7,47 (s, 1H), 8,34 (s, 1H).

EM (ESI): 539 ([M+H]⁺)

2-(1-{{[3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (I-771)

Se hace reaccionar cloruro de 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-
25 il}piperidinio (X-2, 375 mg) con ácido [3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

il]acético (288 mg) de forma análoga al ejemplo I-772. Tras la purificación cromatográfica se obtiene 2-(1-{{3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (356 mg, 61%).

logP (pH 2,7): 4,35

- 5 ¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,65 (m, 1H), 1,90 (m, 1H), 2,19 (m, 2H), 2,95 (m, 1H), 3,32 (m, 1H), 3,48 (m, 1H), 4,01 (m, 1H), 4,35 (m, 1H), 5,50 (m, 2H), 7,45 (m, 2H), 7,56-7,61 (m, 3H), 7,89 (m, 2H), 8,02 (m, 1H), 8,84 (s, 1H).

EM (ESI): 583 ([M+H]⁺)

10 **2-(1-{{3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (I-813)**

- A una solución de ácido [3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (10,8 g) en diclorometano (150 ml) se añaden cloruro de oxalilo (6,78 g) y una gota de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente y después se elimina el exceso de cloruro de oxalilo a presión reducida. El residuo se vuelve a disolver en diclorometano (50 ml) y se añade a 0°C a una solución de cloruro de 4-{4-[(1-naftiloxi)carbonil]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (X-2, 7,25 g) y base de Hünig (10,4 g) en diclorometano (100 ml). La mezcla de reacción se agita durante la noche a temperatura ambiente. Tras añadir una solución concentrada de cloruro de amonio se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan mediante sulfato sódico. El sólido se recoge por filtración y el disolvente se elimina por destilación. El residuo se purifica por cromatografía. Se obtiene 2-(1-{{3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de 1-naftilo (11,3 g, 64%).

- 25 logP (pH 2,7): 3,64

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,70 (sa, 1H), 1,87 (sa, 1H), 2,18 (m, 2H), 2,91 (sa, 1H), 3,31 (sa, 1H), 3,48 (m, 1H), 4,03 (sa, 1H), 4,36 (sa, 1H), 5,36 (s, 2H), 6,85 (s, 1H), 6,97 (t, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,54-7,61 (m, 3H), 7,89 (m, 2H), 8,01 (m, 1H), 8,84 (s, 1H).

5 EM (ESI): 547 ([M+H]⁺)

2-(1-{2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanotionil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (I-854)

A una solución de 2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}-piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (I-811, 200 mg) en 1,2-dimetoxietano (1 ml) y cloroformo (0,4 ml) se añade a temperatura ambiente
 10 2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano (88 mg). La mezcla de reacción se agita durante la noche entre 70 y 80°C. Tras eliminar el disolvente a presión reducida se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 2-(1-{2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanotionil}piperidin-4-il)-
 15 1,3-tiazol-4-carboxilato de ciclohexilo (80 mg, 39%).

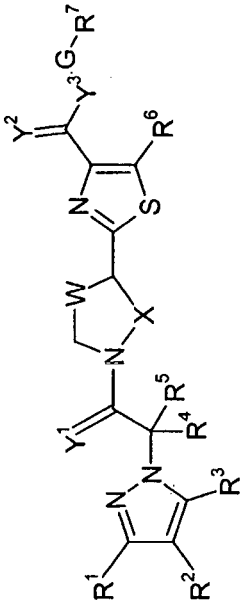
logP (pH 2,7): 4,23

¹H-RMN (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,30-1,58 (m, 6H), 1,75-1,92 (m, 4H), 2,10-2,30 (m, 4H), 3,32 (m, 1H), 3,50 (m, 2H), 4,39 (m, 1H), 4,93 (m, 1H), 5,39 (s, 2H), 5,42 (m, 1H), 6,79 (t, 1H), 6,83 (s, 1H), 7,01 (t, 1H), 8,16 (s, 1H).

20 EM (ESI): 519 ([M+H]⁺)

Ejemplos

La tabla 1 muestra los compuestos de fórmula (I) para los cuales se reivindica el uso como fungicidas.



(I)

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
1	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	
2	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
3	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	3,40*
4	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
5	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
6	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	4,01**
7	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
8	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	3,76*
9	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
10	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	3,84*
11	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	morfolin-4-ilo	
12	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,35*
13	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	piperidin-1-ilo	
14	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	pirrolidin-1-ilo	
15	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	3,37*
16	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-metilpiperazin-1-ilo	
17	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	3,73*
18	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	4,21*
19	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	3,30*
20	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	3,69*
21	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	4,24*
22	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	3,94*
23	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	3,70*
24	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	3,72*
25	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	3,81*
26	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	3,68*
27	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	4,00*
28	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	3,22*
29	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	4,57*
30	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
31	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	3,62*
32	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	

EJ.N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
33	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
34	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
35	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
36	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
37	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
38	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
39	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
40	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
41	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,60*
42	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,89*
43	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,55*
44	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	3,20*
45	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	3,26*
46	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
47	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CF ₃)-	fenilo	
48	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
49	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
50	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
51	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
52	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
53	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
54	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
55	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	

EJ.Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
56	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
57	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
58	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
59	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
60	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
61	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
62	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
63	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
64	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
65	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
66	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
67	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
68	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
69	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
70	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
71	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
72	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
73	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
74	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
75	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
76	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	ciclohexilo	4,51*
77	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	1-naftilo	4,22*
78	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
79	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
80	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-2-ilo	2,21*
81	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	3,22*
82	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
83	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
84	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilisilo	3,53*
85	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,42*
86	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	
87	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
88	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
89	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	3,68*
90	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
91	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	3,37*
92	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	3,42*
93	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
94	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	2,99*
95	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,04*
96	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
97	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
98	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
99	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
100	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	

EJ.Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
101	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
102	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
103	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
104	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
105	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
106	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
107	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
108	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
109	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
110	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
111	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
112	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
113	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metoxifenilo	
114	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
115	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
116	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
117	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
118	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
119	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
120	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
121	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
122	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
123	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	

EJ.N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
124	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,18*
125	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₂)-	4-fluorofenilo	
126	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,27*
127	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	2,85*
128	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	2,89*
129	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
130	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
131	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
132	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
133	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
134	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
135	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
136	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
137	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
138	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
139	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
140	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
141	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
142	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	1,32*
143	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	2,85*
144	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	4,28*
145	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	4,17*
146	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	3,84*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
147	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
148	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
149	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	4,40*
150	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	5,44*
151	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	4,17*
152	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	4,17*
153	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	4,17*
154	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	3,73*
155	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,73
156	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
157	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
158	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
159	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
160	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
161	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
162	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
163	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
164	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
165	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
166	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
167	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
168	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
169	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
170	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
171	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
172	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
173	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
174	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
175	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
176	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
177	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
178	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
179	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
180	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
181	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
182	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
183	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
184	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,89*
185	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
186	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,94*
187	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	3,58*
188	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	3,63*
189	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
190	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
191	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	

EJ.Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
192	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
193	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
194	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
195	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
196	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
197	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
198	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
199	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
200	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
201	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
202	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
203	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
204	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
205	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
206	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
207	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
208	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
209	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
210	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
211	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
212	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
213	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
214	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
215	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
216	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
217	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	1,82*
218	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	3,58*
219	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	3,89*
220	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,74*
221	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	3,47*
222	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
223	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
224	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	4,01*
225	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	5,08*
226	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	3,78*
227	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	3,75*
228	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	3,84*
229	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	3,37*
230	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,37*
231	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
232	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
233	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
234	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
235	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
236	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	

EJ.N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
237	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
238	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
239	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
240	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
241	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
242	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
243	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
244	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
245	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
246	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
247	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
248	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
249	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
250	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
251	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
252	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
253	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
254	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
255	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
256	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
257	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
258	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
259	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,53*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
260	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
261	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,63*
262	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	3,18*
263	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	3,27*
264	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
265	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
266	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
267	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
268	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
269	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
270	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
271	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
272	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
273	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
274	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
275	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
276	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
277	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
278	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
279	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
280	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
281	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
282	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
283	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
284	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
285	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
286	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
287	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
288	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
289	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
290	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
291	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
292	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	1,51*
293	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	3,23*
294	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsilo	
295	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
296	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	
297	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
298	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
299	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
300	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
301	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
302	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
303	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
304	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
305	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
306	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
307	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
308	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
309	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
310	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
311	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
312	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
313	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
314	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
315	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
316	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
317	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
318	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
319	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
320	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
321	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
322	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
323	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
324	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
325	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
326	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
327	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
328	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
329	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
330	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
331	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
332	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
333	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
334	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	
335	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
336	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	
337	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	
338	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	
339	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
340	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
341	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
342	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
343	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
344	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
345	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
346	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
347	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
348	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
349	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
350	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
351	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
352	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
353	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
354	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
355	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
356	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
357	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
358	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
359	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
360	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
361	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
362	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
363	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
364	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
365	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	
366	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
367	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
368	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	4,04*
369	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	3,84*
370	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,78*
371	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
372	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	3,86*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
373	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
374	CH ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	
375	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
376	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	3,68*
377	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	3,82*
378	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	3,73*
379	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	3,19*
380	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,35*
381	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
382	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
383	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
384	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
385	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
386	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
387	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
388	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
389	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
390	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
391	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
392	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
393	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
394	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
395	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
396	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
397	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
398	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
399	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
400	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
401	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
402	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
403	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	3,47*
404	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
405	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	3,42*
406	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
407	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
408	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
409	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
410	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
411	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
412	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	3,06*
413	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	3,21*
414	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
415	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
416	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
417	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
418	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
419	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
420	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
421	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
422	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
423	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
424	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
425	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-terc-butilfenilo	
426	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
427	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
428	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
429	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
430	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
431	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
432	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
433	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
434	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
435	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
436	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
437	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
438	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
439	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
440	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
441	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	

148

EJ.Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
442	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	1,33*
443	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	3,06*
444	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	trimetilisilo	
445	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	ciclohexilo	
446	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	ciclopentilo	
447	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
448	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
449	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
450	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
451	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
452	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	1-naftilo	
453	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2-naftilo	
454	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	fenilo	
455	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
456	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
457	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
458	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
459	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
460	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
461	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
462	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
463	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	

149

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
464	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
465	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
466	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
467	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
468	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
469	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
470	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
471	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
472	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
473	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
474	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
475	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
476	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
477	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
478	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
479	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
480	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
481	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
482	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
483	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
484	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	
485	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
486	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	

150

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
487	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	fenilo	
488	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	4-fluorofenilo	
489	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	4-clorofenilo	
490	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	4-metilfenilo	
491	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	3-clorofenilo	
492	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
493	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
494	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
495	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2-clorofenilo	
496	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
497	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
498	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	3-metilfenilo	
499	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	2-metilfenilo	
500	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
501	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
502	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	fenilo	
503	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
504	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	4-clorofenilo	
505	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	4-metilfenilo	
506	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	3-clorofenilo	
507	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
508	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
509	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	

151

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
510	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	2-clorofenilo	
511	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
512	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
513	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	3-metilfenilo	
514	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	2-metilfenilo	
515	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
516	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
517	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
518	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	
519	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	ciclohexilo	
520	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	CH ₃	O	S	enlace	1-naftilo	
521	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	
522	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
523	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	
524	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
525	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
526	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
527	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
528	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
529	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
530	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
531	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	

EJ.Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
532	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
533	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
534	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
535	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
536	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
537	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
538	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
539	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
540	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
541	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
542	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
543	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
544	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
545	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
546	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
547	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
548	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
549	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
550	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
551	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
552	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
553	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
554	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
555	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
556	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
557	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
558	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
559	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
560	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
561	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	
562	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
563	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	
564	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	
565	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	
566	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
567	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
568	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
569	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
570	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
571	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
572	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
573	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
574	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
575	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
576	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
577	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	

154

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
578	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
579	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
580	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
581	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
582	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
583	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
584	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
585	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
586	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
587	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
588	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
589	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
590	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
591	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
592	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
593	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
594	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
595	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	
596	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	ciclohexilo	
597	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	enlace	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	O	S	enlace	1-naftilo	
598	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilsililo	
599	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
600	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	

155

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
601	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
602	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
603	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
604	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
605	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
606	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
607	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
608	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	
609	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
610	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
611	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
612	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
613	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
614	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
615	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
616	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
617	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
618	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
619	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
620	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
621	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
622	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
623	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
624	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
625	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
626	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
627	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
628	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
629	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
630	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
631	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
632	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
633	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
634	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
635	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
636	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
637	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
638	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	
639	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
640	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	4-fluorofenilo	
641	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	
642	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	
643	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
644	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	
645	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
646	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
647	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
648	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
649	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
650	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
651	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
652	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
653	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
654	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	
655	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
656	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
657	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
658	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
659	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
660	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
661	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
662	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
663	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
664	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	
665	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
666	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
667	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
668	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
669	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
670	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
671	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
672	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	
673	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	ciclohexilo	
674	CF ₃	H	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	1-naftilo	
675	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	trimetilisilo	
676	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
677	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopentilo	
678	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclopropilo	
679	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,2-diclorociclopropilo	
680	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
681	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	

15a

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
682	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
683	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
684	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
685	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	
686	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	
687	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
688	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
689	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
690	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
691	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
692	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
693	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
694	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
695	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
696	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3-metilfenilo	
697	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
698	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
699	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
700	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	fenilo	
701	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-fluorofenilo	

EJ. Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
702	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-clorofenilo	
703	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metilfenilo	
704	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-metoxifenilo	
705	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,4-diclorofenilo	
706	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3,5-diclorofenilo	
707	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2,6-diclorofenilo	
708	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-clorofenilo	
709	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-clorofenilo	
710	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-(trifluorometil)fenilo	
711	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	3-metilfenilo	

EJ. Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
712	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	2-metilfenilo	
713	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-nitrofenilo	
714	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	-CH ₂ -	4-terc-butilfenilo	
715	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	4-fluorofenilo	
716	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-	4-fluorofenilo	
717	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	CH(CH ₂ CH ₃)-	4-fluorofenilo	
718	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	fenilo	
719	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fluorofenilo	
720	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-clorofenilo	
721	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-metilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
722	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-clorofenilo	
723	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,5-diclorofenilo	
724	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3,4-diclorofenilo	
725	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,4-diclorofenilo	
726	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-clorofenilo	
727	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-diclorofenilo	
728	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
729	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metilfenilo	
730	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilfenilo	
731	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilfenilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
732	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-nitrofenilo	
733	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	fenilo	
734	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-fluorofenilo	
735	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-clorofenilo	
736	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-metilfenilo	
737	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-clorofenilo	
738	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,5-diclorofenilo	
739	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3,4-diclorofenilo	
740	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,4-diclorofenilo	
741	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-clorofenilo	

EJ. Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
742	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2,6-diclorofenilo	
743	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-(trifluorometil)fenilo	
744	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	3-metilfenilo	
745	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	2-metilfenilo	
746	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-terc-butilfenilo	
747	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	4-nitrofenilo	
748	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-4-ilo	
749	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-tienilo	
750	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	ciclohexilo	
751	(1Z,3Z)-buta-1,3-dien-1,4-diilo		CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	S	enlace	1-naftilo	

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
752	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
753	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
754	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
755	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
756	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
757	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
758	CF ₃	H	CH ₃		-CH ₂ CH ₂ -	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	
759	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	
760	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
761	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	decahidronaftalen-1-ilo	
762	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo	
763	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
764	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-naftilo	
765	CF ₃	H	CH ₃	H	ciclopropilo	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	fenilo	
766	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	terc-butilo	
767	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	terc-butilo	3,82*
768	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	terc-butilo	
769	CF ₃	cloro	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	4,58*
770	CF ₃	cloro	CH ₃	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	4,50*
771	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	4,35*
772	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	4,39*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
773	CF ₃	H	H	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	3,87*
774	CF ₃	H	H	H	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,88*
775	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	3,4-diclorofenilo	4,09*
776	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-(trifluorometil)fenilo	3,86*
777	CF ₃	H	fenilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	4,50*
778	CF ₃	H	etilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
779	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	(E)-2-feniletlenilo	3,74*
780	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	piridin-3-ilo	1,74*
781	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	quinolin-7-ilo	2,42*
782	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	quinolin-8-ilo	2,88*
783	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	1-naftilo	3,90*
784	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-naftilo	3,92*
785	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	1-naftilo	4,16*
786	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	2-naftilo	4,18*
787	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	feniletlenilo	3,70*
788	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	cicloheptilo	4,09*
789	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo	3,94*
790	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo	4,21*
791	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo	3,67*
792	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo	4,30*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
793	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	quinolin-6-ilo	2,37*
794	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	isoquinolin-5-ilo	2,18*
795	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	(1R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	4,06*
796	CH ₃	H	difluoro- metilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,28*
797	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	5-metil-2-(propan-2-il) ciclohexilo	5,51*
798	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-etinilciclopentilo	3,28*
799	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₂ CH ₃)-	(1Z)-prop-1-en-1-ilo	3,78*
800	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	(1S,2R)-1,7,7-trimetil- biciclo[2.2.1]hept-2-ilo	5,08*
801	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	hex-1-en-3-ilo	3,78*
802	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-metil-5-(propan-2-il) ciclohexilo	5,58*
803	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ CH ₂ -	dimetilamino	1,03*
804	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-etinilciclohexilo	3,73*
805	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH(CH ₃)-	CF ₃	3,19*
806	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	heptan-3-ilo	5,08*
807	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	quinolin-5-ilo	2,59*
808	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	difenilmetilo	4,17*
809	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,3-benzoxazol-4-ilo	2,81*
810	etilo	H	etilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	

168

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
811	difluoro- metilo	H	difluoro- metilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	3,64*
812	etilo	H	etilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
813	difluoro- metilo	H	difluoro- metilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	3,64*
814	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metoxifenilo	3,17*
815	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclopropil(fenil)metilo	3,87*
816	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-dimetoxifenilo	3,12*
817	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-metoxifenilo	3,44*
818	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4,6-triclorofenilo	4,53*
819	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	4-(trifluorometoxi)fenilo	3,99*
820	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-bromofenilo	3,80*
821	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	bifenil-2-ilo	3,96*
822	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	bifenil-3-ilo	4,16*
823	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	bifenil-4-ilo	4,17*
824	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	3-fenoxifenilo	4,18*
825	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-fenoxifenilo	4,14*
826	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-etinilciclohexilo	3,76*
827	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-cianociclohexilo	3,33*
828	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	4-terc-butilciclohexilo	5,19*
829	CF ₃	H	CH ₃	H	H		-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	5-metil-2-(propan-2-il) ciclohexilo	5,22*

EJ. N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ¹	X	W	R ⁶	Y ²	Y ³	G	R ⁷	log p
830	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1,4-dioxaspiro[4.5]dec-8-ilo	2,90*
831	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2,6-dimetilciclohexilo	4,40*
832	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	2-metilciclohexilo	4,12*
833	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	octilo	5,02*
834	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4-dimetoxifenilo	3,33*
835	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2,4,6-trifluorofenilo	3,53*
836	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-(trifluorometil)fenilo	3,84*
837	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-(trifluorometoxi)fenilo	3,95*
838	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
839	H	CF ₃	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
840	CF ₃	H	H	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
841	CF ₃	cloro	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
842	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
843	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	CH ₃	
844	CH ₃	H	difluoro- metilo	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	1-naftilo	
845	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-[1-metoxi-2-(metilamino)-2-oxoetil]fenilo	
846	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	2-[(metilamino)(oxo)acetil] fenilo	
847	tBu	H	CF ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	4,75*

170

EJ. N°	R1	R2	R3	R4	R5	Y1	X	W	R6	Y2	Y3	G	R7	log p
848	CF ₃	H	tBu	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	
849	tBu	H	CF ₂ CF ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	
850	CF ₂ CF ₃	H	tBu	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	
851	iPr	H	CF ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	
852	etilo	H	CF ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	-CH ₂ -	ciclohexilo	
853	CF ₃	H	CH ₃	H	H	O	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	(1S)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilo	
854	difluoro- metilo	H	difluoro- metilo	H	H	S	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ -	H	O	O	enlace	ciclohexilo	

La medición de los valores log P se llevó a cabo conforme a la Directriz de la CEE 79/831, anexo V.A8, mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en fase inversa.

** La determinación se lleva a cabo en el intervalo ácido a pH 2,3, con ácido fosfórico acuoso al 0,1% y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo.

* La determinación se lleva a cabo por CL-EM en el intervalo ácido a pH 2,7, con ácido fórmico acuoso al 0,1% y acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo.

*** La determinación se lleva a cabo por CL-EM en el intervalo neutro a pH 7,8, con una solución acuosa de hidrogenocarbonato de amonio 0,001 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo.

10 El calibrado se realiza con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores log P son conocidos (determinación de los valores logP a partir de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas). Los valores lambda-max se hallaron mediante espectros UV de 200 nm a 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo de *Phytophthora* (tomate) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona

5 24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico

Para la elaboración de una preparación conveniente de principios activos se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a
10 la concentración deseada.

Para examinar la eficacia protectora se rocían plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principios activos. Cuando la capa de pulverización comience a secarse se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Phytophthora infestans*. A
15 continuación, las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad relativa del aire del 100%.

La evaluación se lleva a cabo 3 días después de la inoculación. Una eficacia del 0% equivale a la del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa infestación.

20 En este ensayo, los compuestos de acuerdo con la invención con las fórmulas siguientes muestran una eficacia del 70% o superior a una concentración de principio activo de 100 ppm.

Ej. nº: 44, 45, 8, 10, 766, 772, 771, 774, 773, 18, 20, 19, 775, 17, 23, 24, 776, 29, 21, 26, 28, 15, 31, 25, 778, 81, 3, 779, 781, 782, 783, 784, 785, 788,
25 790, 789, 791, 792, 795, 794, 796, 811, 813.

Ejemplo B

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida

5 Emulsionante: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico

Para la elaboración de una preparación conveniente de principios activos se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

10 Para examinar la eficacia protectora se rocían plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principios activos. Cuando la capa de pulverización comience a secarse se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola* y después se mantienen durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente
15 20°C y una humedad relativa del aire del 100%. A continuación, las plantas se colocan durante 4 días en el invernadero a aproximadamente 21°C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 90%. Después, las plantas se humedecen y se colocan durante 1 día en una cabina de incubación.

La evaluación se lleva a cabo 6 días después de la inoculación. Una
20 eficacia del 0% equivale a la del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa infestación.

En este ensayo, los compuestos de acuerdo con la invención con las fórmulas siguientes muestran una eficacia del 70% o superior a una concentración de principio activo de 100 ppm.

25 Ej. nº: 44, 45, 8, 10, 766, 772, 771, 774, 773, 18, 20, 19, 775, 17, 23, 24,

776, 21, 26, 28, 15, 31, 25, 778, 81, 3, 779, 781, 782, 783, 784, 785, 788, 790, 789, 791, 792, 795, 794, 796, 811, 813.

Ejemplo C

Ensayo de *Phytophthora* (tomate) / protector

- 5
- Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida
- Emulsionante: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico

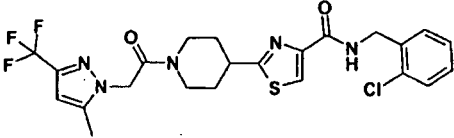
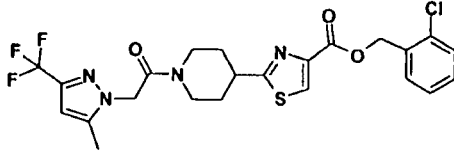
Para la elaboración de una preparación conveniente de principios activos se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para examinar la eficacia protectora se rocían plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principios activos. Cuando comience a secarse la capa de pulverización se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Phytophthora infestans*. A continuación, las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad relativa del aire del 100%.

La evaluación se lleva a cabo 3 días después de la inoculación. Una eficacia del 0% equivale a la del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa infestación.

Tabla

Ensayo de *Phytophthora* (tomate) / protector

Principio activo conocido por el documento WO 2007014290	Cantidad de aplicación de principio activo en ppm	Eficacia en %
	10	65
de acuerdo con la invención:		
ej. 23 	10	94

Ejemplo D

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / protector

- Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
- 5 24,5 partes en peso de dimetilacetamida
- Emulsionante: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico

Para la elaboración de una preparación conveniente de principios activos se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

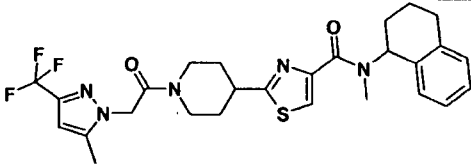
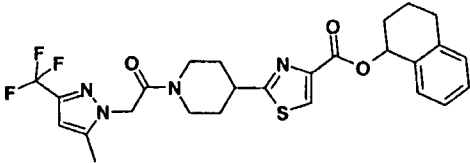
Para examinar la eficacia protectora se rocían plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principios activos. Cuando la capa de pulverización comience a secarse se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola* y después se

mantienen durante 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad relativa del aire del 100%. A continuación, las plantas se colocan durante 4 días en el invernadero a aproximadamente 21°C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 90%. Después, las plantas se humedecen y se colocan durante 1 día en una cabina de incubación.

La evaluación se lleva a cabo 6 días después de la inoculación. Una eficacia del 0% equivale a la del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa infestación.

Tabla

10 Ensayo de *Plasmopara* (vid) / protector

Principio activo conocido por el documento WO 2007014290	Cantidad de aplicación de principio activo en ppm	Eficacia en %
	1	72
de acuerdo con la invención:		
ej. 6 	1	91

Ejemplo E

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / curativo

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona

24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de éter alquilarilpoliglicólico

Para la elaboración de una preparación conveniente de principios activos se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

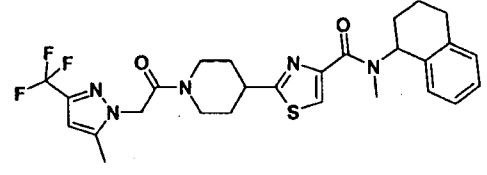
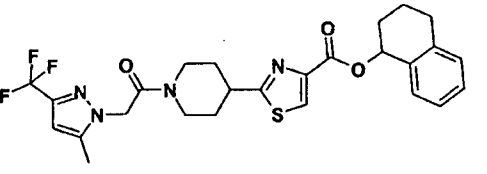
Para examinar la eficacia curativa se inoculan plantas jóvenes con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola*. Las plantas se mantienen durante 24 horas en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad relativa del aire del 100%, y después de otras 24 horas a aproximadamente 21°C y una humedad relativa del aire de aproximadamente 90%, las plantas se rocían con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principios activos. 5 días después de la inoculación las plantas se humedecen y se colocan durante 1 día en una cabina de incubación.

La evaluación se lleva a cabo 6 días después de la inoculación. Una eficacia del 0% equivale a la del control, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa infestación.

Tabla

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / curativo

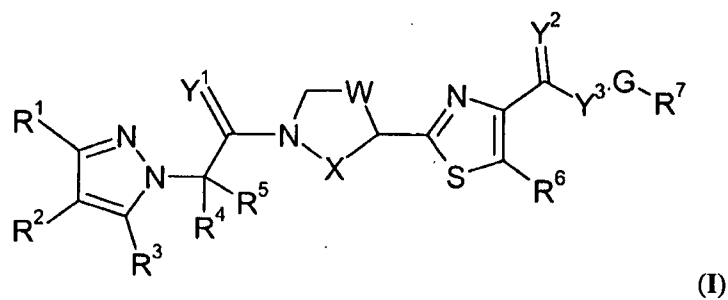
Principio activo conocido por el documento WO 2007014290	Cantidad de aplicación de principio activo en ppm	Eficacia en %
--	---	------------------

	100	37
de acuerdo con la invención:		
ej. 6 	100	84

Habiendo descrito la invención como antecede se declara como propiedad los contenido en las siguientes

REIVINDICACIONES

5 1. Compuestos de fórmula (I)



en la que los símbolos poseen los significados siguientes:

- R¹ y R³ son independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, halógeno, hidroxilo, ciano o fenilo,
- 10 R² es H, fenilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, formilo, CR⁸=NOR⁹, halógeno, hidroxilo, ciano o NR¹⁰R¹¹,
- o
- 15 R¹ y R² o R² y R³ forman, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, un anillo de 5 a 7 miembros sustituido o no sustituido, parcialmente saturado o insaturado, que puede contener hasta dos heteroátomos adicionales seleccionados entre N, O y S, sin que se encuentren adyacentes dos átomos de oxígeno,
- 20 seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente entre alquilo

- C₁-C₄, hidroxí, oxo o halógeno,
- R⁴ y R⁵ son independientemente H, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄,
- o
- 5 R⁴ y R⁵ forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado de 3 a 6 miembros que puede contener hasta dos heteroátomos seleccionados entre N y O, sin que se encuentren adyacentes dos átomos de oxígeno,
- Y¹, Y² representan oxígeno,
- 10 Y³ representa azufre u oxígeno,
- X representa un enlace directo o una cadena carbonada C₁ a C₃ sustituida o no sustituida, en la que los átomos de carbono llevan como sustituyentes independientemente H, metilo u oxo,
- W representa una cadena carbonada C₁ a C₃ sustituida o no sustituida, en
- 15 la que los átomos de carbono llevan como sustituyentes independientemente H, metilo u oxo,
- R⁶ representa H, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, CONR¹⁰R¹¹, (alcoxi-C₁-C₄)carbonilo, COOH, NR¹⁰R¹¹, halógeno o ciano,
- G es (C(R¹²)₂)_m,
- 20 con m = 0 a 6,
- R⁷ representa alquilo C₅-C₁₀, alqueno C₂-C₁₆, alquino C₂-C₁₆, cicloalquilo C₃-C₁₅, cicloalqueno C₅-C₁₅, heterociclilo C₃-C₁₅, arilo, heterilo o Si(alquilo-C₁-C₄)₃ sustituido o no sustituido,
- seleccionándose los sustituyentes posibles independientemente de la lista
- 25 siguiente:

halógeno, ciano, nitro, nitroso, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, arilalquilo C₁-C₃, arilhaloalquilo C₁-C₃, hidroxilo, oxo, alcoxi C₁-C₄, O(alquil-C₁-C₆)_mO-alquilo C₁-C₆, O-cicloalquilo C₃-C₆, O-fenilo, haloalcoxi C₁-C₄, SH, tioalquilo C₁-C₄, tiohaloalquilo C₁-C₄, S-fenilo, SO₂-alquilo C₁-C₆, SO₂-haloalquilo C₁-C₆, SO-alquilo C₁-C₆, SO-haloalquilo C₁-C₆, CO₂H, (alquil-C₁-C₄)carbonilo, (haloalquil-C₁-C₄)carbonilo, formilo, CR⁸=NOR⁹, CONR¹⁰R¹¹, (alcoxi-C₁-C₄)carbonilo, COOH, NR¹⁰R¹¹, ciclopropilamino, CH₂COCH₃, (CH₂)_mO-alquilo C₁-C₆, CH₂OH, CH₂SMe, (CH₂)₂SMe, cicloalquilo C₃-C₆, 1-metoxiciclopropilo, 1-clorociclopropilo, ciclohexilmetilo, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, Si(alquilo-C₁-C₄)₃, fenilo o bencilo,

o

dos sustituyentes adyacentes forman un anillo de dioxolano o de dioxano sustituido, dado el caso, con metilo o halógeno,

R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ son independientemente H, alquilo C₁-C₃ o ciclopropilo,

o

R¹⁰ y R¹¹ forman, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, un anillo saturado de 3 a 6 miembros que puede contener hasta un heteroátomo adicional seleccionado entre N u O,

R¹² es igual o diferente e independientemente H, cloro, flúor, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆ o trifluorometilo,

o

dos o cuatro R¹² en dos átomos de carbono adyacentes, respectivamente, representan enlaces directos,

así como sus sales con actividad agroquímica.

2. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en los que uno o varios de los símbolos poseen uno de los significados siguientes:

- 5 R^1 representa metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo o pentafluoroetilo,
- R^2 representa H o cloro,
- R^3 representa H, metilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, trifluorometilo, pentafluoroetilo o fenilo,
- R^4 representa H o metilo,
- 10 R^5 representa H o metilo,
- Y^1 representa oxígeno,
- Y^2 representa oxígeno,
- Y^3 representa azufre u oxígeno,
- X representa CH_2 o CH_2CH_2 ,
- 15 W representa CH_2 o CH_2CH_2 ,
- R^6 representa H,
- G representa un enlace directo, CH_2 , CH_2CH_2 , $CH(CH_3)$ o $CH_2(CH_2CH_3)$,
- R^7 representa heptan-3-ilo, octilo, (1Z)-prop-1-en-1-ilo, (E)-2-fenileténilo, hex-1-en-3-ilo, difenilmetilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, (1R)-1,2,3,4-
- 20 tetrahidronaftalen-1-ilo, (1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decahidronaftalen-1-ilo, 1,4-dioxaspiro [4.5]dec-8-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, ciclopropilo, ciclopentilo, 1-etilciclopentilo, ciclohexilo, 2-
- 25 metilciclohexilo, 2,6-dimetilciclohexilo, 4-terc-butilciclohexilo, 5-metil-2-

(propan-2-il)-ciclohexilo, 3-metil-5-(propan-2-il)ciclohexilo, 1-cianociclohexilo, 1-etinilciclohexilo, cicloheptilo, ciclopropil(fenil)metilo, (1S,2R)-1,7,7-trimetilbiciclo[2.2.1]hept-2-ilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,6-dimetoxifenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-nitrofenilo, 2-(trifluorometil)-fenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, 4-(trifluorometil)fenilo, 2-(trifluorometoxi)-fenilo, 4-(trifluorometoxi)fenilo, 4-terc-butilfenilo, bifenil-2-ilo, bifenil-3-ilo, bifenil-4-ilo, 3-fenoxifenilo, 4-fenoxifenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, feniletinilo, 2-tienilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-5-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, trifluorometilo, dimetilamino o trimetilsililo,

así como sus sales con actividad agroquímica.

15

3. Procedimiento para combatir hongos dañinos fitopatógenos, caracterizado porque se esparcen compuestos de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 sobre los hongos dañinos fitopatógenos y/o por su hábitat.

20

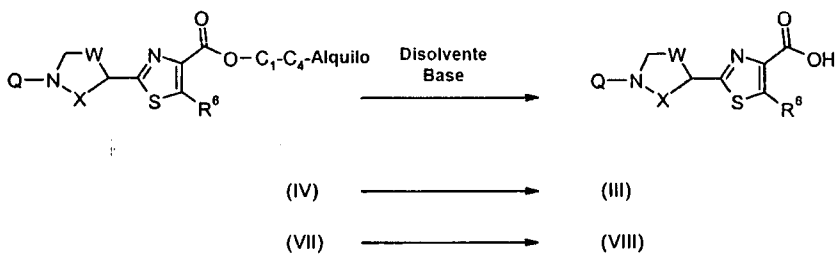
4. Agente para combatir hongos dañinos fitopatógenos, caracterizado por contener al menos un compuesto de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2, además de extensores y/o sustancias tensioactivas.

25

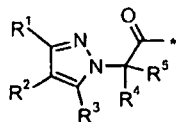
5. Uso de ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I)

según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2 para combatir hongos dañinos fitopatógenos.

6. Procedimiento para la preparación de los compuestos de fórmula (I),
- 5 que comprende al menos uno de los pasos c. a e. siguientes:
 - c. Reacción de compuestos de fórmula (IV) o (VII) para dar compuestos de fórmula (III) o (VIII) por saponificación, respectivamente, en presencia de una base y, dado el caso, en presencia de un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 3):



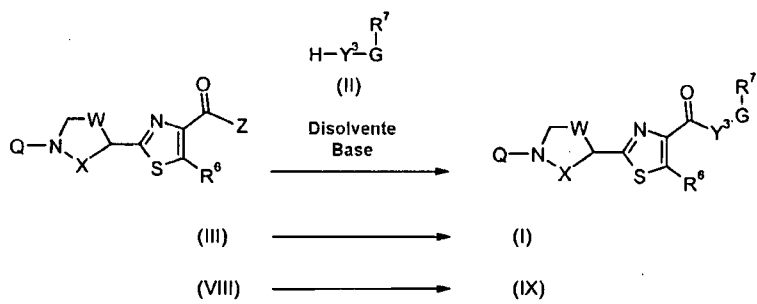
10 en el que



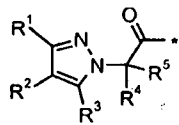
Q = para los compuestos de fórmula (IV) y (III),
 Q = acetilo, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, bencilo o benciloxycarbonilo (equivale a PG) para los compuestos de fórmula (VII) y (VIII),

- 15 W, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son como se han definido para la fórmula (I) según la reivindicación 1.
- (d) Reacción de compuestos de fórmula (III) o (VIII) con compuestos de fórmula (II) para dar compuestos de fórmula (I) o (IX), dado el caso en

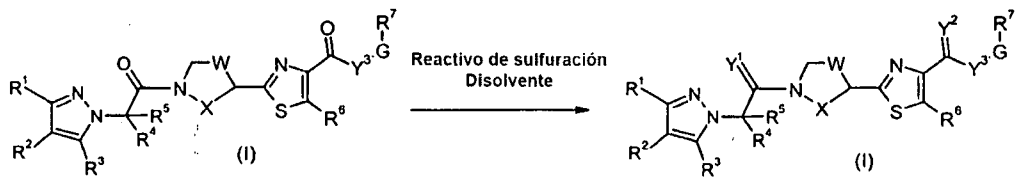
presencia de un reactivo de acoplamiento, una base y un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 4):



en el que



- 5 Q = para los compuestos de fórmula (III) y (I),
- Q = acetilo, alcoxi-C₁-C₄-carbonilo, bencilo o benciloxicarbonilo (equivale a PG) para los compuestos de fórmula (VIII) y (IX),
- Z = OH o cloro,
- W, X, Y³, G, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son como se han definido para la
- 10 fórmula (I) según la reivindicación 1.
- (e) Reacción de compuestos de fórmula (I) para dar compuestos de fórmula (I) en presencia de un reactivo de sulfuración y, dado el caso, en presencia de un disolvente, conforme al siguiente esquema de reacción (esquema 5):



en el que

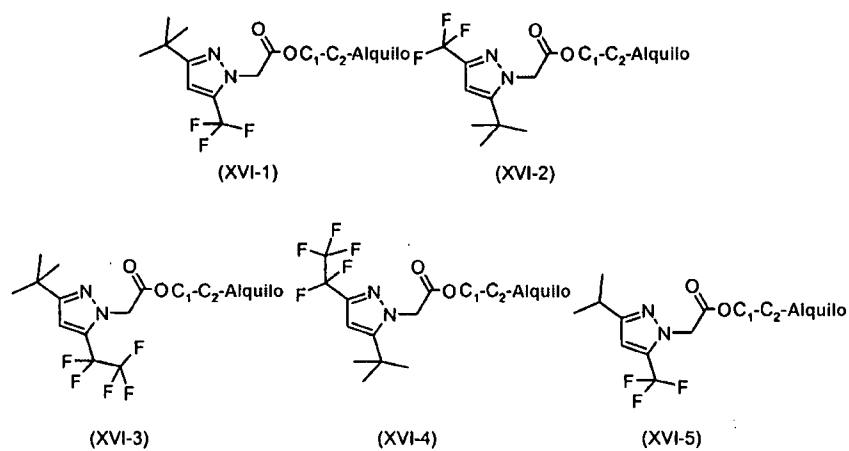
Y^1 = azufre u oxígeno,

Y^2 = azufre u oxígeno,

W, X, Y^3 , G, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son como se han definido para la

5 fórmula (I) según la reivindicación 1.

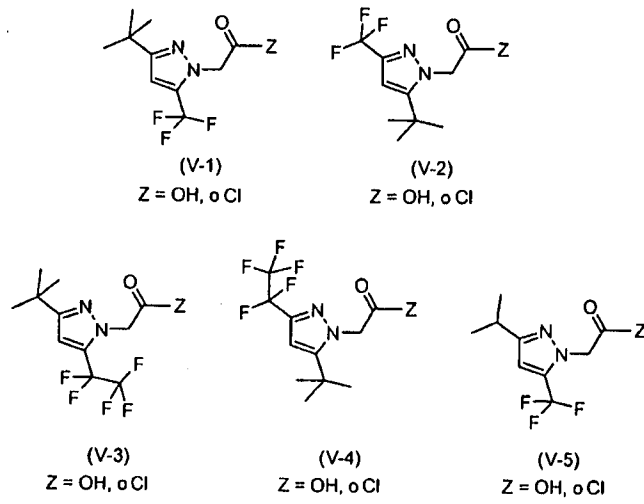
7. Compuestos de fórmula (XVI-1), (XVI-2), (XVI-3), (XVI-4) y (XVI-5)



y sus sales.

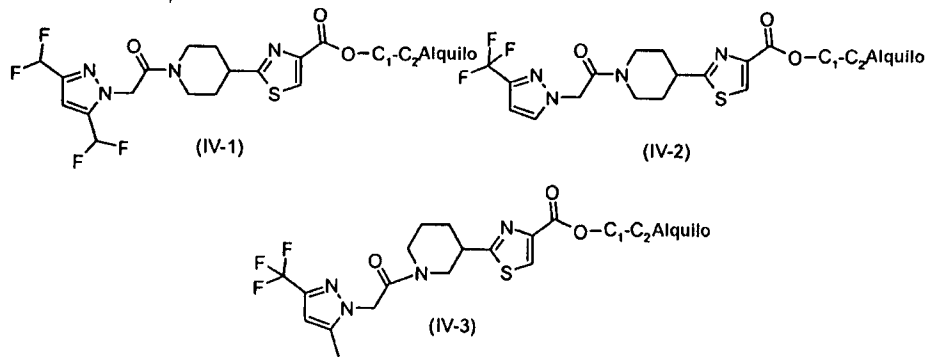
10

8. Compuestos de fórmula (V-1), (V-2), (V-3), (V-4) y (V-5)



y sus sales.

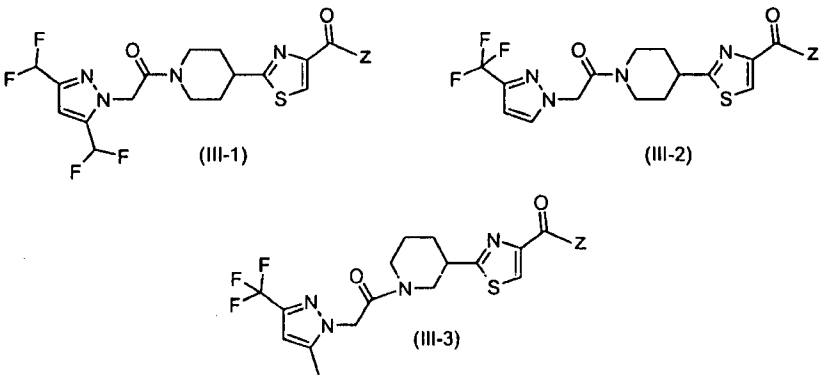
9. Compuestos de fórmula (IV-1), (IV-2) y (IV-3)



5

y sus sales.

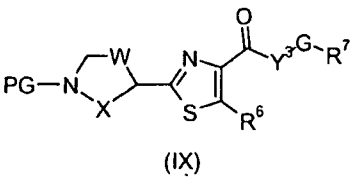
10. Compuestos de fórmula (III-1), (III-2) y (III-3)



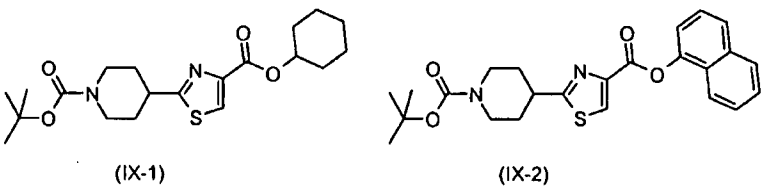
en los que
Z = OH o cloro,
y sus sales.

5

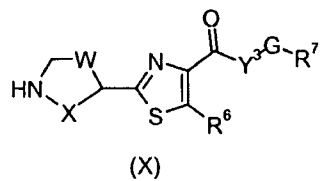
11. Compuestos de fórmula (IX)



en los que los símbolos poseen los significados siguientes:
PG representa acetilo, alcoxi-C₁-C₂-carbonilo, bencilo o benciloxycarbonilo,
10 W, X, Y³, G, R⁶ y R⁷ poseen los significados antes indicados,
y sus sales.

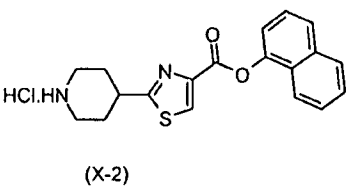
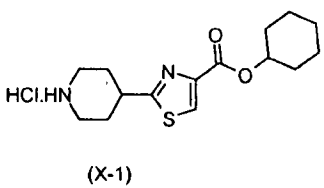


12. Compuestos de fórmula (X)



en los que los símbolos poseen los significados siguientes:

- 5 W, X, Y³, G, R⁶ y R⁷ poseen los significados antes indicados, y sus sales.



13. Uso de los compuestos de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 2
10 para el tratamiento de semillas.
14. Uso de los compuestos de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 2
para el tratamiento de plantas transgénicas.

RESUMEN

Uso de ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I), en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , W, X y G poseen los significados indicados en la descripción, y sus sales con actividad agroquímica

5 como fungicidas.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

PATENTE DE INVENCION X PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional :

(71) Solicitante (s) **BAYER CROPSCIENCE AG**

(72) Inventor(es): **CRISTAU, Pierre; HERRMANN, Stefan; RAHN, Nicola; VOERSTE, Arnd; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; TSUCHIYA, Tomoki**

(74) Apoderado: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**

(30) Prioridad	(31)	No. Prioridad	(32)	Fecha	(33)	País
----------------	------	---------------	------	-------	------	------

08155472.7

30/04/2008

EP

(85) Fecha inicio fase nacional: **30-11-10**

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud: **18 - 04 -09**

No. de solicitud **PCT/ EP2009/002850**

(87) Publicación internacional

Fecha: **05 - 11 - 09** (dd/mm/aa)

N° publicación: **WO 2009/132785 A1**

(54) Título: **ÉSTERES Y TIOÉSTERES DEL ÁCIDO TIAZOL-4-CARBOXÍLICO COMO AGENTES FITOPROTECTORES**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

PATENTE DE INVENCION X PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional:

(71) Solicitante(s) **BAYER CROPSCIENCE AG**

(72) Inventor(es): **CRISTAU, Pierre; HERRMANN, Stefan; RAHN, Nicola; VOERSTE, Arnd; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; TSUCHIYA, Tomoki**

(74) Apoderado: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	08155472.7	30/04/2008	EP

(85) Fecha límite inicio fase nacional: **30-11-10**

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

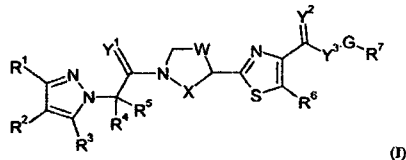
Fecha de presentación de la solicitud: **18 - 04 - 09**

No. de solicitud **PCT/ EP2009/002850**

(87) Publicación internacional:

Fecha: **05 - 11 - 09**

No. Publicación: **WO 2009/132785 A1**



(54) Título: **ÉSTERES Y TIOÉSTERES DEL ÁCIDO TIAZOL-4-CARBOXÍLICO COMO AGENTES FITOPROTECTORES**

(57) Resumen: Uso de ésteres y tioésteres del ácido tiazol-4-carboxílico de fórmula (I), en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Y¹, Y², Y³, W, X y G poseen los significados indicados en la descripción, y sus sales con actividad agroquímica como
CONTINUA AL RESPALDO

194

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-134175- -00000-0000

Fecha: 2010-10-28 16:53:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

ADMISIÓN A TRAMITE - NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE UTILIDAD ☐

Art 33 Decisión 486/00

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐ Incompleta ☐	

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒	Indicación que se solicita una PCT
☒	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☒	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☐ Incompleta ☐	

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita Diseño industrial
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐ Incompleta ☐	

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐ Incompleta ☐	



Bogotá,
2020

mas

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

REFERENCIA	Radicación No.	10 134175
	Solicitud internacional	PCT/EP2009/002850
	Fecha inicio fase nacional	30/11/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	000607

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.

JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 14 ENE. 2011
adpall

Al contestar favor indique el número
de radicación consignado en el rótulo

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 587000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26 - 55 int.2. Tel 5880070
Call Center 6513240. Línea 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia