



Industria y Comercio

"SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO"
INVENTARIO

PCT

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-036972-00000-0000

Fecha: 2011-03-25 17:15:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 218

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

Q.P.

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

PCT- FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No.

11-36972

22. TITULO

**THIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLO
COMO AGENTES FITOSANITARIOS**

CLASIFICACION
INTERNACIONAL

SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

MONHEIN, ALEMANIA

APODERADO

JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

Bogotá, D.C.,

Cur
01-05-2011

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-036972-00000-0000

Fecha: 2011-03-25 17:15:16

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION

Folios: 218

FORMULARIO ÚNICO DE S.
PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

SOLICITUD DE:

☒ Patente de Invención

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☒ Capítulo I

☐ Capítulo II

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **BAYER CROSCIENCE 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

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. ☒ 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/EP2009/006755**

Fecha: **18 - 09 - 09**

Publicacion Internacional No. **WO 2010/037479 A1**

Fecha: **08 - 04 - 10**

6

Título (54)

TIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES FITOSANITARIOS

7

Clasificación internacional (51)

C02D 41/04 ; A01N 43/20

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐

EP

01/10/2008

08165625.8

9

Comprobante de pago No.

Fecha:

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

INVENTORES

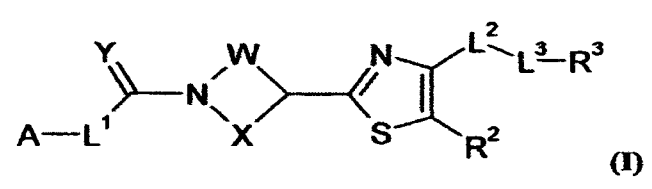
- 1) **CRISTAU, Pierre**
4, rue Marietton
F-69009 Lyon, FRANCIA
Nacionalidad: Francesa
- 2) **RAHN, Nicola**
Am Steinebrueck 17,
40589 Düsseldorf, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 3) **HERRMANN, Stefan**
Virneburgstr. 4a,
40764 Langenfeld, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana
- 4) **TSUCHIYA, Tomoki**
Sonnenstrasse 64
40227 Düsseldorf, ALEMANIA,
Nacionalidad: Japonesa
- 5) **WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike**
Oberer Markeweg 85,
56566 Neuwied, ALEMANIA,
Nacionalidad: Alemana
- 6) **VOERSTE, Arnd**
Mozartstrasse 3-5,
50674 Köln, ALEMANIA,
Nacionalidad: Alemana
- 7) **BENTING, Jürgen**
Amselstr. 7,
42799 Leichlingen, ALEMANIA,
Nacionalidad: Alemana
- 8) **WASNAIRE, Pierre**
Liebfrauenstr. 35,
40591 Düsseldorf, ALEMANIA
Nacionalidad: Belga
- 9) **HOFFMANN, Sebastian**
Farnweg 7,
41470 Neuss, ALEMANIA
Nacionalidad: Alemana

10

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 2010/037479 A1

FIGURA CARACTERISTICA



Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

FIRMA:

Jaime Eduardo Delgado Villegas
C.C. 19.270.955 Bogotá T.P. 43.308 C.S.J.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0025498

Bogotá D.C., Marzo 22 de 2011 - 12:21:57

RECIBIDO DE : MARIO DELGADO ECHEVERRY E HIJOS LTDA

NI 800.020.909

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	388609690	22/03/2011	26.097.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1.50005-01-01	SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	571.000.00	571.000.00
				\$571.000.00

SON: **QUINIENTOS SETENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-036972-00000-0000

Fecha: 2011-03-25 17:15:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
 Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 218

*Este recibo debe ser utilizado
 Únicamente para tramites de
 Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.*

Marca: Pc1 / EP 2009 / 006755

Expediente: _____

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Marzo 22 de 2011 - 12:22:00

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

BAYER CROPSCIENCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 21 October 2009 (21.10.2009)	
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 01 October 2008 (01.10.2008)
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG et al	

- By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- (If applicable) An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
01 October 2008 (01.10.2008)	08165625.8	EP	19 October 2009 (19.10.2009)

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Agnes Wittmann-Regis

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail PT06.PCT@WIPO.INT

Telephone No. +41 22 338 74 06

Form PCT/IB/304 (October 2005)

1/D8FJIVS70

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BAYER CROPSCIENCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 18 March 2011 (18.03.2011)	
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☒ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address WASNAIRE, Pierre Liebfrauenstr. 35 40591 Düsseldorf 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 WASNAIRE, Pierre Liebfrauenstr. 35 40591 Düsseldorf Germany	State of Nationality BE	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 e-mail pt06.pct@wipo.int Telephone No. +41 22 338 74 06
Facsimile No. +41 22 338 89 70	

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BAYER CROPSOURCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 18 March 2011 (18.03.2011)	
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☒ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address CRISTAU, Pierre Ehrenstrasse 96-98 50672 Köln Germany	State of Nationality FR	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 CRISTAU, Pierre 4, rue Marietton F-69009 Lyon France	State of Nationality FR	State of Residence FR
	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

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE

(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:
BAYER CROPSCIENCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 18 March 2011 (18.03.2011)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☒ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address RAHN, Nicola Stresemannstrasse 17 40210 Düsseldorf 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 RAHN, Nicola Am Steinebrueck 17 40589 Düsseldorf 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 e-mail pt06.pct@wipo.int Telephone No. +41 22 338 74 06
Facsimile No. +41 22 338 89 70	

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BAYER CROPSOURCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 18 March 2011 (18.03.2011)	
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☒ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address BENTING, Jürgen Fliederweg 20 42799 Leichlingen 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 BENTING, Jürgen Amselstr. 7 42799 Leichlingen 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

From the INTERNATIONAL BUREAU

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

To:

BAYER CROPSCIENCE AG
Business Planning and Administration
Law And Patents
Patents And Licensing
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year) 18 March 2011 (18.03.2011)	
Applicant's or agent's file reference BCS083061-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2009/006755	International filing date (day/month/year) 18 September 2009 (18.09.2009)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☐ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address BAYER CROPSCIENCE AG Business Planning and Administration, Law And Patents, Patents And Licensing Alfred-Nobel-Strasse 50 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No. 02173 38969 7780	
	Facsimile No. 02173 38969 2663	
	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-Strasse 50 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No. 02173 38969 7780	
	Facsimile No. 02173 38969 2663	
	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 e-mail pt06.pct@wipo.int Telephone No. +41 22 338 74 06
---	--

Facsimile No. +41 22 338 89 70

Form PCT/IB/306 (January 2009)

1/ESSREKWFO

TIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES**FITOSANITARIOS**

La invención se refiere a tiazoles sustituidos con heterociclilo o a sus sales agroquímicamente efectivas, a su uso así como a procedimientos y agentes para
5 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 semilla tratada así como a su uso para combatir hongos dañinos fitopatógenos en agricultura, jardinería y silvicultura, en veterinaria, en protección de materiales así como en el ámbito del hogar y de la higiene. La presente invención se refiere además a un procedimiento para la
10 preparación de tiazoles sustituidos con heterociclilo.

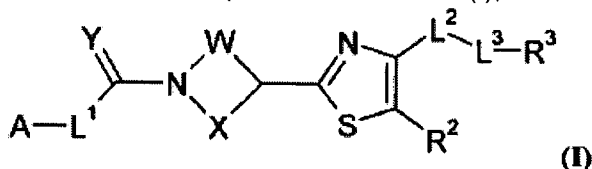
Ya se conoce que determinados tiazoles sustituidos con heterociclilo se pueden usar como agentes fitosanitarios fungicidas (véanse los documentos WO 07/014290, WO 08/013925, WO 08/013622, WO 08/091594, WO 08/091580, WO 09/055514). Sin embargo, la actividad fungicida de estos compuestos no siempre es suficiente con bajas
15 cantidades de aplicación.

Debido a que los requerimientos ecológicos y económicos en agentes fitosanitarios modernos son crecientes, por ejemplo, en lo que se refiere a espectro de actividad, toxicidad, selectividad, cantidad de aplicación, formación de residuo y de fabricación favorable, y además se pueden dar problemas con resistencias, por ejemplo, persiste el
20 objetivo de desarrollar nuevos agentes fitosanitarios, de forma particular fungicidas, que presenten al menos en ámbitos parciales ventajas frente a los conocidos.

De forma sorprendente se ha encontrado ahora que los presentes tiazoles sustituidos con heterociclilo consiguen los objetivos citados al menos en aspectos parciales y que son adecuados como agentes fitosanitarios, de forma particular como
25 fungicidas.

Algunos tiazoles sustituidos con heterociclilo ya son conocidos como compuestos farmacéuticamente activos (véanse, por ejemplo, los documentos EP 1832586, WO 04/058750, WO 04/058751, WO 05/003128, WO 06/032322, WO 07/104558, WO 07/115805, WO 08/083238) sin embargo no se conoce su sorprendente actividad fungicida.

Son objeto de la invención compuestos de fórmula (I),



en la que los símbolos tienen los siguientes significados:

A representa metilo

10 o

A representa fenilo no sustituido o sustituido,

seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista

ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , halogenocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_4-C_{10} -alquilo, alquil C_4-C_{10} -cicloalquilo, alquil C_5-C_{10} -cicloalquilalquilo, alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil C_1-C_2)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , halogenoalcoxi C_1-C_4 , OCH_2OCH_3 , SH, alquil C_1-C_4 -tio, halogenoalquil C_1-C_6 -tio, CHO, COOH, (alcoxi C_1-C_4)carbonilo, $CONR^6R^7$, $CR^6=NOR^7$, (alquil C_1-C_4)carbonilo, (halogenoalquil C_1-C_4)carbonilo, (alquil C_1-C_4)carboniloxi, (alquil C_1-C_4)-carboniltio, alquil C_1-C_4 -sulfinilo, halogenoalquil C_1-C_4 -sulfinilo, alquil C_1-C_4 -sulfonilo, halogenoalquil C_1-C_4 -sulfonilo, NR^6R^7 , NR^6COR^7 , SF_5 , $SO_2NR^6R^7$, alcoxi C_2-C_4 -alquilo o 1-metoxiciclopropilo

o

A es un heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido, dado el caso benzocondensado, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista

Sustituyentes en carbono:

- 5 ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, CHO,
- 10 COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, CR⁶=NOR⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

Sustituyentes en nitrógeno:

- 15 hidroxilo, NR⁶R⁷, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o halogenoalquinilo C₂-C₆

L¹ es (C(R¹))_n,

con n = 0 a 3

- 20 R¹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂ o ciano,
- con la condición de que L¹ puede contener como máximo dos R¹, que sean distintos de hidrógeno

Y representa azufre u oxígeno,

- 25 W es una cadena de carbono C₁ a C₃ no sustituida o sustituida una vez,

- seleccionándose el sustituyente de oxo, hidroxí, ciano o alquilo C₁-C₄
- X es una cadena de carbono C₁ a C₂ no sustituida o sustituida una vez, seleccionándose el sustituyente de oxo, hidroxí, ciano o alquilo C₁-C₄
- R² representa hidrógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂ o halógeno
- 5 L² representa -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- o -CR⁹=CR⁹- o -C≡C-
- L³ representa un enlace directo
- o
- L³ representa una cadena de carbono C₁ a C₄, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros
- 10 de la siguiente lista:
- halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂ o cicloalquilo C₃-C₆
- R³ representa metilo, halogenoalquilo C₁-C₂, -CH=CH₂, -C≡CH, o cicloalquilo C₃-C₁₀ no sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyente de la siguiente lista:
- ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo
- 15 C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo, hidroxí, oxo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆, alquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, alquil C₁-C₆-tio, o halogenoalquil C₁-C₆-tio,
- o
- R³ representa fenilo no sustituido o sustituido,
- 20 en donde los sustituyentes se seleccionan independientemente unos de otros de la siguiente lista:
- ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, halogenocicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo,
- 25 alquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, cicloalquenilo C₃-C₈,

halocicloalquenilo C₃-C₈, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, alcoxí C₂-C₆-alquilo, halogenoalcoxí C₂-C₆-alquilo, alcoxí C₃-C₈-alcoxialquilo, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxí, alcoxí C₁-C₆, alcoxí C₂-C₆-alcoxí, halogenoalcoxí C₁-C₆, alquenil C₂-C₆-oxi, halogenoalquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, halogenoalquinil C₂-C₆-oxi, cicloalcoxí C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-oxi, halocicloalcoxí C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquiloxi, NR⁶R⁷, SH, SF₅, alquil C₁-C₆-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, alquil C₂-C₆-alquiltio, cicloalquil C₃-C₆-tio, CHO, COOH, (alcoxí C₁-C₆)carbonilo, CONR⁶R⁷, CR⁶=NOR⁷, (alquil C₁-C₆)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₆)carbonilo, (alquil C₁-C₆)carboniloxi, (halogenoalquil C₁-C₆)carboniloxi, (alquil C₁-C₆)carboniltio, alquil C₁-C₆-sulfínilo, halogenoalquil C₁-C₆-sulfínilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₆-sulfonilo, NR⁶COR⁷ o SO₂NR⁶R⁷

o

R³ representa naftilo o indenilo saturado o parcial o completamente insaturado, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo, hidroxí, alcoxí C₁-C₆, halogenoalcoxí C₁-C₆, alquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

20 o

R³ representa un resto heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:
Sustituyentes en carbono: ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆,

alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

Sustituyentes en nitrógeno: hidroxilo, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆ o fenilo

10 o

R³ representa heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido benzocondensado, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆ o fenilo

o

R^3 es un resto heterociclilo de 5 a 15 miembros no sustituido o sustituido una vez, unido por un átomo de carbono, que puede contener hasta dos heteroátomos adicionales seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, seleccionándose los

5 sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil C_1-C_2)sililo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 , halogenoalcoxi C_1-C_6 , alquenil C_2-C_6 -oxi, alquinil C_2-C_6 -oxi, alquil C_1-C_6 -tio, o halogenoalquil C_1-C_6 -tio

10 Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil C_1-C_2)sililo o fenilo

R^6 , R^7 representan independientemente uno de otro hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6

15 R^8 es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 o halogenoalquilo C_1-C_3 ,

R^9 es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , o cicloalquilo C_3-C_6 ,

así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

20 Otro objeto es el uso de los compuestos de fórmula (I) como fungicidas.

Los tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención de fórmula (I) así como sus sales agroquímicamente efectivas son muy adecuados para combatir hongos dañinos fitopatógenos. Los compuestos de acuerdo con la invención citados previamente muestran sobre todo una fuerte actividad fungicida y se pueden usar tanto

25 en protección de plantas como en el ámbito doméstico y en higiene así como también en

la protección de materiales.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden presentar tanto en forma pura como también en mezclas de distintas formas isoméricas, de forma particular de estereoisómeros, como isómeros E y Z, treo- y eritro-isómeros, así como isómeros
5 ópticos, como isómeros R y S o atropisómeros, dado el caso también de tautómeros. Se reivindican tanto los isómeros E como los Z, como también los treo- y eritro-isómeros así como los isómeros ópticos, mezclas deseadas de estos isómeros así como las posibles formas tautoméricas.

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

A representa metilo

o

A representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan independientemente unos de otros de la siguiente lista:

15 ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo o halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo,

20 o

A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: un furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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,
25 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, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-
 ilo, piridazin- 3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo,
 5 pirazin-2-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-
 indol-3- ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1 H-
 bencimidazol- 1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-
 ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-
 6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-
 10 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-benzoxazol-2-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,
 15 isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo, o isoquinolin-8-ilo,

que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes
 independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, hidroxí,
 alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o halogenoalquil C₁-C₄-tio,

20 Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alquenilo
 C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄,

L¹ es (C(R¹))₂)_n

con n = 0 a 3

R¹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, cloro, flúor,
 25 metilo, CF₃ o ciano,

con la condición de que L^1 puede contener como máximo dos R^1 que sean distintos de hidrógeno,

Y representa azufre u oxígeno,

W es una cadena de carbono C_1 a C_2 no sustituida o sustituida una vez,
5 seleccionándose el sustituyente de ciano o alquilo C_1-C_2 ,

X es una cadena de carbono C_1 a C_2 no sustituida o sustituida una vez,
seleccionándose el sustituyente de ciano o alquilo C_1-C_2 ,

R^2 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_2 o halógeno,

L^2 representa $-C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ o $-CR^9=CR^9-$ o $-C\equiv C-$,

10 L^3 representa un enlace directo,

o

L^3 representa una cadena de carbono C_1 a C_4 , que puede contener hasta dos
sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros
de la siguiente lista:

15 alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , halogenoalquilo C_1-C_2 o ciclopropilo,

R^3 representa metilo, halogenoalquilo C_1-C_2 , $-CH=CH_2$, $-C\equiv CH$, o cicloalquilo C_3-C_{10} no
sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyente de la siguiente lista:
halógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , tri(alquil
 C_1-C_2)sililo, fenilo u oxo,

20 o

R^3 representa fenilo, que puede contener hasta tres sustituyentes, seleccionándose los
sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
halogenocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-
25 C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil C_1-C_2)sililo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 ,

halogenoalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

o

R³ representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 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, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo,

que puede contener hasta dos sustituyenes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

10 ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₃-tio,

o

R³ representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, 15 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, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 20 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,

que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, 25 cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o

halogenoalquil C₁-C₄-tio,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o fenilo,

o

- 5 R³ representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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, 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo, o isoquinolin-8-ilo,

- 15 que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxil, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o halogenoalquil C₁-C₄-tio,

- 20 Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o fenilo,

o

- R³ representa un resto heterociclilo de 5 a 6 miembros no sustituido o sustituido una vez, unido por un átomo de carbono, que puede contener hasta dos heteroátomos adicionales seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, seleccionándose los
- 25

sustituyentes de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo o fenilo,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-

5 C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo o fenilo,

R⁸ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, ciclopropilo o halogenoalquilo C₁-C₂,

R⁹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, o ciclopropilo

10 así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

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

A representa metilo,

o

15 A representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes de la siguiente lista:

ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂, hidroxilo, alcoxi C₁-C₂ o halogenoalcoxi C₁-C₂,

o

20 A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo; pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, 1H-benzimidazol-2-ilo o 1,3-benzotiazol-2-ilo,

25 que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes

independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂, hidroxilo, alcoxi C₁-C₂ o halogenoalcoxi C₁-C₂,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₂ o halogenoalquilo C₁-C₂,

- 5 L¹ es (C(R')₂)_n
con n = 0 a 3,
R¹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno o metilo,
con la condición de que L¹ puede contener como máximo dos sustituyentes metilo,
Y representa azufre u oxígeno,
- 10 W representa -CH₂CH₂-,
X representa -CH₂CH₂-,
R² representa hidrógeno, metilo o halógeno,
L² representa -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- o -CR⁹=CR⁹- o -C≡C-,
L³ representa un enlace directo,
- 15 o
L³ representa una cadena de carbono C₁ a C₄, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:
metilo, metoxi o CF₃,
- 20 R³ representa metilo, halogenoalquilo C₁-C₂, -CH=CH₂, -C≡CH, o cicloalquilo C₃-C₁₀ no sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyentes de la siguiente lista:
flúor, cloro, metilo, etilo, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,
o
- 25 R³ representa fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes, seleccionándose los

sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

o

- 5 R³ representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 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, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo,

- 10 que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

flúor, cloro, bromo, yodo metilo, etilo, CF₃, CHF₂, ciclopropilo, fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃,

o

- 15 R³ representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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, 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 o 1,2,4-triazin-3-ilo,

- 20 que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, ciclopropilo, fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, OisoPr, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃.

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, ciclopropilo o fenilo,

5 o

R³ representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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, 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo,

10

15

que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, ciclopropilo, fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, OisoPr, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃.

20

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, ciclopropilo o fenilo,

o

R³ es un pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-2-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo o piperazin-2-ilo no sustituidos o sustituidos una vez, seleccionándose

25

el sustituyente de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: metilo, etilo, CF_3 , ciclopropilo o fenilo,

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, ciclopropilo o fenilo,

5 R^8 es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo, etilo o CF_3 .

R^9 es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo, así como sales agroquímicamente eficaces de los mismos.

Se prefieren con muy especial preferencia compuestos de fórmula (I) en los que uno o varios de los símbolos tienen uno de los siguientes significados:

10 A representa metilo,

o

A representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

15 ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , hidroxilo, OMe, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2CF_3 o OC_2F_5 .

o

A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: tiofen-3-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-4-ilo, piridin-4-ilo, 1H-benzimidazol-2-ilo o 1,3-benzotiazol-2-ilo, que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes

20 independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , hidroxilo, OMe, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2CF_3 , o OC_2F_5 .

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo o CF_3 .

L^1 es $(\text{C}(\text{R}^1)_2)_n$

25 con $n = 0$ a 3 ,

- R^1 es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno o metilo,
con la condición de que L^1 puede contener como máximo un sustituyente metilo,
- Y representa azufre u oxígeno,
- W representa $-CH_2CH_2-$,
- 5 X representa $-CH_2CH_2-$,
- R^2 representa hidrógeno, metilo, cloro o bromo,
- L^2 representa $-C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ o $-CR^9=CR^9-$ o $-C\equiv C-$,
- L^3 representa un enlace directo
- o
- 10 L^3 representa una cadena de carbono C_1 a C_4 ,
- R^3 representa metilo, CF_3 , $-CH=CH_2$, $-C\equiv CH$, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo,
- o
- R^3 representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los
- 15 sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:
- ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, *O*isoPr, OCF_3 , $OCHF_2$, OC_2F_5 , SMe o SCF_3 ,
- o
- R^3 representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-
- 20 tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo,
- o
- 25 R^3 representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-

- ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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, 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 o 1,2,4-triazin-3-ilo,
- o
- 10 R³ representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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, 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo,
- 20 o
- R³ representa pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, mofolin-3-ilo, mofolin-2-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, o piperazin-2-ilo,
- R⁸ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo,
- R⁹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo,
- 25 así como sales agroquímicamente eficaces de los mismos.

De forma particular se prefieren compuestos de fórmula (I) en la que uno o varios de los símbolos presenten uno de los siguientes significados:

- A representa metilo, 1,3-dihidro-2H-indazol-2-ilo, 3-clorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 2,5-dibromofenilo, 2-bromo-5-(trifluorometil)fenilo, 5-bromo-2-metilfenilo, 5-yodo-2-metilfenilo, 2,5-bis(trifluorometil)fenilo, 2-cloro-5-(trifluorometil)fenilo, 1H-pirazol-1-ilo, 3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 3,5-dimetil-1H-pirazol-1-ilo, 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 5-(difluorometil)-3-metil-1H-pirazol-1-ilo, 3,5-dicloro-1H-pirazol-1-ilo, 3,5-dibromo-1H-pirazol-1-ilo, 5-cloro-1-metil-1H-pirazol-4-ilo, tiofen-3-ilo, piridin-4-ilo, 3-Chlor-5-(trifluorometil)piridin-2-ilo, 1H-benzimidazol-2-ilo o 1,3-benzotiazol-2-ilo,
- L¹ es un enlace directo,
- o
- 15 L¹ representa -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂- o -CHCH₃-,
- Y representa azufre u oxígeno,
- W representa -CH₂CH₂-,
- X representa -CH₂CH₂-,
- R² representa hidrógeno, metilo o bromo,
- 20 L² representa -CH₂CH₂-, -CH₂CHCH₃-, -CH=CH- (Z), -CH=CH- (E) o -C≡C-,
- L³ representa un enlace directo,
- o
- L³ representa -CH₂-, -CH₂C(CH₃)₂-, -CH₂CHCH₃-,
- R³ representa metilo, -CH=CH₂, -C≡CH, CF₃, ciclohexilo, fenilo, 4-clorofenilo, 4-metoxifenilo, 3-(trifluorometil)fenilo, naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo o piridin-3-ilo,
- 25

así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que A representa un pirazol-1-ilo o pirazol-4-ilo no sustituido o sustituido, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , hidroxilo, OMe, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2CF_3 , o OC_2F_5 .

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo o CF_3 .

y L_1 representa $-\text{CH}_2-$,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que A representa un fenilo no sustituido o sustituido,

seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , hidroxilo, OMe, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2CF_3 , o OC_2F_5 .

y L^1 representa $-\text{CH}_2-$,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que Y representa oxígeno,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I), en la que uno o varios de los símbolos presentan uno de los siguientes significados:

W representa $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$

5 X representa $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I), en la
10 que

R^2 representa hidrógeno, halógeno o metilo,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la
15 que

L^2 representa $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

20 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que

L^2 representa $-\text{CH}=\text{CH}-$ (Z),

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

25 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que L^2 representa $-\text{CH}=\text{CH}-$ (E),
presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

5 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que L^2 representa $-\text{C}\equiv\text{C}-$,
presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

10 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que L^3 representa un enlace directo,
presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

15 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que L^3 representa $-\text{CH}_2-$,
presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

20 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que R^3 representa un naftalen-1-ilo o naftalen-2-ilo,
presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

25 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que R^3 representa un fenilo no sustituido, presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

5 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que A representa 2,5-dimetilfenilo, 2,3,6-trifluorofenilo, 3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 3-(propan-2-il)-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 3-terc-butil-5-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-ilo, 3-terc-butil-5-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 5-etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 5-terc-butil-3-(pentafluoroetil)-1H-pirazol-1-ilo, 5-terc-butil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo, 2H-indazol-2-ilo, 1,3-benzodioxol-5-ilo o 1H-bencimidazol-2-ilo,

presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

15 así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Adicionalmente se prefieren de forma particular compuestos de fórmula (I) en la que R^3 representa 2,4-diclorofenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2,5-dimetoxifenilo, 2-metoxifenilo, 2-metilfenilo, 3,5-dimetilisoxazol-4-ilo, 3-metilpiridin-2-ilo, quinolin-8-ilo, morfolin-4-ilo, naftalen, terc-butilo, trimetilsililo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, ciclohexilo, 2-bromofenilo, 2-clorofenilo, 2-cloro-6-fluorofenilo, 2,6-difluorofenilo,

20 presentando los restantes sustituyentes uno o varios de los significados citados anteriormente,

así como las sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

Las definiciones de restos citadas previamente se pueden combinar entre ellas de 25 forma discrecional. Además pueden darse definiciones individuales.

Según cada tipo de sustituyentes anteriormente citados los compuestos de fórmula (I) presentan propiedades ácidas o básicas y pueden formar con ácidos inorgánicos u orgánicos o con bases con sales de iones metálicos, dado el caso también sales internas o aductos. Si los compuestos de fórmula (I) portan amino, alquilamino u otros grupos que induzcan propiedades básicas, entonces estos compuestos pueden reaccionar con ácidos dando sales o presentarse como sales mediante la síntesis directa. Si los compuestos de fórmula (I) portan hidroxilo, carboxi u otros grupos que induzcan propiedades ácidas, entonces estos compuestos pueden reaccionar con bases dando sales. Bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxidos, carbonatos, hidrogenocarbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, de forma particular de sodio, potasio, magnesio y calcio, además de amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias con grupos alquilo (C_1-C_4), mono-, di- y trialquilaminas de alcoholes (C_1-C_4), colina así como clorocolina.

Las sales que se obtienen de este modo presentan igualmente propiedades fungicidas, herbicidas e insecticidas.

Ejemplos de ácidos inorgánicos son ácidos halogenhídricos como fluorhídrico, clorhídrico, bromhídrico y yodhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico y sales ácidas como $NaHSO_4$ y $KHSO_4$. Como ácidos orgánicos se tienen en cuenta, por ejemplo, ácido fórmico, ácido carbónico y ácidos alcanoicos 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 de cadena lineal o ramificada con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (restos aromáticos como fenilo y naftilo que portan uno o dos grupos ácido sulfónico), ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con restos alquilo de cadena lineal o

ramificada con 1 a 20 átomos de carbono, ácidos arilfosfónicos o ácidos arildifosfónicos (restos aromáticos como fenilo y naftilo que portan uno o dos restos de ácido fosfónico), pudiendo portar los restos alquilo o arilo otros sustituyentes, por ejemplo, ácido p-toluenosulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

Como iones metálicos se tienen en cuenta de forma particular los iones de los elementos del grupo IIa, de forma particular calcio y magnesio, del grupo III y IVa, de forma particular aluminio, estaño y plomo, así como del grupo I a VIIIb, de forma particular cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, cinc y otros. Se prefieren especialmente los iones metálicos de elementos del cuarto periodo. Los metales pueden presentarse a este respecto en sus distintas valencias posibles.

Grupos dado el caso sustituidos pueden estar sustituidos una o varias veces, pudiendo ser las sustituciones en sustituciones múltiples iguales o distintas.

En las definiciones de los símbolos indicadas en las fórmulas precedentes se usaron términos genéricos, que por lo general son representativos de los siguientes sustituyentes:

Halógeno: flúor, cloro, bromo y yodo;

Alquilo: restos hidrocarburo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquilo C₁-C₈ como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-di- metilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3- dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

Alquenilo: restos hidrocarburo insaturados, de cadena lineal o ramificada con 2 a 8 átomos de carbono y un enlace doble en una posición discrecional, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquenilo C_2-C_6 como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

Alquinilo: grupos hidrocarburo insaturados, de cadena lineal o ramificada con 2 a 8 átomos de carbono y un enlace triple en una posición discrecional, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquinilo C_2-C_6 como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-

2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

- 5 **Alcoxi:** restos alcoxi saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alcoxi C₁-C₆ como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metil-propoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-di-metilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metil-propoxi;

- Alquiltio:** restos alquiltio saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquil C₁-C₆-tio como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metil-propiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetileiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-di-metilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metil-pentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetil-butiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3- dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio;

Alcoxycarbonilo: un grupo alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono (como se citó previamente), que está unido por un grupo carbonilo (-CO-) al esqueleto;

- Alquilsulfinilo:** restos alquilsulfinilo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquil C₁-C₆-sulfinilo como metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, 1-metileilsulfinilo, butilsulfinilo, 1-metil-

propilsulfinilo, 2-metilpropilsulfinilo, 1,1-dimetiletilsulfinilo, pentilsulfinilo, 1-metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 2,2-di-metilpropilsulfinilo, 1-etilpropilsulfinilo, hexilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-metilpentilsulfinilo, 2-metilpentil-sulfinilo, 3-metilpentilsulfinilo, 4-metilpentilsulfinilo, 1,1-dimetilbutilsulfinilo, 1,2-dimetilbutilsulfinilo, 1,3-dimetilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilbutilsulfinilo, 2,3-dimetil-butilsulfinilo, 3,3-dimetilbutilsulfinilo, 1-etilbutilsulfinilo, 2-etilbutilsulfinilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfinilo, 1-etil-1-metilpropilsulfinilo y 1-etil-2-metilpropilsulfinilo;

Alquilsulfonylo: restos alquilsulfonylo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos), alquil C₁-C₆-sulfonylo como metilsulfonylo, etilsulfonylo, propilsulfonylo, 1-metiletilsulfonylo, butilsulfonylo, 1-metilpropilsulfonylo, 2-metilpropilsulfonylo, 1,1-dimetiletilsulfonylo, pentilsulfonylo, 1-metilbutilsulfonylo, 2-metilbutilsulfonylo, 3-metilbutilsulfonylo, 2,2-di-metilpropilsulfonylo, 1-etilpropilsulfonylo, hexilsulfonylo, 1,1-dimetilpropilsulfonylo, 1,2-dimetilpropilsulfonylo, 1-metilpentilsulfonylo, 2-metilpentil-sulfonylo, 3-metilpentilsulfonylo, 4-metilpentilsulfonylo, 1,1-dimetil-butilsulfonylo, 1,2-dimetilbutilsulfonylo, 1,3-dimetilbutilsulfonylo, 2,2-dimetilbutilsulfonylo, 2,3-dimetilbutilsulfonylo, 3,3-dimetilbutilsulfonylo, 1-etilbutilsulfonylo, 2-etilbutilsulfonylo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonylo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonylo, 1-etil-1-metilpropilsulfonylo y 1-etil-2-metilpropilsulfonylo;

Cicloalquilo: grupos hidrocarburo monocíclicos saturados con 3 a 10 miembros del anillo de carbono, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

Halogenoalquilo: grupos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono (como se citó previamente), pudiendo estar reemplazados en estos grupos parcial o completamente los átomos de hidrógeno por átomos de halógeno como se citó

previamente, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) halogenoalquilo C_1-C_3 como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoretilo, 2,2,2-trifluoretilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro,2-difluoretilo, 2,2-dicloro-2-fluoretilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoretilo y 1,1,1-trifluorprop-2-ilo;

Halogenoalcoxi: grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono (como se citó previamente), pudiendo estar reemplazados en estos grupos parcial o completamente los átomos de hidrógeno por átomos de halógeno como se citó previamente, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) halogenoalcoxi C_1-C_3 como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoretoxi, 2,2,2-trifluoretoxi, 2-cloro-2-fluoretoxi, 2-cloro,2-difluoretoxi, 2,2-dicloro-2-fluoretoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluorprop-2-oxi;

Halogenoalquiltio: grupos alquiltio de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 átomos de carbono (como se citó previamente), pudiendo estar reemplazados en estos grupos parcial o completamente los átomos de hidrógeno por átomos de halógeno como se citó previamente, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) halogenoalquil C_1-C_3 -tio como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluoro-metiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoretiltio, 2,2,2-trifluoretiltio, 2-cloro-2-fluoretiltio, 2-cloro,2-difluoretiltio, 2,2-dicloro-2-fluoretiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoretiltio y 1,1,1-trifluorprop-2-iltio;

Heteroarilo: sistema de anillo monocíclico, completamente insaturado de 5 ó 6

miembros, que contiene de uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, entonces estos no son directamente adyacentes;

Heteroarilo de 5 miembros: que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o de oxígeno: grupos heteroarilo de 5 miembros, que además de átomos de carbono pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno como miembros del anillo, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) 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, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

Heteroarilo de 5 miembros unido por nitrógeno, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno, o heteroarilo de 5 miembros benzocondensado unido por nitrógeno, que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo de 5 miembros, que además de átomos de carbono pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo, y en los que pueden estar puenteados dos miembros de anillo de carbono adyacentes o un miembro de anillo de nitrógeno y un miembro de anillo de carbono adyacente con un grupo buta-1,3-dien-1,4-diilo, en los que uno o dos átomos de C pueden estar reemplazados por átomos de N, en los que uno o dos átomos de C pueden estar reemplazados por átomos de N, estando unidos estos anillos por uno de los miembros de nitrógeno al esqueleto, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) 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 de uno a cuatro átomos de nitrógeno:

grupos heteroarilo de 6 miembros que además de átomos de carbono pueden contener de uno a tres o de uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros del anillo, por ejemplo (pero sin limitarse a estos) 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5- triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo y 1,2,4,5-tetrazin-3-ilo;

Heteroarilo de 5 miembros benzocondensado, que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno o un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o de azufre:

por ejemplo (pero sin limitarse a estos) 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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 y 1,3-benzoxazol-2-ilo,

Heteroarilo de 6 miembros benzocondensado que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno: por ejemplo (pero sin limitarse a estos) 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo y isoquinolin-8-ilo;

Heterociclilo: heterociclo de tres a quince miembros saturado o parcialmente insaturado, que contiene de uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre: heterociclos mono-, bi- o tricíclicos que contienen además de miembros del anillo de carbono de uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o de azufre o uno

o dos átomos de oxígeno y/o azufre: si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, entonces estos no son directamente adyacentes; como por ejemplo (pero sin limitarse a estos) oxiranilo, aziridinilo, 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidro- furanilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3- pirazolidinilo, 4-
 5 pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-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-
 10 2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 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-
 15 ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-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-dihidroopirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo,
 20 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-hexahidro-piridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo,
 25 4-hexahidropirimidinilo, 5- hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2-

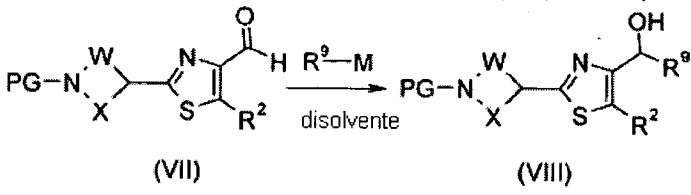
ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo;

Grupo saliente: grupo saliente S_N1 o S_N2 , por ejemplo halógeno (cloro, bromo, yodo), sulfonatos de alquilo ($-\text{OSO}_2\text{-alquilo}$, por ejemplo $-\text{OSO}_2\text{CH}_3$, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$) o sulfonatos de arilo ($-\text{OSO}_2\text{-Arilo}$, por ejemplo $-\text{OSO}_2\text{Ph}$, $-\text{OSO}_2\text{PhMe}$);

5 No se encuentran comprendidas aquellas combinaciones que contradigan las leyes de la naturaleza y aquellas que hubiese excluido el especialista en la técnica en base a su conocimiento. A modo de ejemplo se excluyen estructuras de anillo con tres o varios átomos de O adyacentes.

10 Un objeto adicional de la presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención de fórmula (I), que comprende al menos una de las siguientes etapas (a) a (u):

(a) Reacción de compuestos de fórmula (VII) dando compuestos de fórmula (VIII) en presencia de un compuesto organometálico $R^9\text{-M}$ y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 1):



siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi $C_1\text{-}C_4$ -carbonilo, o benciloxicarbonilo,

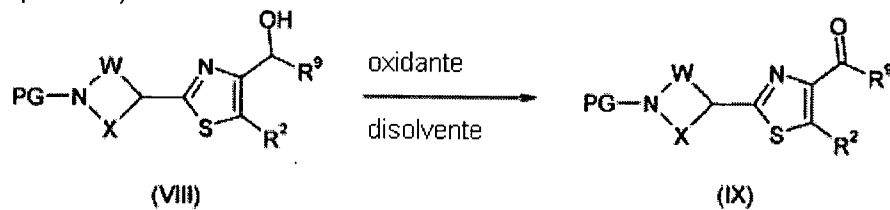
20 M = por ejemplo, MgCl , MgBr , MgI , Li ,

R^9 = alquilo $C_1\text{-}C_4$ o cicloalquilo $C_3\text{-}C_6$,

W, X, y R^2 son como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(b) Reacción de alcoholes de fórmula (VIII) con un oxidante en presencia de un

disolvente dando cetonas de fórmula (IX) según el esquema de reacción siguiente (esquema 2):



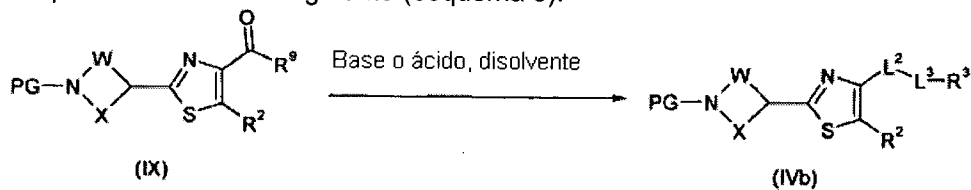
siendo

- 5 PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

R⁹ = alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

W, X, y R² son como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- 10 (c) Reacción de cetonas de fórmula (IX) dando compuestos de fórmula (IVb) en presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 3):



siendo

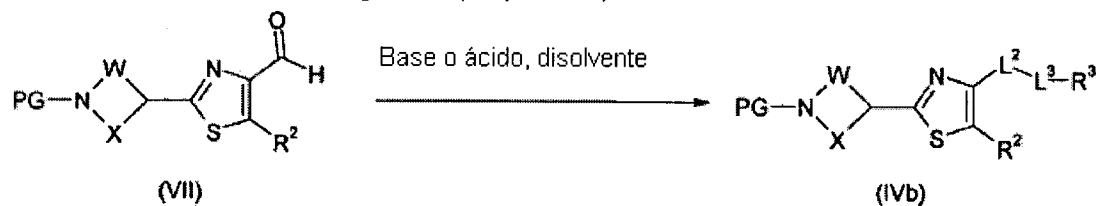
- 15 PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

L² = -CR⁹=CR⁹-,

W, X, L³, R², R³ y R⁹ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- 20 (d) Reacción de aldehidos de fórmula (VII) dando compuestos de fórmula (IVb) en

presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 4):



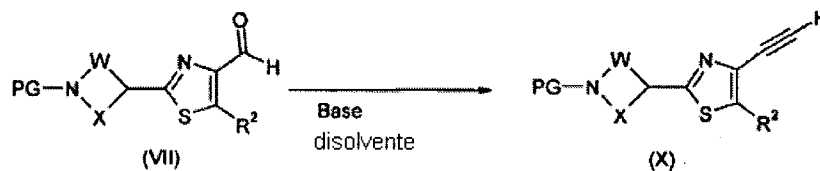
siendo

- 5 PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

$$L^2 = -\text{CR}^9=\text{CR}^9-,$$

W, X, L³, R², R³ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- 10 (e) Reacción de aldehídos de fórmula (VII) dando alquinos de fórmula (X) en presencia de una base y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 5):



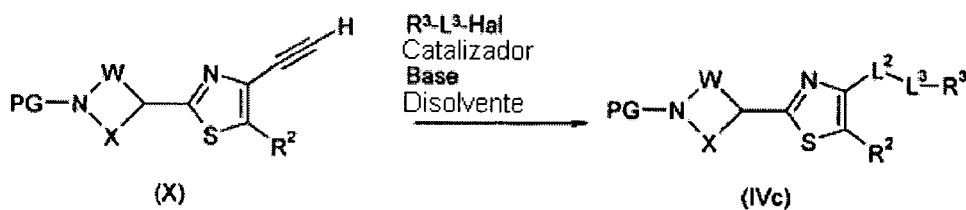
siendo

- 15 PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

W, X y R² como se definen anteriormente para la fórmula (I).

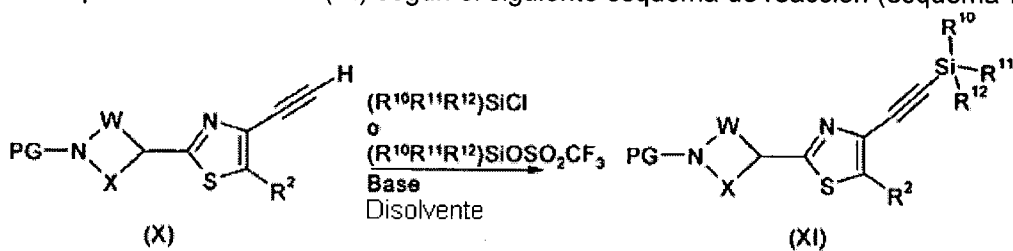
- (f) Reacción de alquinos de fórmula (X) con un halogenuro de R³-L³ en una reacción de acoplamiento C-C dado el caso catalizada en presencia de una base y dado el
- 20

caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (IVc) según el esquema de reacción siguiente (esquema 6):



siendo

- 5 PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,
- Hal = Cl, Br o I,
- L² = -C≡C-,
- 10 W, X, L³, R² y R³ como se definen anteriormente para la fórmula (I).
- (g) Reacción de alquinos de fórmula (X) con un cloruro de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiCl o triflato de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiOSO₂CF₃, u otros reactivos de sililación conocidos en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (XI) según el siguiente esquema de reacción (esquema 7):



15

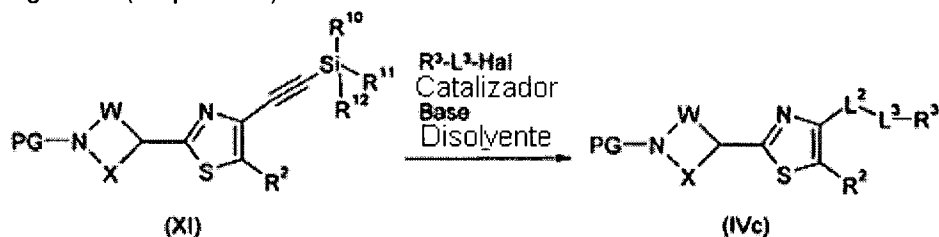
siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

W, X y R^2 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (h) Reacción de alquinos de fórmula (XI) con un compuesto R^3 - L^3 -Hal dado el caso en presencia de un catalizador en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (IVc) según el esquema de reacción siguiente (esquema 8):



siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C_1 - C_4 -carbonilo,

Hal = Cl, Br o I,

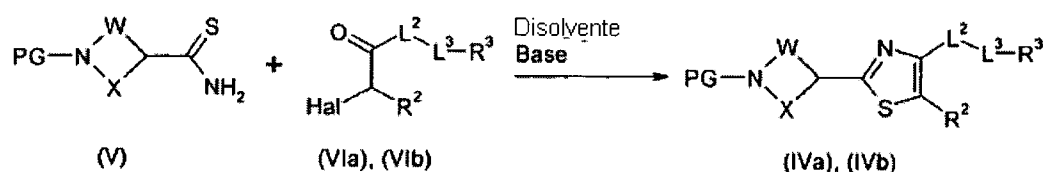
R^2 = hidrógeno, alquilo C_1 - C_2 o halogenoalquilo C_1 - C_2 ,

L^2 = $-C\equiv C-$,

15 R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

W, X, L^3 y R^3 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (i) Reacción de tioamidas de fórmula (V) con compuestos de fórmula (VIa) o (VIb) dando compuestos de fórmulas (IVa) o (IVb), en presencia de una base y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 9):



siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-

5 C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

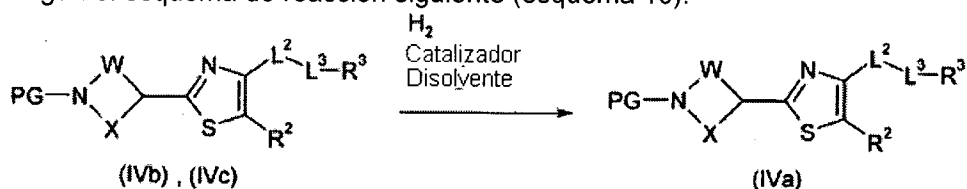
Hal = Cl, Br o I,

L² = -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- para compuestos con la fórmula (IVa) y (VIa),

L² = -CR⁹=CR⁹- para compuestos con la fórmula (IVb) y (VIb),

W, X, L³, R², R³, R⁸ y R⁹ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

10 (j) Reacción de compuestos de fórmulas (IVb) o (IVc) dando compuestos de fórmula (IVa) en presencia de hidrógeno, de un catalizador y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 10):



siendo

15 PG = acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

L² = -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- para compuestos con la fórmula (IVa),

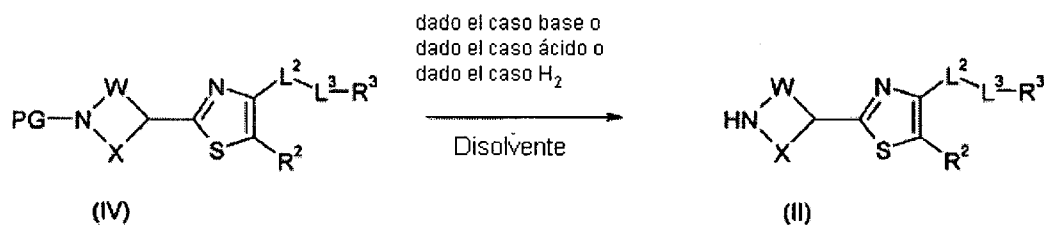
L² = -CR⁹=CR⁹- para compuestos con la fórmula (IVb),

L² = -C≡C- para compuestos con la fórmula (IVc),

W, X, L³, R², R³, R⁸ y R⁹ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

20 (k) Reacción de compuestos de fórmula (IV) dando compuestos de fórmula (II) dado el caso en presencia de un disolvente así como 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 según el esquema de reacción siguiente (esquema 11):

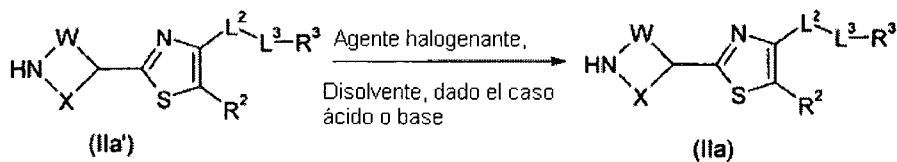


siendo

5 PG = acetilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

W, X, L², L³, R², y R³ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(l) Reacción de compuestos de fórmula (IIa') dando compuestos de fórmula (IIa) en presencia de un agente halogenante, dado el caso en presencia de un ácido y de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 12):



10

siendo

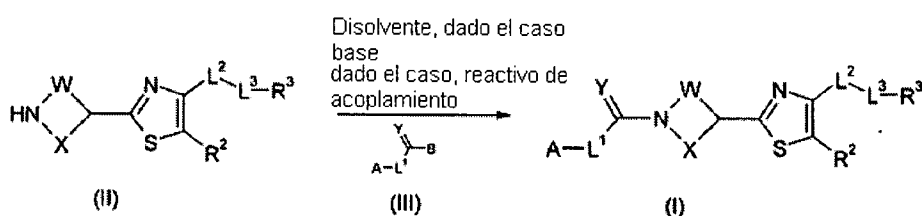
L² = -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂-,

R² = I, Br o Cl para compuestos con la fórmula (IIa),

R² = hidrógeno para compuestos con la fórmula (IIa'),

15 W, X, L³, R³ y R⁸ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(m) Reacción de compuestos de fórmula (III) con compuestos de fórmula (II) dando compuestos de fórmula (I) dado el caso en presencia de un reactivo de acoplamiento, de una base y de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 13):



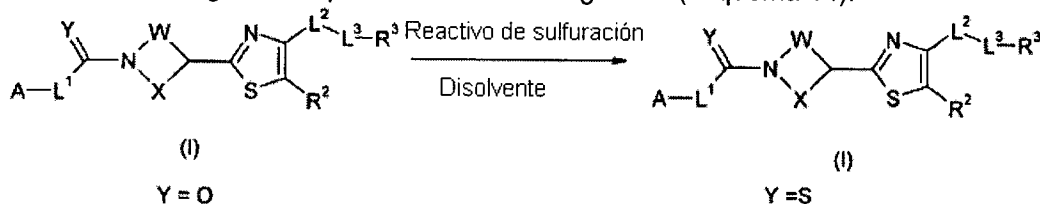
siendo

B = OH, cloro, bromo o yodo,

Y = oxígeno,

5 A, W, X, L¹, L², L³, R², y R³ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

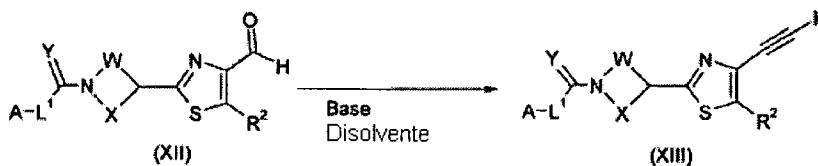
(n) Reacción de compuestos de fórmula (I) dando compuestos de fórmula (I) en presencia de un reactivo de sulfuración y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 14):



10 siendo

A, W, X, L¹, L², L³, R² y R³ como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(o) Reacción de aldehidos de fórmula (XII) dando alquinos de fórmula (XIII) en presencia de una base y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 17):



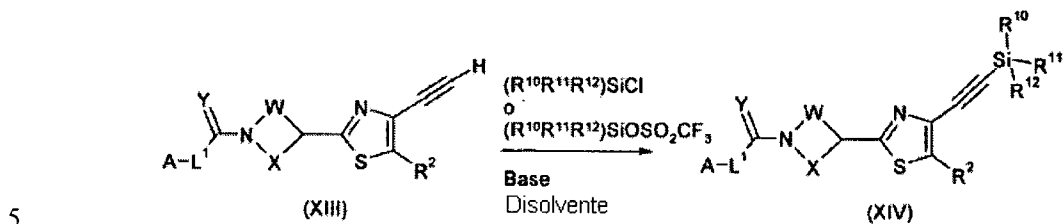
15

siendo

A, W, X, Y, L¹ y R² como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(p) Reacción de alquinos de fórmula (XIII) con un cloruro de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiCl

o triflato de trialquilsililo $(R^{10}R^{11}R^{12})SiOSO_2CF_3$, u otros reactivos de sililación conocidos en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (XIV) según el esquema de reacción siguiente (esquema 18):



siendo

R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

A , W , X , Y , L^1 y R^2 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(q) Reacción de alquinos de fórmula (XIII) con un halogenuro de R^3-L^3 en una reacción de acoplamiento C-C dado el caso catalizada en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (Ic) según el esquema de reacción siguiente (esquema 19):



siendo

15 $Hal = Cl, Br$ o I ,

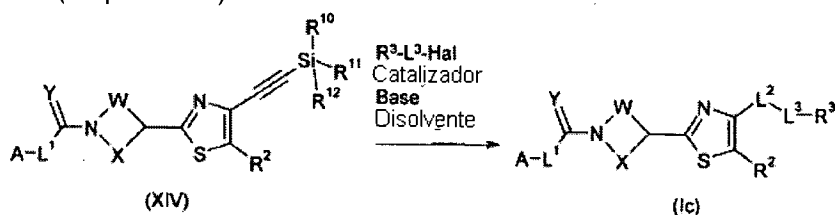
$L^2 = -C\equiv C-$,

A , W , X , Y , L^1 , L^3 , R^2 y R^3 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(r) Reacción de alquinos de fórmula (XIV) con un compuesto R^3-L^3-Hal dado el caso en presencia de un catalizador en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (Ic) según el esquema de reacción

20

siguiente (esquema 20):



siendo

Hal = Cl, Br o I,

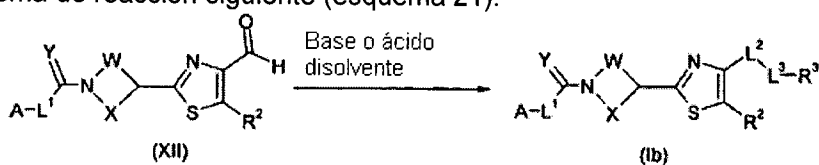
5 $L^2 = -C=C-$,

R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 y R^3 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(s) Reacción de aldehídos de fórmula (XII) dando compuestos de fórmula (Ib) en presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 21):

10

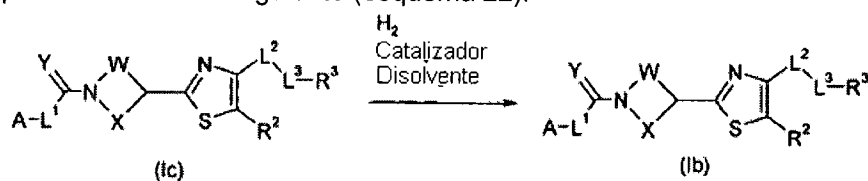


siendo

$L^2 = -CR^9=CR^9-$,

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

15 (t) Reacción de compuestos de fórmulas (Ic) dando compuestos de fórmula (Ib) en presencia de hidrógeno, de un catalizador y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 22):



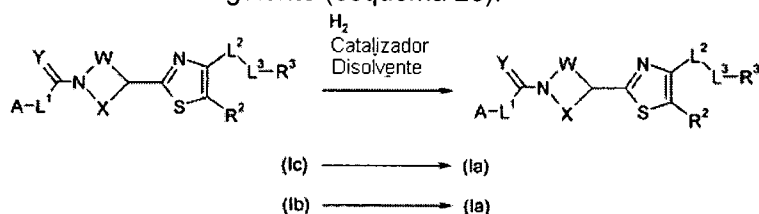
siendo

$L^2 = -CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (lb),

$L^2 = -C\equiv C-$ para compuestos con la fórmula (lc),

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (u) Reacción de compuestos de fórmulas (lb) o (lc) dando compuestos de fórmula (la) en presencia de hidrógeno, de un catalizador y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 23):



siendo

$L^2 = -C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ para compuestos con la fórmula (la),

- 10 $L^2 = -CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (lb),

$L^2 = -C\equiv C-$ para compuestos con la fórmula (lc),

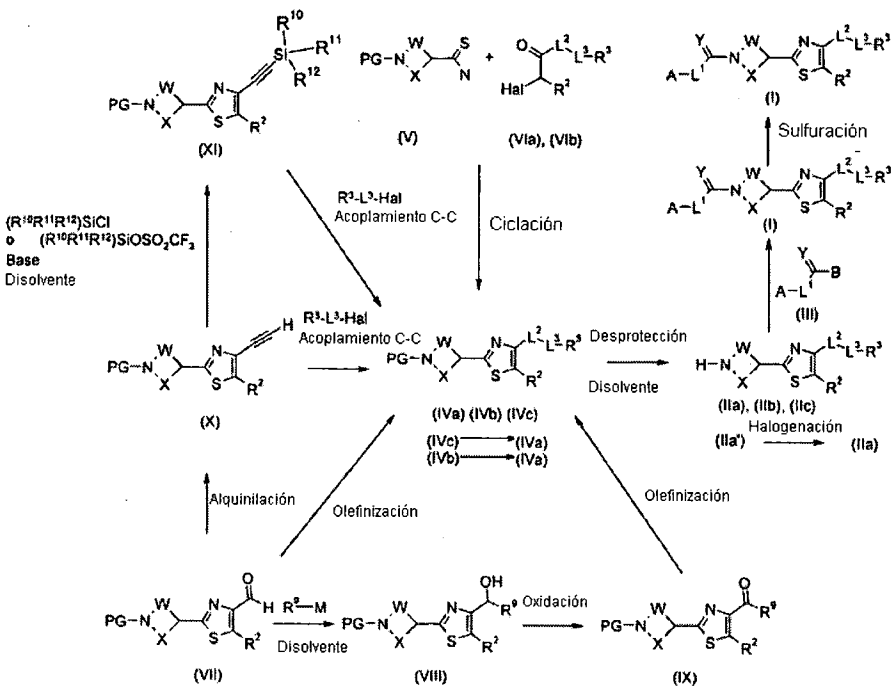
A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 , R^8 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

Se representa una visión general de las rutas de síntesis en los esquemas 15 y 24.

- Un compuesto de fórmula general (V) se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VIa) o (VIb), para obtener un compuesto cíclico de fórmula (IVa) o (IVb) (esquema 9). Otra posibilidad para preparar compuestos de fórmula (IV) es comenzar con compuestos de fórmula (VII). Estos se pueden someter a una reacción con un sustrato de fórmula general R^9-M (esquema 1). Se forma un alcohol secundario de fórmula (VIII) que se oxida a continuación, formándose un compuesto de fórmula (IX) (esquema 2). Se somete un compuesto de fórmula (VII) o (IX) a una olefinación para sintetizar un compuesto de fórmula (IVb) (esquema 3 y esquema 4). Otra posible ruta para preparar compuestos de fórmula (IV) comienza igualmente con un compuesto de fórmula (VII). Se alquiniila un compuesto de fórmula (VII) para sintetizar un alquino terminal de fórmula

general (X) (esquema 5). Una reacción de acoplamiento C-C catalizada con metal de transición de un compuesto de fórmula (X) con un halogenuro de fórmula R^3-L^3-Hal da un compuesto de fórmula (IVc) (esquema 6). Se puede proveer también un compuesto de fórmula (X) con un grupo sililo, lo que conduce a un compuesto de fórmula (XI) (esquema 7). Este se somete luego a una reacción de acoplamiento catalizada con metal de transición y en concreto con un sustrato de fórmula general R^3-L^3-Hal , para sintetizar un compuesto de fórmula (IVc) (esquema 8). Los enlaces dobles y triples de un compuesto de fórmula (IVb) y (IVc) se pueden hidrogenar con hidrógeno dando un compuesto de fórmula (IVa) (esquema 10). El grupo protector de un compuesto de fórmula (IV), que se caracteriza por PG, se separa luego de modo que se forma un compuesto de fórmula (II) o la sal correspondiente (esquema 11). Se puede halogenar un compuesto de fórmula (IIa') de modo que se forma un compuesto de fórmula (IIa) (esquema 12). Se acopla un compuesto de fórmula (II) o una sal correspondiente con un sustrato de fórmula (III), con lo que se puede sintetizar un compuesto de fórmula (I) (esquema 13). Se adiciona a un compuesto de fórmula (I) un reactivo de sulfuración para generar un compuesto de fórmula (I) (esquema 14).

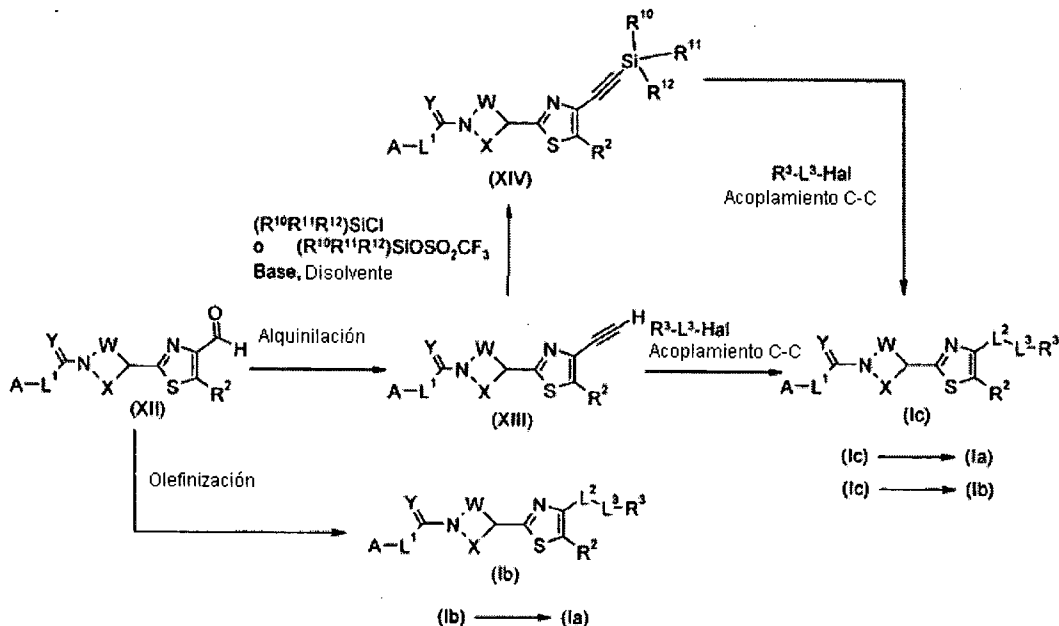
Esquema 15



Otra ruta posible para preparar compuestos de fórmula (I) comienza con un compuesto de fórmula (XII) (esquema 24). Se alquiniila un compuesto de fórmula (XII) para sintetizar un alquino terminal de fórmula general (XIII) (esquema 17). Una reacción de acoplamiento C-C catalizada por metal de transición de un compuesto de fórmula (XIII) con un halogenuro de fórmula R^3-L^3-Hal da un compuesto de fórmula (Ic) (esquema 19). Se puede proveer un compuesto de fórmula (XIII) también con un grupo sililo, lo que conduce a un compuesto de fórmula (XIV) (esquema 18). Este se somete luego a una reacción de acoplamiento catalizada con metal de transición, y concretamente con un sustrato de fórmula general R^3-L^3-Hal , para sintetizar un compuesto de fórmula (Ic) (esquema 20). Se somete un compuesto de fórmula (XII) a una olefinización para sintetizar un compuesto de fórmula (Ib) (esquema 21). El enlace triple de un compuesto de fórmula (Ic) se puede hidrogenar con hidrógeno dando un compuesto de fórmula (Ib) (esquema 22). Se pueden hidrogenar los enlaces dobles y triples de un compuesto de

fórmula (Ib) y (Ic) con hidrógeno dando un compuesto de fórmula (Ia) (esquema 23).

Esquema 24



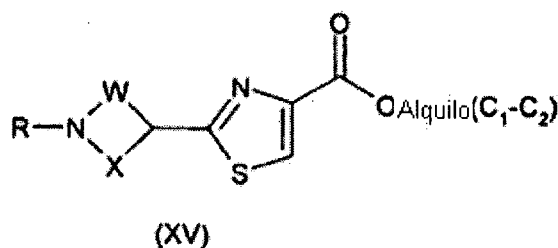
Se muestra en el esquema 1 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (VIII) a partir del compuesto (VII).

Se preparan productos de partida de fórmula (VIII) a partir del aldehído (VII) mediante adición de un reactivo organometálico R^9-M (por ejemplo $M = Mg, Li$). Se prefiere preparar los alcoholes (VIII) mediante adición de un reactivo de Grignard R^9-MgX ($X = Cl, Br, o I$) dando compuestos (VII) en tetrahidrofurano a $-78^\circ C$, y en concreto en atmósfera inerte (véase por ejemplo WO 07/039177).

El aldehído (VII) se encuentra comercialmente disponible (por ejemplo, en Maybridge) o se puede preparar a partir de precursores que se pueden adquirir en el mercado según prescripciones descritas en la bibliografía. El aldehído (VII) se sintetiza por ejemplo a partir del éster metílico o etílico (XV) correspondiente mediante reducción con hidruro de litio y aluminio en tetrahidrofurano a $0^\circ C$ y luego mediante oxidación del alcohol correspondiente con reactivo de Dess Martin a temperatura ambiente en

diclorometano (véanse por ejemplo, los documentos WO 07/147336 y WO 07/039177 para la reducción con hidruro de litio y aluminio y *J. Am. Chem. Soc.* 1978, 100, 300-301; 1979, 101, 5294-5299; 1991, 113, 7277-7287 para la oxidación con reactivo de Dess Martin).

5 **Figura 1**



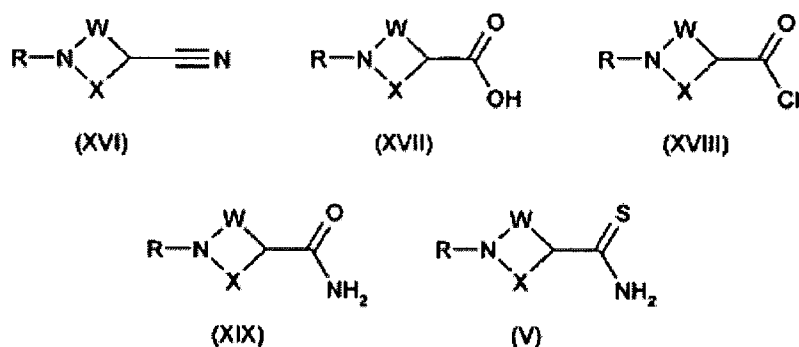
con

R = H o grupos protectores de amino lábiles en ácido, como por ejemplo t-butoxicarbonilo (tBoc) o benciloxicarbonilo (Cbz) o un grupo protector de bencilo, como, por ejemplo, bencilo (Bn).

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

Los ésteres metílicos o etílicos (XV) son conocidos y se pueden preparar a partir de precursores que se pueden adquirir comercialmente según prescripciones descritas en la bibliografía, por ejemplo, a partir de nitrilos de fórmula (XVI), ácidos carboxílicos de fórmula (XVII), cloruros de ácido carboxílico de fórmula (XVIII), amidas de fórmula (XIX) o tíoamidas de fórmula (V) (figura 2). Un procedimiento preferido es la síntesis de tiazol de Hantzsch. Partiendo de (V) y de halopiruvato de etilo o metilo que se adquiere en el mercado en etanol o en N,N-dimetilformamida en presencia de, por ejemplo, trietilamina a temperatura ambiente (ejemplos, véase el documento WO 07/014290 y las referencias ahí citadas).

Figura 2



con

R = H o grupos protectores de amino lábiles en ácido, como por ejemplo t-butoxicarbonilo (tBoc) o benciloxicarbonilo (Cbz) o un grupo protector de bencilo, como, por ejemplo, bencilo (Bn).

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

Se muestra en el esquema 2 una posibilidad para preparar el intermedio (IX) a partir del compuesto (VIII).

Se preparan compuestos de fórmula (IX) mediante oxidación del alcohol (VIII). En la bibliografía se encuentran múltiples procedimientos para la síntesis de cetonas a partir de alcoholes secundarios (véase "Oxidation of Alcohols to Aldehydes and Ketones". Gabriel Tojo, Marcos Fernández, Springer Berlín, 2006, 1-97, y la bibliografía ahí citada). Se prefiere llevar a cabo la oxidación en condiciones Swern o con peryodinano de Dess-Martin (véase, por ejemplo, *J. Am. Chem. Soc.* 1978, 100, 300-301). Se tienen en cuenta todos los disolventes que no son oxidados por oxidantes como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo o acetonitrilo, dado el caso en presencia de un coadyuvante de reducción, por ejemplo de un ácido (por ejemplo ácido sulfúrico o ácido clorhídrico) o también bases (por ejemplo, trietilamina o piridina).

Una posibilidad para obtener el intermedio (IX) a partir del compuesto (VIII) es, por ejemplo, con peryodinano de Dess-Martin (al 15% en diclorometano, disponible

comercialmente, por ejemplo, en la compañía Acros).

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, 5 tetracloruro de carbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo), ésteres de ácido carboxílico (por ejemplo, acetato de etilo), amidas (por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona y agua y la reacción 10 se puede llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes.

Los materiales de partida se usan en cantidades equimolares, pero el oxidante se puede usar, en caso de necesidad, también en exceso. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 100° C y preferiblemente a temperatura ambiente, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. 15 El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separa el compuesto (IX) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se 20 pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

Se muestra en los esquemas 3 y 4 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (IVb) a partir del compuesto (IX) o (VII).

Se transforman cetonas de fórmula (IX) o aldehídos de fórmula (VII) en (IVb) (Z) o (E), por ejemplo, mediante una olefinación de Wittig o de Horner-Wadsworth-Emmons 25 (véase, por ejemplo, *Chem. Rev.* 1989, 89, 863-927 y las referencias ahí citadas) o, por

ejemplo, olefinación de Julia (véase, por ejemplo, *Tetrahedron Lett.*, 1973, 14, 4833-4836) o, por ejemplo, mediante una olefinación de Peterson (véase, por ejemplo, *J. Org. Chem.* 1968, 33, 780). Se prefiere llevar a cabo la olefinación en condiciones de Wittig o de Horner-Wadsworth-Emmons.

- 5 Los reactivos como sales de fosfonio y reactivos de fosfonato bien se pueden adquirir comercialmente o bien se pueden obtener según formas descritas en la bibliografía (véase, por ejemplo, "*The Chemistry of Organophosphorus Compounds*"; John Wiley & Sons, 1994, Volumen 3, 45-184, y la bibliografía ahí citada).

- 10 Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno), y la reacción se puede llevar a cabo en mezclas de dos o
15 más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son tetrahidrofurano y tolueno.

- Como bases se pueden usar aquellas se se usan normalmente en las reacciones de olefinización previamente citadas, por ejemplo, NaH, tBuOK, nBuLi, (véase, por ejemplo, *Rev.* 1989, 89, 863-927 y las referencias ahí citadas). Como ácidos se tienen en cuenta los que se pueden usar normalmente en reacciones de olefinización, como por ejemplo
20 ácidos sulfónicos o ácido sulfúrico.

- Los materiales de partida se usan en cantidades equimolares, pero las sales de fósforo o fosfonatos se pueden usar, en caso de necesidad, también en exceso. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 100° C y preferiblemente de 0° C a 25° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la
25 mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción

y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (IVb) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

Se muestra en el esquema 5 una posibilidad de preparar el producto intermedio (X) a partir del compuesto (VII).

En la bibliografía se conoce que la alquilación de aldehídos se puede conseguir mediante una reacción de Corey-Fuchs (*Tetrahedron Lett.* 1972, 36, 3769-3772) o una homologización de Seyferth-Gilbert (véase, por ejemplo, *J. Org. Chem.*, 1996, 61, 2540-2541). De forma alternativa el alquino (X) se puede preparar también a partir del aldehído (VII) con reactivo de Bestmann-Ohira de forma análoga a las prescripciones de la bibliografía (véase, por ejemplo, *Synthesis* 2004, 1, 59-62).

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono) e hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno), y la reacción se puede llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son tetrahidrofurano y tolueno.

En la reacción se pueden usar todas las bases conocidas, pero se usan preferiblemente óxidos, hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos. Se debe añadir al menos un equivalente de la base al reactivo de Bestmann-Ohira y en caso de necesidad se puede usar en exceso.

Los materiales de partida se usan en cantidades equimolares, pero el reactivo de Bestmann-Ohira se puede usar, en caso de necesidad, también en exceso. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 60° C y preferiblemente de 0° C a 40° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (VIc) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

De forma análoga al procedimiento descrito previamente se pueden sintetizar los compuestos (XIII) a partir de los compuestos (XII) correspondientes como se muestra en el esquema 17. El aldehído (XII) se puede preparar según prescripciones descritas en la bibliografía (véanse ejemplos en los documentos WO 08/013925, WO 08/013622 y referencias ahí citadas).

Se muestra en el esquema 6 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (IVc) a partir del compuesto (X).

Se puede obtener un compuesto de fórmula general (IVc) a partir de un alquino con la fórmula general (X) mediante un acoplamiento cruzado catalizado con paladio de forma análoga a las prescripciones descritas en la bibliografía (véase, por ejemplo, *J. Am. Chem. Soc.* 2003, 125, 13642-13643, *Synlett.* 2006, 18, 2941-2946), y concretamente se hace reaccionar con uso de un halogenuro de fórmula R^3-L^3-Hal , estando el halogenuro primario en presencia de un catalizador como, por ejemplo, $[(n-allyl)PdCl]_2$, $Pd(OAc)_2$, $PdCl_2(CH_3CN)_2$, $Pd(PPh_3)_4$ o $PdCl_2(PPh_3)_2$ así como dado el caso en presencia de otros

cocatalizadores como, por ejemplo, CuI , Cs_2CO_3 y cloruro de 1,3-bis(1-adamantil)imidazolio, por ejemplo, en una mezcla de disolventes de DMF y dietiléter de 0-80° C.

Se pueden adquirir comercialmente halogenuros de fórmula $\text{R}^3\text{-L}^3\text{-Hal}$ o se pueden
5 obtener mediante procedimientos conocidos de la bibliografía.

De forma alternativa se puede proveer el alquino terminal también con un grupo protector como, por ejemplo, mediante reacción con cloruro de bencilo en presencia de un catalizador de paladio (II) como, por ejemplo, $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ o $\text{PdCl}_2(\text{CH}_3\text{CN})_2$ y carbonato de cesio así como 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo, en tetrahidrofurano o
10 acetonitrilo a 0-80° C.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (IVc) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

De forma análoga al procedimiento descrito previamente se pueden sintetizar los
15 compuestos (Ic) a partir de compuestos (XIII) correspondientes como se muestra en el esquema 19.

Se muestra en el esquema 7 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (XI) a partir del compuesto (X).

Para formar un enlace directo entre el enlace triple (L^2 es $-\text{C}\equiv\text{C}-$) y R^3 , puede ser
20 necesario sililar el alquino terminal antes de la reacción de acoplamiento catalizada con paladio. La sililación de los alquinos terminales se lleva a cabo con uno de los procedimientos de sililación conocidos para alquinos terminales como, por ejemplo, mediante adición al alquino terminal de una base (como, por ejemplo, hexametildisilazida
25 de litio) a -78° C en un disolvente aprótico polar y la recogida del producto intermedio

resultante, por ejemplo, con un halogenuro o triflato de sililo (*CHEMBIOCHEM*, 2001, 1, 69-75).

Como disolventes se tienen en cuenta a este respecto todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono) e hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno). La reacción se puede llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son tetrahidrofurano y tolueno.

Se pueden usar todas las bases conocidas, pero preferiblemente se usan para la reacción disilazida de litio, sodio y potasio y diisopropilamida de litio. Se debe añadir al menos un equivalente de la base al alquino de fórmula general (X) y en caso de necesidad se puede usar en exceso.

Se usan al menos un equivalente de cloruro de sililo o triflato de sililo como fuente del grupo sililo en la reacción.

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de -78°C a 100°C y preferiblemente de -20°C a 40°C , pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (XI) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

De forma análoga al procedimiento descrito previamente se pueden sintetizar los compuestos (XIV) a partir de compuestos correspondientes (XIII) como se muestra en el esquema 18.

Se muestra en el esquema 8 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio
5 (IVc) a partir del compuesto (XI).

Se puede preparar un compuesto de fórmula general (IVc) a partir de un alquino con la fórmula general (XI) mediante reacciones de acoplamiento catalizadas con paladio como, por ejemplo, la reacción de Sonogashira (*J. Med. Chem.* 2006, 49, 1080-1110), presentando el halogenuro la fórmula general halogenuro de R^3-L^3 , en la que L^3 es un
10 enlace directo.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo,
15 tetracloruro de carbono), ésteres de ácidos carboxílicos (por ejemplo, acetato de etilo), amidas (por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), dimetilsulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona y agua y la reacción se puede llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. El disolvente preferido es N,N-dimetilformamida.

La reacción debería realizarse en presencia de los siguientes aditivos: trietilamina
20 (al menos un equivalente referido al compuesto (XI)), yoduro de cobre (I) (al menos 0,1 equivalentes respecto al compuesto (XI)) y una fuente de fluoruro como, por ejemplo, fluoruro de tetra-n-butilamonio (al menos 1 equivalente referido al compuesto (XI) o un ligero exceso).

Se pueden usar en la reacción múltiples catalizadores de paladio (0) que se
25 adquieren comercialmente, pero se prefiere usar en la reacción

tetraquistrifenilfosfinpaladio (Aldrich). La cantidad de uso de catalizador es al menos de 1% hasta un exceso en función del compuesto de partida (XI).

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 25° C a 120° C y preferiblemente de 70° C a 90° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (IVc) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

De forma análoga al procedimiento descrito previamente se pueden sintetizar los compuestos (Ic) a partir de compuestos correspondientes (XIV) como se muestra en el esquema 20.

Se muestra en el esquema 9 una posibilidad para la síntesis de compuestos de fórmula (IVa) o (IVb).

Las tiocarboxamidas (V) pueden estar disponibles comercialmente o bien se pueden obtener según procedimientos de la bibliografía, por ejemplo, mediante sulfuración de la carboxamida correspondiente adquirida comercialmente con uso, por ejemplo, de reactivo de Lawesson (*Org. Synth.* vol. 7, 1990, 372) a temperatura ambiente en una mezcla de cloroformo/dimetoxietano (1/2,5). A este respecto PG representa un grupo protector como se define en el esquema 2.

Las α -halocetonas (VIa) y (VIb) bien se encuentran comercialmente disponibles o bien se pueden obtener según procedimientos conocidos de la bibliografía (véanse ejemplos en *Molecules*, 2003, 8, 793-865). De forma alternativa se pueden preparar

enolatos o sililenoléteres que se prepararon a partir de (XIIa) o (XIIb), reaccionando con una fuente de halógeno dando α -halocetonas (VIa) o (VIb), (*J. Med. Chem.* 2006, 49, 7877-7886; *J. Med. Chem.* 2006, 49, 1080-11 10; *Org. Synth.* vol. 6, 1988, 175; *Org. Synth.* vol. 53, 1973, 111). (Esquema 16)

5

Esquema 16



en el esquema 16,

Hal = Cl, Br o I,

$\text{L}^2 = -\text{C}(\text{R}^8)_2-\text{C}(\text{R}^8)_2-$ para compuestos con la fórmula (VIa) y (XIIa),

10 $\text{L}^2 = -\text{CR}^9=\text{CR}^9-$ para compuestos con la fórmula (VIb) y (XIIb),

$\text{L}^3, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^8$ y R^9 son como se definen anteriormente para la fórmula (I).

Los tiazoles (IVa) o (IVb) se obtienen mediante una síntesis de tiazol de Hantzsch a partir de las tiocarboxamidas (V) y α -halocetonas (VIa) o (VIb) (véase, por ejemplo, "Comprehensive Heterocyclic Chemistry", Pergamon Press, 1984; vol 6, páginas 235-
15 363, "Comprehensive Heterocyclic Chemistry II", Pergamon Press, 1996; vol 3, páginas 373-474 y referencias ahí citadas, y el documento WO 07/014290).

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano),
20 hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), 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 llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son N,N-dimetilformamida y etanol.

- 5 Dado el caso se usa una base adyuvante como, por ejemplo, trietilamina.

Los materiales de partida se usan en cantidades equimolares. Pero (V) o (VI) se pueden usar también respectivamente en exceso. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 100° C y preferiblemente a temperatura ambiente, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción.

- 10 El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

- 15 Se muestra en el esquema 10 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (IVa) a partir del compuesto (IVb) o (IVc).

- Un enlace se transforma triple o un enlace doble mediante una hidrogenación con uso de un catalizador adecuado en un enlace simple. Se selecciona un catalizador para la reacción del esquema 10 de los catalizadores conocidos en la bibliografía para la hidrogenación ("*Reductions in Organic Chemistry*", Milos Hudlicky, John Wiley & Sons, 1984), como por ejemplo paladio sobre carbón activo o catalizador de Pearlmans (Pd(OH)₂ sobre carbón activo). Mediante el uso de un catalizador de este tipo se puede preparar un compuesto de fórmula (IVa) a partir de un compuesto de fórmula (IVb) o (IVc).

- 25 Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las

condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano, dimetoxietano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), 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 llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son N,N-dimetilformamida y etanol.

La cantidad de catalizador usada se encuentra en 0,1 a 90% en moles referido al compuesto de partida, preferiblemente se usan de 1 a 30% en moles del catalizador referido al compuesto de partida. La reacción se puede llevar a cabo en sobrepresión (de 100 a 100000 kPa) o preferiblemente a presión atmosférica. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 150° C y preferiblemente a temperatura ambiente, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 72 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (IVa) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en las siguientes etapas sin purificación previa.

Se muestra en el esquema 11 una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (II) a partir de los compuestos correspondientes (IV).

Un compuesto se transforma de fórmula general (IV) en un compuesto

correspondiente de fórmula general (II) mediante procedimientos adecuados para la separación de grupos protectores que se describen en la bibliografía ("*Protective Groups in Organic Synthesis*"; tercera edición; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; 494-653, y bibliografía ahí citada).

- 5 Se pueden separar grupos protectores de t-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo en medio ácido (por ejemplo con ácido clorhídrico o el ácido trifluoroacético). Los grupos protectores de acetilo se pueden separar en condiciones básicas (por ejemplo, con carbonato de potasio o carbonato de cesio). Se pueden separar grupos protectores bencílicos hidrogenolíticamente con hidrógeno en presencia de un catalizador (por
- 10 ejemplo paladio sobre carbono activo).

- Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxanos), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos
- 15 halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), 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
- 20 llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes.

- 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 se describen en la bibliografía (por ejemplo, "*Protective Groups in Organic Synthesis*"; tercera edición; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; S.
- 25 494-653).

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 150° C y preferiblemente a temperatura ambiente, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre una media hora y 72 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (II) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o si se desea también en la siguiente etapa se usan sin purificación previa. Además es posible aislar el compuesto de fórmula general (II) como sal, por ejemplo, como sal de ácido clorhídrico o de ácido trifluoroacético.

En el esquema 12 se muestra una posibilidad de sintetizar el producto intermedio (IIa) a partir del compuesto (II'a).

Se obtiene un compuesto de fórmula general (IIa) en la que $R^2 = \text{Cl, Br e I}$ a partir de un compuesto de fórmula general (II'a) con $R^2 = \text{H}$ mediante halogenación, véase por ejemplo Org. Lett., 2005, 7(2), 299-301; Angew. Chem., Int. Ed, 2004, 43(34), 4471-4475; Eur. J. Org. Chem., 2002, (13), 2126-2135.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno), 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 llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes.

Como fuente de halógeno se puede usar, por ejemplo, N-bromosuccinimida, N-clorosuccinimida, N-yodosuccinimida, bromuro de piridinio, bromo, yodo, o cloro.

- 5 Dado el caso se puede usar una base como, por ejemplo, diisopropilamida de litio o butillitio, para litiar la posición 5 del tiazol, antes de añadirse la fuente de halógeno electrófila.

La reacción se puede llevar a cabo dado el caso con un ácido como, por ejemplo, ácido acético, ácido sulfúrico, ácido bromhídrico o ácido clorhídrico.

- 10 Los materiales de partida y el agente halogenante se usan en cantidades equimolares. El agente halogenante se puede usar también en exceso. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 60° C y preferiblemente de 0° C a 30° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la
- 15 temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

- Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (II) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se
- 20 pueden usar dado el caso también en la siguiente etapa sin purificación previa.

Se muestra en el esquema 13 una posibilidad de sintetizar compuestos de fórmula (I), en la que Y = oxígeno, a partir de compuestos (II) correspondientes.

- Los halogenuros de ácido (III) (B = halógeno) o los ácidos carboxílicos correspondientes (III) (B = OH) se pueden adquirir comercialmente o se pueden sintetizar
- 25 mediante procesos descritos en la bibliografía. Además se puede sintetizar un sustrato de

fórmula general (III), con $B = Cl$, a partir del ácido correspondiente ($B = OH$) mediante cloración con uso de procesos conocidos de la bibliografía (por ejemplo *Tetrahedron* 2005, 61, 10827-10852, y bibliografía ahí citada).

Se puede sintetizar un compuesto de fórmula general (I) con $Y = O$ mediante una
5 reacción de acoplamiento de un compuesto de fórmula general (II) correspondiente con un sustrato de fórmula general (III) con $B = Cl$, dado el caso en presencia de un captador de ácido / base.

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

Se usa al menos un equivalente de un captador de ácido / una base (por ejemplo base de Hünig, trietilamina o captadores de ácido poliméricos que se pueden adquirir comercialmente) en relación al material de partida de fórmula general (II). Si el material
20 de partida es una sal se necesitan al menos dos equivalentes del captador de ácido.

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de $0^{\circ}C$ a $100^{\circ}C$ y preferiblemente de $20^{\circ}C$ a $30^{\circ}C$, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre
25 unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (I) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en la siguiente etapa sin purificación previa.

- 5 De forma alternativa se puede sintetizar un compuesto de fórmula (I), con $Y = O$ también a partir del compuesto correspondiente de fórmula general (II) con un sustrato de fórmula general (II) con $B = OH$ en presencia de un reactivo de acoplamiento de forma análoga a las prescripciones descritas en la bibliografía (por ejemplo, *Tetrahedron* 2005, 61, 10827-10852, y referencias ahí citadas).

- 10 Son reactivos de acoplamiento adecuados, por ejemplo, reactivos de acoplamiento de péptidos (por ejemplo, 1-etil-3-(30-dimetilamino)carbodiimida mezclada con 4-dimetilaminopiridina, 1-etil-3-(30-dimetilamino)carbodiimida mezclada con hidroxibenzotriazol, hexafluorofosfato de bromotri(pirrolidino)-fosfonio, 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluroniumhexafluorofosfato de metanaminio, etc.).

- 15 Se puede usar en la reacción dado el caso una base como, por ejemplo, trietilamina o base de Hünig.

- Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano),
20 hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), 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 llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos
25 disolventes. Los disolventes preferidos son N,N-dimetilformamida y diclorometano.

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 100° C y preferiblemente de 0° C a 30° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre
5 unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (I) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía o se pueden usar dado el caso también en la siguiente etapa sin purificación previa.

10 En el esquema 14 se muestra una posibilidad de sintetizar compuestos de fórmula (I), en la que Y = azufre a partir de compuestos (I) correspondientes, en la que Y es igual a oxígeno.

Como disolventes se pueden usar todos los disolventes habituales inertes en las condiciones de reacción como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol,
15 propanol), éteres cíclicos y acíclicos (por ejemplo, dietiléter, tetrahidrofurano, dioxano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono), hidrocarburos aromáticos halogenados (por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo), ésteres de ácido carboxílico (por ejemplo, acetato de
20 etilo) y amidas (por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida) y la reacción se puede llevar a cabo en mezclas de dos o más de estos disolventes. Los disolventes preferidos son cloroformo y 1,2-dimetoxietano.

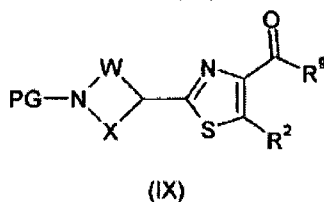
Reactivos de sulfuración adecuados son, por ejemplo, reactivo de Lawesson (véase *Tetrahedron* 1986, 42, 6555-6564, *Tetrahedron Lett.* 1993, 46, 7459-7462) y pentasulfuro
25 de fósforo. El material de partida y el reactivo de sulfuración se usan en cantidades

equimolares, pero el reactivo de sulfuración se puede usar también dado el caso en exceso.

La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0° C a 150° C y preferiblemente de 0° C a 100° C, pero se puede llevar a cabo también a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía en función de la magnitud de la reacción y de la temperatura de la reacción, pero se encuentra por lo general entre unos minutos y 48 horas.

Tras finalizar la reacción se separan los compuestos (I) de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. En caso de necesidad se purifican los compuestos mediante recristalización, destilación o cromatografía.

Son nuevos los compuestos de fórmula (IX),



en la que los símbolos tienen los siguientes significados

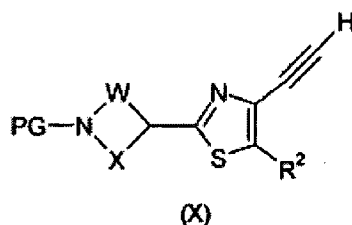
PG representa fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

R⁹ = alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,

W, X y R² tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Son nuevos los compuestos de fórmula (X),

68



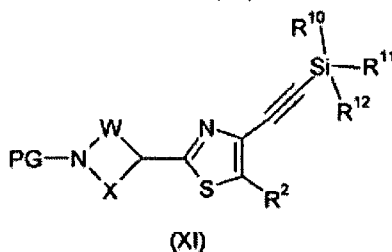
en la que los símbolos tienen los siguientes significados

PG representa fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi C₁-

5 C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

W, X y R² tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Son nuevos los compuestos de fórmula (XI),



10 en la que los símbolos tienen los siguientes significados

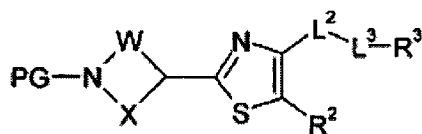
PG representa fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi C₁-

C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

R¹⁰, R¹¹ y R¹² = alquilo C₁-C₄ o fenilo,

15 W, X y R² tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Son nuevos los compuestos de fórmula (IV),



(IV)

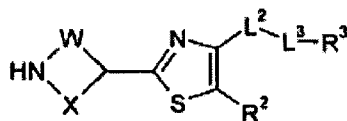
en la que los símbolos tienen los siguientes significados

PG representa fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi C₁-

5 C₄-carbonilo o benciloxycarbonilo,

W, X, L², L³, R², R³, R⁸ y R⁹ tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Son nuevos los compuestos de fórmula (IIb) y (IIc),



(IIb), (IIc)

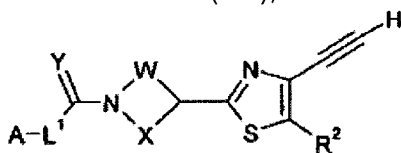
10 en la que los símbolos tienen los siguientes significados

L² representa $-CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (IIb)

L² representa $-C\equiv C-$ para compuestos con la fórmula (IIc)

W, X, L³, R², R³, y R⁹ tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

15 Son nuevos los compuestos de fórmula (XIII),



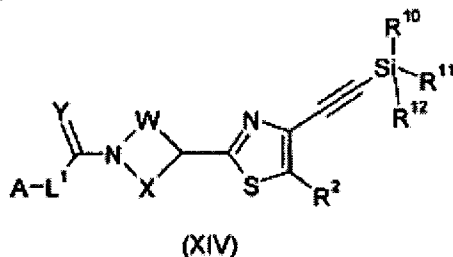
(XIII)

en la que los símbolos tienen los siguientes significados

A, W, X, Y y R² tienen los significados indicados anteriormente en general, preferidos,

especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Son nuevos los compuestos de fórmula (XIV),



en la que los símbolos tienen los siguientes significados

5 R^{10} , R^{11} y R^{12} representan alquilo C_1-C_4 o fenilo,

A, W, X, Y, L^1 y R^2 tienen los significados en la que, preferidos, especialmente preferidos o muy especialmente preferidos.

Los procedimientos de acuerdo con la invención para la preparación de compuestos de fórmula (I) se llevan a cabo preferiblemente con uso de uno o varios coadyuvantes de
10 reacción.

Como coadyuvantes de reacción se tienen en cuenta dado el caso bases inorgánicas u orgánicas habituales o aceptores de ácidos. A estos pertenecen preferiblemente acetatos, amidas, carbonatos, hidrogenocarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcanolatos de metales alcalinos o alcalinotérreos como, por ejemplo, acetato de sodio,
15 potasio o calcio, amida de litio, sodio, potasio o calcio, carbonato de sodio, potasio o calcio, hidrogenocarbonato de sodio, potasio o calcio, hidruro de litio, sodio, potasio o calcio, hidróxido de litio, sodio, potasio o calcio, metanolato, etanolato, n- o i-propanolato, n-, i-propanolato, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o potasio; adicionalmente también compuestos de nitrógeno orgánicos básicos como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina,
20 Ttripropilamina, tributilamina, etildiisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-

piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,2]-octano (DABCO), 1,5-diaza-bicyclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN), o 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU).

Los procedimientos de acuerdo con la invención se llevan a cabo preferiblemente con uso de uno o varios diluyentes. Como diluyentes se tienen en cuenta prácticamente todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen preferiblemente hidrocarburos alifáticos y aromáticos, dado el caso hidrocarburos halogenados como pentano, hexano, heptano, ciclohexano, éter de petróleo, gasolina diluyente, ligroína, benceno, tolueno, xileno, cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, éteres como dietil- y dibutiléter, glicodimetiléter y diglicodimetiléter, tetrahidrofurano y dioxano, cetonas como acetona, metil-etil-, metil-isopropil- o metil-isobutil-cetona, éteres como éster metílico o éster etílico del ácido acético, nitrilos como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo, amidas como, por ejemplo, dimetilformamida, di-metilacetamida y N-metil-pirrolidona, así como dimetilsulfóxido, tetrametilsulfona y triamida del ácido hexametilfosfórico y DMPU.

Las temperaturas de reacción se pueden variar en el procedimiento de acuerdo con la invención en un amplio intervalo. Por lo general se trabaja a temperaturas entre 0° C y 250° C, preferiblemente a temperaturas entre 10° C y 185° C.

Los procedimientos de acuerdo con la invención se llevan a cabo por lo general a presión normal. Sin embargo es también posible trabajar a presión elevada o reducida.

Para la realización del procedimiento de acuerdo con la invención se usan las respectivas sustancias de partida necesarias en general en cantidades aproximadamente equimolares. Sin embargo también es posible usar uno de los componentes respectivamente usados en un amplio exceso. El procesamiento se realiza en el procedimiento de acuerdo con la invención respectivamente según procedimientos

habituales (véanse los ejemplos de preparación).

Un objeto adicional de la invención se refiere al uso no médico de tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención para combatir microorganismos no deseados.

- 5 Un objeto adicional de la invención se refiere a un agente para combatir microorganismos no deseados, que comprende al menos un tiazol sustituido con heterociclilo según la presente invención.

Además la invención se refiere a un procedimiento para combatir microorganismos no deseados, caracterizado porque los tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo
10 con la invención se aplican sobre los microorganismos y/o en su hábitat.

Además la invención se refiere a una semilla que se trató con al menos un tiazol sustituido con heterociclilo de acuerdo con la invención.

Un último objeto de la invención se refiere a un procedimiento para la protección de semilla frente a microorganismos no deseados con uso de una semilla tratada con al
15 menos un tiazol sustituido con heterociclilo según la presente invención.

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

Los tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención de fórmula (I)
20 poseen muy buenas propiedades fungicidas y se pueden usar en la protección de plantas, por ejemplo, para combatir *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* y *Deuteromycetes*.

En la protección de plantas se pueden usar bactericidas para combatir *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* y *Streptomyetaceae*.

25 Los agentes fungicidas de acuerdo con la invención se pueden usar curativa o

protectoramente para combatir hongos fitopatógenos. La invención se refiere por tanto a procedimientos curativos y protectores para combatir hongos fitopatógenos con el uso de principios activos o agentes de acuerdo con la invención, que se aplican sobre la semilla, la planta o partes de planta, los frutos o el suelo en el que crecen las plantas.

- 5 Los agentes de acuerdo con la invención para combatir hongos fitopatógenos en protección de plantas comprenden una cantidad efectiva, pero no fitotóxica, de los principios activos de acuerdo con la invención. "Cantidad efectiva, pero no fitotóxica" significa una cantidad de los agentes de acuerdo con la invención que es suficiente por un lado para controlar satisfactoriamente o eliminar completamente la enfermedad
- 10 fúngica de la planta y que por otro lado no conduce a síntoma notorio alguno de fitotoxicidad. Esta cantidad aplicada se puede variar en general en un intervalo mayor. Depende de varios factores, por ejemplo, los hongos que se van a combatir, la planta, las condiciones climáticas, y en los compuestos activos de los agentes de acuerdo con la invención.
- 15 De acuerdo con la invención, se pueden tratar todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entiende, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de crianza y optimización convencionales o mediante
- 20 procedimientos biotecnológicos y de tecnología genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las especies de plantas protegibles por el derecho de protección de variedades o las variedades de plantas no protegibles. Por partes de planta debe entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, citándose por ejemplo hojas, agujas,
- 25 tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y

rizomas. Pertenecen a las partes de planta también productos de cosecha así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

Como plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención se puede hacer
 5 mención a las siguientes: algodón, lino, vid, frutas, verduras como *Rosaceae sp.* (por ejemplo, frutas de pepita tales como manzanas y peras, pero también frutas de hueso tales como albaricoques, fresas, almendras y melocotones, 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
 10 ejemplo, bananos y plantaciones de bananos), *Rubiaceae sp.* (por ejemplo, café), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo, limones, naranjas y uvas); *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 y cebolla), *Papilionaceae sp.* (por
 15 ejemplo, guisantes); *Gramineae sp.* (por ejemplo, maíz, cereales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y tritical), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Brassicaceae sp.* (por ejemplo, repollo blanco, repollo rojo, brócoli, coliflor, coles de Bruselas, pak choi, colinabo, rábano así como también colza, nabina, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae sp.* (por ejemplo, cacahuetes y judías), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, soja),
 20 *Solanaceae sp.* (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga, remolacha roja), cultivos hortícolas y ornamentales; así como también homólogos de estos cultivos modificados genéticamente. Se prefiere tratar de acuerdo con la invención plantas de cereales.

A modo de ejemplo, pero de forma no limitativa, son de mencionar algunos agentes
 25 patógenos de enfermedades fúngicas que se pueden tratar de acuerdo con la invención:

enfermedades causadas por agentes patógenos de *Echten Mehltaus*, como, por ejemplo, por especies de *Blumeria*, como por ejemplo *Blumeria graminis*; especies de *Podosphaera*, como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*; especies de *Sphaerotheca*, como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*; especies de *Uncinula*, como por ejemplo

5 *Uncinula necator*,

enfermedades causadas por agentes patógenos de enfermedades de la roya como, por ejemplo, por especies de *Gymnosporangium*, como por ejemplo *Gymnosporangium sabinae*; especies de *Hemileia*, como por ejemplo *Hemileia vastatrix*; especies de *Phakopsora*, como por ejemplo *Phakopsora pachyrhizi* y *Phakopsora meibomiae*;

10 especies de *Puccinia*, como por ejemplo *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o *Puccinia striiformis*; especies de *Uromyces*, como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;

enfermedades causadas por agentes patógenos del grupo de oomicetos como, por ejemplo, por especies de *Albugo*, como, por ejemplo *Albugo Candida*; especies de *Bremia*, como por ejemplo *Bremia lactucae*; especies de *Peronospora*, como por ejemplo

15 *Peronospora pisi* o *P. brassicae*; especies de *Phytophthora*, como por ejemplo *Phytophthora infestans*; especies de *Plasmopara*, como por ejemplo *Plasmopara viticola*; especies de *Pseudoperonospora*, como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*; especies de *Pythium*, como por ejemplo *Pythium ultimum*;

enfermedades de la niebla seca y marchitamiento de hojas causadas, por ejemplo,

20 por especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria solani*; especies de *Cercospora*, como por ejemplo *Cercospora beticola*; especies de *Cladosporium*, como por ejemplo *Cladosporium cucumerinum*; especies de *Cochliobolus*, como por ejemplo *Cochliobolus sativus* (formas de conidios: *Drechslera*, Sin: *Helminthosporium*) o *Cochliobolus nivabeanus*; especies de *Colletotrichum*, como por ejemplo *Colletotrichum*

25 *lindemuthanum*; especies de *Cycloconium*, como por ejemplo *Cycloconium oleaginum*;

especies de *Diaporthe*, como por ejemplo *Diaporthe citri*; especies de *Elsinoe*, como por ejemplo *Elsinoe fawcettii*; especies de *Gloeosporium*, como por ejemplo *Gloeosporium laeticolor*; especies de *Glomerella*, como por ejemplo *Glomerella cingulata*; especies de *Guignardia*, como por ejemplo *Guignardia bidwelli*; especies de *Leptosphaeria*, como por ejemplo *Leptosphaeria maculans*; especies de *Magnaporthe*, como por ejemplo *Magnaporthe grisea*; especies de *Microdochium*, como por ejemplo *Microdochium nivale*; especies de *Mycosphaerella*, como por ejemplo *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* o *Mycosphaerella fijiensis*; especies de *Phaeosphaeria*, como por ejemplo *Phaeosphaeria nodorum*; especies de *Pyrenophora*, como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici*; especies de *Ramularia*, como por ejemplo *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*; especies de *Rhynchosporium*, como por ejemplo *Rhynchosporium secalis*; especies de *Septoria*, como por ejemplo *Septoria apii* o *Septoria lyscopersici*; especies de *Stagonospora*, como por ejemplo *Stagonospora nodorum*; especies de *Typhula*, como por ejemplo *Typhula incarnata*; especies de *Venturia*, como por ejemplo *Venturia inaequalis*;

enfermedades de las raíces y de los tallos causadas, por ejemplo, por especies de *Corticium*, como por ejemplo *Corticium graminearum*; especies de *Fusarium*, como por ejemplo *Fusarium oxysporum*; especies de *Gaeumannomyces*, como por ejemplo *Gaeumannomyces graminis*; especies de *Plasmodiophora*, como por ejemplo *Plasmodiophora brassicae*; especies de *Rhizoctonia*, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies *Sarocladium*, como por ejemplo *Sarocladium oryzae*; especies de *Sclerotium*, como por ejemplo *Sclerotium oryzae*; especies de *Tapesia*, como por ejemplo *Tapesia acuformis*; especies de *Thielaviopsis*, como por ejemplo *Thielaviopsis basicola*;

enfermedades de espigas y panículas (mazorcas de maíz inclusive) causadas, por ejemplo, por especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria spp.*; especies de

Aspergillus, como por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Cladosporium*, como por ejemplo *Cladosporium spp.*; especies de *Claviceps*, como por ejemplo *Claviceps purpurea*; especies de *Fusarium*, como por ejemplo *Fusarium culmorum*; especies de *Gibberella*, como por ejemplo *Gibberella zeae*; especies de *Monographella*, como por ejemplo *Monographella nivalis*; especies de *Stagonospora*, como por ejemplo *Stagonospora nodorum*;

enfermedades causadas por ustilaginales como, por ejemplo, por especies de *Sphacelotheca*, como por ejemplo *Sphacelotheca reiliana*; especies de *Tilletia*, como por ejemplo *Tilletia caries* o *Tilletia controversa*; especies de *Urocystis*, como por ejemplo *Urocystis occulta*; especies de *Ustilago*, como por ejemplo *Ustilago nuda*;

putrefacción de la fruta causada, por ejemplo, por especies de *Aspergillus*, como por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Botrytis*, como por ejemplo *Botrytis cinerea*; especies de *Penicillium*, como por ejemplo *Penicillium expansum* y *Penicillium purpurogenum*; especies de *Rhizopus*, como por ejemplo, *Rhizopus stolonifer*; especies de *Sclerotinia*, como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*; especies de *Verticillium*, como por ejemplo *Verticillium alboatrum*;

putrefacciones y marchitación de semillas, así como enfermedades de arbolitos, causadas, por ejemplo, por especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria brassicicola*; especies de *Aphanomyces*, como por ejemplo *Aphanomyces euteiches*; especies de *Aspergillus*, como por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Cladosporium*, como por ejemplo *Cladosporium herbarum*; especies de *Cochliobolus*, como por ejemplo *Cochliobolus sativus*; (forma de conidios: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*); especies de *Colletotrichum*, como por ejemplo *Colletotrichum coccodes*; especies de *Fusarium*, como, por ejemplo, *Fusarium culmorum*; especies de *Gibberella*, como por ejemplo *Gibberella zeae*; especies de *Macrophomina*, como por ejemplo *Macrophomina*

phaseolina; especies de *Microdochium*, como por ejemplo *Microdochium nivale*; especies de *Monographella*, como por ejemplo *Monographella nivalis*; especies de *Penicillium*, como por ejemplo *Penicillium expansum*; especies de *Phoma*, como por ejemplo *Phoma lingam*; especies de *Phomopsis*, como por ejemplo *Phomopsis sojae*; especies de

5 *Phytophthora*, como por ejemplo *Phytophthora cactorum*; especies de *Pyrenophora*, como por ejemplo *Pyrenophora graminea*; especies de *Pyricularia*, como por ejemplo *Pyricularia oryzae*; especies de *Pythium*, como por ejemplo *Pythium ultimum*; especies de *Rhizoctonia*, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Rhizopus*, como por ejemplo *Rhizopus oryzae*; especies de *Sclerotium*, como por ejemplo *Sclerotium rolfii*;

10 especies de *Septoria*, como por ejemplo *Septoria nodorum*; especies de *Typhula*, como por ejemplo *Typhula incarnata*; especies de *Verticillium*, como por ejemplo *Verticillium dahliae*;

enfermedades cancerígenas, agallas y excrecencias nudosas, causadas, por ejemplo, por especies de *Nectria*, como por ejemplo *Nectria galligena*;

15 enfermedades marchitantes causadas, por ejemplo, por especies de *Monilinia*, como por ejemplo *Monilinia laxa*;

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

20 enfermedades degenerativas de plantas leñosas causadas, por ejemplo, por especies de *Esca*, como por ejemplo *Phaemoniella clamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* y *Fomitiporia mediterranea*; especies de *Ganoderma*, como por ejemplo *Ganoderma boninense*;

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

25 como por ejemplo *Botrytis cinerea*;

enfermedades de bulbos de plantas causadas, por ejemplo, por especies de *Rhizoctonia*, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Helminthosporium*, como por ejemplo, *Helminthosporium solani*;

- 5 enfermedades causadas por agentes patógenos bacterianos, como por ejemplo especies de *Xanthomonas*, como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; especies de *Pseudomonas*, como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; especies de *Erwinia*, como por ejemplo *Erwinia amylovora*;

Preferiblemente se pueden combatir las siguientes enfermedades de la soja:

- 10 enfermedades fúngicas en hojas, tallos, vainas y semillas causadas, por ejemplo, por mancha foliar por *Alternaria* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), antracnosis (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), mancha parda (*Septoria glycines*), mancha foliar y añublo de la hoja por *Cercospora* (*Cercospora kikuchii*), añublo de la hoja por *Choanephora* (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), mancha foliar por *Dactuliophora* (*Dactuliophora glycines*), mildiu de la remolacha (*Peronospora* 15 *manshurica*), añublo por *Drechslera* (*Drechslera glycini*), mancha foliar de ojo de rana (*Cercospora sojae*), mancha foliar por *Leptosphaerulina* (*Leptosphaerulina trifolii*), mancha foliar por *Phyllosticta* (*Phyllosticta sojaecola*), añublo de la vaina y tronco (*Phomopsis sojae*), oidio de los cereales (*Microsphaera diffusa*), mancha foliar por *Pyrenochaeta* (*Pyrenochaeta glycines*), rizoctonia aérea, de follaje, y añublo de telaraña 20 (*Rhizoctonia solani*), roya (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), sarna (*Sphaceloma glycines*), añublo de la hoja por *Stemphylium* (*Stemphylium botryosum*), Target Spot (*Corynespora cassiicola*).

- enfermedades fúngicas en raíces y de la base del tallo causadas, por ejemplo, por podredumbre de la raíz negra (*Calonectria crotalariae*), podredumbre de carbón vegetal 25 (*Macrophomina phaseolina*), añublo o marchitamiento por *Fusarium*, podredumbre de la

raíz, y podredumbre de vaina y collar (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), podredumbre de la raíz por *Mycoleptodiscus* (*Mycoleptodiscus terrestris*), *Neocosmospora* (*Neocosmospora vasinfesta*), añublo de vaina y tronco (*Diaporthe phaseolorum*), cáncer de tronco (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora megasperma*), podredumbre parda del tronco (*Phialophora gregata*), podredumbre por *Pythium* (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), podredumbre de la raíz por *Rhizoctonia*, putrefacción del tronco, y enfermedad de los plantones (*Rhizoctonia solani*), putrefacción del tronco por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), añublo por *Sclerotinia Southern* (*Sclerotinia rolfsii*), podredumbre de la raíz por *Thielaviopsis* (*Thielaviopsis basicola*).

Los principios activos de acuerdo con la invención presentan también un efecto reforzante fuerte en plantas. Estas son adecuadas por tanto para la movilización de fuerzas de defensa propias de la planta frente a infestación por microorganismos no deseados.

Por sustancias de refuerzo de plantas (que inducen resistencia) se entiende a este respecto aquellas sustancias que pueden estimular el sistema defensivo de plantas de modo que las plantas tratadas en la inoculación subsiguiente con organismos no deseados desarrollan resistencia contra estos microorganismos.

Por microorganismos no deseados se entiende en el presente caso hongos fitopatógenos y bacterias. Las sustancias de acuerdo con la invención se pueden usar por tanto para proteger plantas en un periodo de tiempo deseado tras el tratamiento contra la infestación por los agentes patógenos dañinos citados. El periodo de tiempo dentro del cual se desarrolla esta protección se extiende en general de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días tras el tratamiento de las plantas con los principios activos.

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

A este respecto se pueden usar los principios activos de acuerdo con la invención
5 con éxito especialmente bueno para combatir enfermedades en cultivos de vino, frutales, patatas y verduras como, por ejemplo de forma particular contra hongos de Mildiu, oomicetos, como por ejemplo especies de *Phytophthora*, *Plasmopara*, *Pseudoperonospora* y *Pythium*.

Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados también para el
10 aumento del rendimiento de la cosecha. Estos son además de baja toxicidad y presentan una buena tolerancia por las plantas.

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar dado el caso en concentraciones o cantidades de aplicación determinadas también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las
15 plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Pueden utilizarse dado el caso también como insecticidas. Se pueden usar dado el caso también como productos intermedios o iniciales para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados por su buena
20 tolerancia por las plantas, toxicidad favorable en animales de sangre caliente y buena tolerancia ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, mejorar la calidad de los productos de cosecha en agricultura, en horticultura, en cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en
25 la protección de existencias y materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden

usar preferiblemente como agentes fitosanitarios. Son eficaces contra los tipos de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos de los estados de desarrollo.

El tratamiento de acuerdo con la invención de plantas y partes de planta con los principios activos o agentes se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, rociado, pulverización, regado, vaporización, espolvoreo, nebulización, dispersión, espumación, pintado, untado, vertido (empapado), riego por goteo y en material reproductivo, especialmente en semillas, además de desinfección en seco, desinfección en húmedo, incrustaciones, envolturas de una o varias capas y similares. Además también es posible aplicar los principios activos según los procedimientos de ultra-bajo volumen o inyectar el preparado de principio activo o propiamente el principio activo en el suelo.

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

Con materiales industriales se entiende en el presente contexto materiales inertes, que han sido producidos para el uso en la industria. Por ejemplo, pueden ser materiales industriales que se deberían proteger contra cambio o destrucción microbiana con los principios activos de acuerdo con la invención, adhesivos, pegamentos, papel y cartón, materiales textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de plástico, lubricantes refrigeradores y otros materiales que pueden ser infestados o destruidos por microorganismos. En el contexto de materiales que se deben proteger se encuentran también partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos de refrigeración que

se pueden ver perjudicados por la multiplicación de hongos y/o microorganismos. En el contexto de la presente invención son de mencionar como materiales industriales preferiblemente adhesivos, pegamentos, papel y cartón, cuero, madera, pinturas, lubricantes refrigeradores y líquidos de transmisión de calor, con particular preferencia

5 madera. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención pueden evitar efectos desventajosos como putrefacción, deterioro, dis- y decoloración o enmohecimiento.

El procedimiento de acuerdo con la invención para combatir hongos no deseados se puede usar también para la protección de los denominados artículos de almacén. A este

10 respecto con "artículos de almacén" se entiende sustancias naturales de origen vegetal o animal y sus formas procesadas, que se han tomado del ciclo de vida natural para los que se desea protección a largo plazo. Se pueden proteger artículos de almacén de origen vegetal, tales como plantas o partes de las mismas, por ejemplo, troncos, hojas, tubérculos, semillas, frutas, granos, en el estado recién cosechado o en forma procesada,

15 tal como (pre)secados, humedecidos, triturados, molidos, prensados o tostados. Artículos de almacén también comprenden madera, bien no procesada, tal como madera de construcción, postes de tendido eléctrico y barreras, o en la forma de productos acabados, como muebles. Artículos de almacén de origen animal son, por ejemplo, pellejos, cuero, pieles y cabellos. Los principios activos de acuerdo con la presente

20 invención pueden evitar efectos desventajosos tales como putrefacción, deterioro, dis- y decoloración o enmohecimiento.

Como microorganismos capaces de causar una degradación o un cambio de los materiales industriales, son de citar, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas u organismos mucilaginosos. Los principios activos de acuerdo con la invención actúan

25 preferiblemente contra hongos, particularmente mohos, hongos que decoloran la madera y

hongos que destruyen la madera (basidiomicetos) así como contra organismos mucilaginosos y algas. Se pueden citar microorganismos de los siguientes géneros como ejemplos: *Alternaria*, como *Alternaria tenuis*, *Aspergillus*, como *Aspergillus niger*, *Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*, *Coniophora*, como *Coniophora puetana*,
5 *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*, *Pseudomonas*, como *Pseudomonas aeruginosa*, y *Staphylococcus*, como *Staphylococcus aureus*.

10 La presente invención se refiere además a un agente para combatir microorganismos no deseados, que comprende al menos un tiazol sustituido con heterociclilo de acuerdo con la invención. Preferiblemente los agentes se tratan de agentes fungicidas que contienen agentes coadyuvantes, disolventes, vehículos, tensioactivos o extensores de uso en agricultura.

15 De acuerdo con la invención vehículo significa una sustancia natural o sintética, orgánica o inorgánica que se mezcla o combina con los principios activos para hacerlo más fácil de aplicar, especialmente para la aplicación a plantas o partes de plantas o semillas. El vehículo, que puede ser sólido o líquido, es en general inerte y debería ser adecuado para uso en agricultura.

20 Se tienen en cuenta como vehículos sólidos por ejemplo, sales de amonio y polvos minerales naturales como caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos minerales sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido y silicatos de aluminio; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra
25 pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y

orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta: por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como éster de ácido graso y polioxietileno, éteres de alcohol graso y polioxietileno, por ejemplo, 5 alquilaril-poliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina; como agentes de dispersión se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de alcohol-POE- y/o POP-éteres, ésteres de ácido y/o de POP- POE, alquil-aril- y/o POP- POE-éteres, aductos grasos y/o de POP- POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o azúcar, 10 sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los aductos de PO-éter correspondientes. Además de oligo- o polímeros adecuados, por ejemplo partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO sólo o en combinación con, por ejemplo, (poli)-alcoholes o (poli)-aminas. Además pueden ser de uso lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos 15 aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

Los principios activos se pueden transformar en las formulaciones habituales como soluciones, emulsiones, polvos humectables para pulverización, suspensiones basadas en agua o en aceite, polvos, productos en polvo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para dispersión, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias 20 naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

Los principios activos se pueden aplicar como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de estas, como soluciones, emulsiones, suspensiones basadas en agua o aceite, polvos, polvos para rociar, pastas, polvos 25 solubles, agentes para espolvorear, gránulos solubles, gránulos para dispersión,

concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas listos para uso. La aplicación se lleva a cabo de forma habitual, por ejemplo, mediante vertido, pulverización, atomización, dispersión, empolvado, espumación, pintado y similares. Es posible además aplicar los principios activos según el procedimiento de ultra-bajo volumen o inyectar el preparado de principio activo o el principio activo propiamente en el suelo. Se puede tratar también la semilla de las plantas.

Las formulaciones citadas se pueden preparar de forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los principios activos con al menos un extensor, disolvente o diluyente, emulsionante, dispersante y/o aglutinante o agente de fijación, humectante, repelente de agua, dado el caso agentes secantes y estabilizadores UV y dado el caso colorantes y pigmentos, antiespumantes, agentes conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas habituales así como otros coadyuvantes de procesamiento.

Los agentes de acuerdo con la invención no comprenden sólo formulaciones que ya están listas para uso y se pueden aplicar con un equipo adecuado sobre las plantas o la semilla, sino también concentrados comerciales que se deben diluir con agua antes del uso.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden presentar como tales o en sus formulaciones (comerciales) así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas en mezcla con otros principios activos (conocidos) como insecticidas, atractores, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas, fertilizantes, protectores o semioquímicos.

Como coadyuvantes pueden ser de uso aquellas sustancias que son adecuadas para conferir al propio agente y/o a preparaciones derivadas de este (por ejemplo,

líquidos de pulverización, desinfectantes de semillas) propiedades especiales, como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: extensores, disolventes y vehículos.

Como extensores son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de la clase de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbecenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que eventualmente pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidona) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

Por extensores o vehículos en forma de gas licuados se entiende aquellos líquidos que se encuentran en forma de gas a temperatura normal y a presión normal, por ejemplo, gases propelentes para aerosol, como hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

En el caso de uso de agua como extensor se pueden usar también, por ejemplo, disolventes orgánicos como coadyuvantes. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos, como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados, como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, alcoholes, como butanol o glicol así como sus éteres

y ésteres, cetonas, como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

Los agentes de acuerdo con la invención pueden contener adicionalmente otros
5 componentes, como por ejemplo sustancias tensioactivas. Como sustancias tensioactivas se tienen en cuenta agentes que generan emulsiones y/o espuma, agentes dispersantes o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas. Ejemplos de estos son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalilsulfónico,
10 policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferiblemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferiblemente tauratos de alquilo), ésteres de ácido fosfórico de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y
15 fosfatos, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de albúmina, lejías de lignina-sulfito y metilcelulosa. La presencia de una sustancia tensioactiva es ventajosa si uno de los principios activos y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y si se realiza la aplicación en agua. La proporción de sustancias tensioactivas se encuentra entre 5 y 40 por ciento en peso del
20 agente de acuerdo con la invención.

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

25 Otros aditivos pueden ser aromas, aceites minerales o vegetales dado el caso

modificados, ceras y sustancias nutrientes (también sustancias oligonutrientes), como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores como crioestabilizadores, conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la
5 estabilidad química y/o física.

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

Las formulaciones contienen en general entre 0,05 y 99% en peso, 0,01 y 98% en peso, preferiblemente 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 descritas previamente se pueden usar en un procedimiento de
15 acuerdo con la invención para combatir microorganismos no deseados, aplicando los tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención sobre los microorganismos y/o su hábitat.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar como tales en sus formulaciones, también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas,
20 nematocidas o insecticidas conocidos, para ampliar de este modo, por ejemplo, el espectro de actividad o superar los desarrollos de resistencias.

Como asociados de mezcla se tienen en cuenta, por ejemplo, fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas o también bactericidas conocidos (véase también Pesticide Manual, 13ª ed.).

25 También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos como

herbicidas o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, protectores o semioquímicos.

La aplicación se lleva a cabo en una de las formas habituales ajustas a las formas de aplicación.

La invención comprende además un procedimiento para el tratamiento de semilla.

5 Un aspecto más de la presente invención se refiere de forma particular a una semilla que se trata con al menos uno de los tiazoles sustituidos con heterociclilo de acuerdo con la invención. El material de semilla de acuerdo con la invención es de uso en procedimientos para la protección de semilla frente a hongos dañinos fitopatógenos. De este modo se usa una semilla tratada con al menos un principio activo de acuerdo con la
10 invención.

Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención son también adecuados para el tratamiento de semillas. Una gran parte del daño causado por los organismos dañinos en plantas de cultivo tiene lugar ya con la infestación de la semilla durante el almacenamiento o tras la siembra así como durante y tras la germinación de las plantas. Esta fase es
15 especialmente crítica ya que las raíces y brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso un pequeño daño ya puede conducir a la muerte de la planta. Por tanto existe un particular gran interés en proteger la semilla y la planta en germinación con el uso de agentes adecuados.

Se conoce desde hace tiempo combatir hongos dañinos fitopatógenos mediante el
20 tratamiento de la semilla de plantas y es objeto de mejoras continuas. No obstante resultan una serie de problemas en el tratamiento de semillas que no se pueden resolver siempre de forma satisfactoria. De este modo es deseable desarrollar procedimientos para la protección de la semilla y de la planta en germinación que hagan innecesaria la aplicación adicional de agentes fitosanitarios tras la siembra o tras la emergencia de las
25 plantas, o al menos la reduzcan claramente. Es además deseable optimizar la cantidad

del principio activo usada de modo que se proteja lo mejor posible la semilla y la planta en germinación frente a infestación con hongos fitopatógenos, pero sin dañar la planta propiamente con el principio activo usado. Especialmente los procedimientos para el tratamiento de semilla también deberían incluir las propiedades fungicidas intrínsecas de plantas transgénicas, para conseguir una protección óptima de la semilla y de las plantas en germinación con un consumo mínimo en agentes fitosanitarios.

La presente invención se refiere por tanto también a un procedimiento para la protección de semilla y plantas en germinación frente a la infestación con plagas animales y/o hongos dañinos fitopatógenos, tratándose la semilla con un agente de acuerdo con la invención. La invención se refiere igualmente al uso de agentes de acuerdo con la invención para el tratamiento de semillas para la protección de la semilla y de plantas en germinación frente a hongos fitopatógenos. Además la invención se refiere a semillas que se trataron para la protección frente a hongos fitopatógenos con un agente de acuerdo con la invención.

Combatir plagas animales y/o hongos dañinos fitopatógenos que dañan las plantas tras la emergencia, se realiza en primer lugar mediante el tratamiento del suelo y de partes aéreas de plantas con agentes fitosanitarios. Debido a la creencia relativa a un posible influjo de los agentes fitosanitarios en el entorno y en la salud de humanos y animales se realizan esfuerzos para reducir la cantidad de los principios activos aplicados.

Una de las ventajas de la presente invención es que debido a las propiedades sistémicas especiales de los agentes de acuerdo con la invención el tratamiento de la semilla con estos agentes no protege propiamente sólo la semilla frente a plagas animales y/o hongos dañinos fitopatógenos, sino también las plantas que resultan de esta tras la emergencia. De este modo el tratamiento inmediato del cultivo no puede realizarse

hasta el momento de la siembra o hasta poco después.

Se considera igualmente como ventajoso que se puedan usar los principios activos o agentes de acuerdo con la invención especialmente también en semillas transgénicas, en donde la planta en crecimiento de esta semilla se encuentra en situación de expresar una proteína que actúe contra plantas. Mediante el tratamiento de tal semilla con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden combatir ya con la expresión de la proteína insecticida, por ejemplo, determinadas plagas. De forma sorprendente se puede observar a este respecto un efecto sinérgico adicional que amplía adicionalmente la efectividad de la protección contra la infestación con plagas.

Los agentes de acuerdo con la invención son adecuados para la protección de semillas de aquellas variedades de plantas que se usan en agricultura, en el invernadero, en bosques o en el jardín. Especialmente se trata a este respecto de semillas de cereales (como, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, habas, café, remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, verduras (como, por ejemplo, tomate, pepino, cebolla y lechuga), césped y plantas ornamentales. Es de especial significancia el tratamiento de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz y arroz.

Como ya se describió anteriormente, el tratamiento de semilla transgénica con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención es de especial relevancia. Esto se refiere a la semilla de plantas que contienen al menos un gen heterólogo, que hace posible la expresión de un polipéptido o proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo en semilla transgénica puede derivarse, por ejemplo, de microorganismos de especies de *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. Preferiblemente este gen heterólogo se deriva de *Bacillus sp.*, en donde el producto génico posee un efecto contra el barrenador del maíz (barrenador del

maíz europeo) y/o el gusano de la raíz del maíz occidental. Con especial preferencia el gen heterólogo se deriva de *Bacillus thuringiensis*.

En el marco de la presente invención se aplica el agente de acuerdo con la invención sólo o en formulación adecuada sobre la semilla. Preferiblemente se trata la semilla en un estado en el que es tan estable que no tiene lugar daño alguno en el tratamiento. En general se puede realizar el tratamiento de la semilla en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Normalmente se usa la semilla que se separó de la planta y se liberó de mazorcas, cáscaras, tallos, envolturas, lana o sarcocarpio. De este modo se puede usar por ejemplo semilla, que se sembró, se limpió y se secó hasta un contenido en humedad inferior al 15% en peso. De forma alternativa se puede usar también semilla que se trató tras el secado, por ejemplo, con agua y luego se secó de nuevo.

En general se debe prestar atención en el tratamiento de la semilla a que la cantidad del agente de acuerdo con la invención y/o de otros aditivos aplicados sobre la semilla se seleccione de modo que la germinación de la semilla no se vea perjudicada o no se dañe la planta resultante de esta. Esto se debe observar sobre todo en principios activos que pueden mostrar en determinadas cantidades de aplicación efectos fitotóxicos.

Los agentes de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente también sin contener otros componentes y sin tener que diluirse. En general se prefiere aplicar los agentes en forma de una formulación adecuada sobre la semilla. Son conocidos por el especialista en la técnica formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semilla 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

transformar en formulaciones de agente desinfectante habituales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, suspensiones u otras masas de envoltura para semillas, así como formulaciones en ULV.

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

Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de agente
10 desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los colorantes habituales para tales fines. A este respecto son de utilidad tanto pigmentos poco solubles en agua como también colorantes solubles en agua. Como ejemplos son de citar los colorantes conocidos con las referencias Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

15 Como humectantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de agente desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias habituales requeridas para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferiblemente son de utilidad sulfonatos de alquilnaftaleno como sulfonatos de diisopropilnaftaleno o diisobutilnaftaleno.

20 Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferiblemente son de utilidad dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos.
25 Como dispersantes no iónicos adecuados son de citar especialmente copolímeros de

bloques de óxido de etileno-óxido de propileno, alquilfenolpoliglicoléter así como tristririlfenolpoliglicoléter y sus derivados fosfatados o sulfatados. Son dispersantes aniónicos adecuados especialmente sulfonatos de lignina, sales de poli(ácido acrílico) y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

- 5 Como antiespumantes pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferiblemente son de utilidad antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

- 10 Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención todas las sustancias que se puedan usar para tales fines en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo son de citar diclorofeno y bencilalcoholhemiformal.

- 15 Como espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de agente desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias que se puedan usar para tales fines en agentes agroquímicos. Preferiblemente se tienen en cuenta derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y ácido silícico altamente disperso.

- 20 Como adhesivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de agente desinfectante de utilidad de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los aglutinantes habituales que se puedan usar en agentes desinfectantes. Preferiblemente son de citar polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

- 25 Como giberelinas que pueden estar contenidas en las formulaciones de agente desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta preferiblemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberelínico), A4 y A7; se usa con especial preferencia el ácido giberelínico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler

„Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel“, tomo 2, editorial Springer, 1970, páginas 401-412).

Las formulaciones de desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar bien directamente o bien tras dilución previa con agua para el
5 tratamiento de semilla de distintos tipos. De este modo se pueden usar los concentrados o los preparados obtenidos a partir de estos por dilución con agua para la desinfección de la semilla de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y tritical, así como de la semilla de maíz, arroz, colza, guisantes, judías, algodón, girasol y nabos o también de semillas de verduras de distinta naturaleza. Las formulaciones de agente desinfectante
10 que se pueden usar de acuerdo con la invención o sus preparados diluidos se pueden usar también para la desinfección de semilla de plantas transgénicas. A este respecto se pueden producir también efectos sinérgicos adicionales en combinación con las sustancias formadas mediante expresión.

Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectante que se
15 pueden usar de acuerdo con la invención o los preparados producidos a partir de estas por adición de agua, se tienen en cuenta todos los equipos de mezcla que se pueden usar normalmente para la desinfección. De forma particular se procede en la desinfección de modo que la semilla se añade a un mezclador que incorpora respectivamente la cantidad deseada de formulación de agente desinfectante bien como tal o tras dilución
20 previa con agua y lo mezcla sobre la semilla hasta la distribución uniforme de la formulación. Dado el caso se concluye con un proceso de secado.

La cantidad de aplicación en las formulaciones de desinfectante que se pueden usar de acuerdo con la invención se puede variar dentro de un amplio intervalo. Esta se rige por el contenido respectivo de principios activos en las formulaciones y por la semilla. Las
25 cantidades de aplicación en combinación de principios activos se encuentran por lo

general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferiblemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Además los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención también presentan muy buenos efectos antimicóticos. Poseen un amplio espectro de actividad antimicótico, especialmente contra dermatofitos y blastomicetos, mohos y hongos difásicos (por ejemplo, contra especies de *Candida* como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) así como *Epidemophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton* como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de microsporonas como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos no representa en modo alguno una limitación del espectro micótico abarcable, sino que sólo tiene carácter aclaratorio.

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

Los principios activos se pueden aplicar como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de estas, como soluciones, suspensiones, polvos para rociar, pastas, polvos solubles, agentes para espolvorear y gránulos listos para uso. La aplicación se lleva a cabo de forma habitual, por ejemplo, mediante vertido, pulverización, atomización, dispersión, empolvado, espumación, pintado y similares. Es posible además esparcir los principios activos según el procedimiento de ultra-bajo volumen o inyectar la preparación de principio activo o el principio activo propiamente en el suelo. Se pueden tratar también las semillas de las plantas.

Con uso de las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención como insecticidas y acaricidas se pueden variar las cantidades de aplicación según cada tipo de aplicación en un amplio intervalo. La cantidad de aplicación de los principios

activos de acuerdo con la invención es

- en el tratamiento de partes de plantas es, por ejemplo, en hojas de 0,1 a 10.000 g/ha, preferiblemente de 10 a 1.000 g/ha, con especial preferencia de 50 a 300 g/ha (con aplicación mediante vertido o goteo se puede reducir incluso la cantidad de aplicación, sobre todo si se usan sustratos inertes como lana de roca o perlita);
- en el tratamiento de semilla de 2 a 200 g por 100 kg de semilla, preferiblemente de 3 a 150 g por 100 kg de semilla, con especial preferencia de 2,5 a 25 g por 100 kg de semilla, con muy especial preferencia de 2,5 a 12,5 g por 100 kg de semilla,
- en el tratamiento de suelo de 0,1 a 10.000 g/ha, preferiblemente de 1 a 5.000 g/ha.

Estas cantidades de aplicación se citan sólo a título de ejemplo y no son limitantes en el sentido de la invención.

La aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención se realiza de modo conocido en el sector veterinario y en la cría de animales mediante administración por vía entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento en comedero, supositorios, mediante administración por vía parenteral como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante administración por vía nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión o baño (remojo), pulverización (pulverizador), vertido (vertido dorsal y en cruz), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos de moldeo que contienen principios activos como collares, marcas en la oreja, marcas en el rabo, brazaletes, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

En la aplicación para ganado, aves de corral, mascotas, etc., se pueden usar los principios activos de fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los principios activos en una cantidad del 1 al 80% en

peso, directamente o después de dilución a 100 a 10.000 veces, o se usan como baño químico.

Los agentes listos para uso pueden contener dado el caso también otros insecticidas y dado el caso también uno o más fungicidas.

5 En lo que respecta a posibles asociados de mezcla adicionales se hace referencia a los insecticidas y fungicidas citados anteriormente.

Al mismo tiempo se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención para la protección de objetos contra la incrustación, especialmente cascos de embarcaciones, tamices, redes, edificios, atracaderos y balizas que se encuentren en contacto con agua
10 de mar o salobre.

Además se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes anti-incrustación.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención se puede usar para el tratamiento de organismos modificados genéticamente (GMO), por ejemplo, plantas o
15 semillas. Plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado un gen heterólogo de forma estable en el genoma. El término "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que se prepara o ensambla fuera de la planta y que con la introducción en el genoma del núcleo celular, el genoma del cloroplasto o el genoma de las mitocondrias de la planta transformada, facilita nuevas o mejores
20 propiedades agronómicas o del estilo, de modo que se expresa una proteína o polipéptido de interés o de modo que presenta, regula o inactiva otro gen presente en la planta o bien otros genes presentes en la planta (por ejemplo, mediante tecnología antisentido, tecnología de cosupresión o tecnología de ARNi [interferencia de ARN]). Un gen heterólogo que esté presente en el genoma se designa igualmente como gen
25 transgénico. Un gen transgénico que se defina por su presencia específica en el genoma

de la planta se designa como evento de transformación o transgénico.

En función de las especies de plantas o variedades de plantas, sus hábitats y sus condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodos vegetativos, alimentación), el tratamiento de acuerdo con la invención puede conducir también a efectos superaditivos ("sinérgicos"). Así, son posibles, por ejemplo, los siguientes efectos que superan los efectos que realmente se esperan: cantidades de aplicación reducidas y/o espectro de acción ampliado y/o mayor actividad de los principios activos y composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o frente al contenido de agua o sales del suelo, mayor rendimiento de floración, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, más frutos, mayor altura de la planta, cloro verde intenso de la hoja, floración más temprana, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha.

En cantidades de aplicación determinadas las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención pueden ejercer también una actividad de refuerzo sobre plantas. Estas son adecuadas por tanto para la movilización del sistema de defensa de plantas contra el ataque por hongos fitopatógenos y/o microorganismos y/o virus no deseados. Este puede ser dado el caso uno de los motivos de la mayor actividad de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo, contra hongos. Por sustancias que refuerzan las plantas (que inducen resistencia) debe entenderse también a este respecto aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema defensivo de la planta, de modo que las plantas tratadas cuando son inoculadas subsiguientemente con hongos fitopatógenos y/o microorganismos y/o virus

no deseados, presentan un grado de resistencia considerable contra estos hongos fitopatógenos y/o microorganismos y/o virus no deseados. En el presente caso se entiende por hongos fitopatógenos y/o microorganismos y/o virus no deseados, hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Las sustancias de acuerdo con la invención se pueden
5 usar por tanto para la protección de plantas contra el ataque por los agentes patógenos citados dentro de un periodo de tiempo determinado tras el tratamiento. El periodo de tiempo durante el que se consigue la acción protectora se extiende por lo general de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días, tras el tratamiento de las plantas con los principios activos.

10 A plantas y variedades de plantas, que se tratan preferiblemente de acuerdo con la invención, pertenecen todas las plantas que disponen de descendencia, que proporciona a estas plantas características útiles especialmente ventajosas (da igual, si esto se consiguió mediante cría y/o biotecnología).

Plantas y variedades de plantas que se tratan igualmente preferiblemente de
15 acuerdo con la invención son resistentes contra uno o varios factores de estrés bióticos, es decir, estas plantas presentan una mejor defensa contra parásitos animales y microbianos como nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

Son plantas y variedades de plantas, que se pueden tratar igualmente de acuerdo
20 con la invención aquellas plantas que son resistentes contra uno o varios factores de estrés abióticos. A las condiciones de estrés abióticas pueden pertenecer, por ejemplo, sequía, condiciones de frío y calor, estrés osmótico, humedad retenida, contenido elevado en sales del suelo, alta exposición a minerales, condiciones de ozono, condiciones de luz intensa, disponibilidad limitada de nutrientes de nitrógeno,
25 disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo o ausencia de sombras.

Son plantas y variedades de plantas que se pueden tratar igualmente de acuerdo con la invención aquellas plantas que se caracterizan por mayores propiedades de cosecha. En estas plantas una mayor cosecha puede fundamentarse, por ejemplo, en la mejor psicología de la planta, mejor crecimiento de la planta y mejor desarrollo de la planta, como eficiencia de aprovechamiento de agua, eficiencia de retención de agua, mejor aprovechamiento de nitrógeno, mayor asimilación de carbono, mejor fotosíntesis, fuerza de germinación reforzada y maduración acelerada. La cosecha se puede ver influenciada además por una mejor arquitectura de la planta (en condiciones de estrés y sin estrés), y de ahí floración temprana, control de flores para la producción de semillas híbridas, crecimiento de la planta en germinación, tamaño de la planta, número y distancia entre nudos, crecimiento de la raíz, tamaño de semillas, tamaño de frutos, tamaño de vainas, número de vainas y espigas, número de semillas por vaina o espiga, peso de semillas, relleno de semillas reforzado, pérdida de semillas reducida, espacios de vainas reducidos así como estabilidad. Características de la cosecha que se consideran adicionalmente son composición de semillas como contenido en hidratos de carbono, contenidos en proteínas, contenido en aceite y composición del aceite, valor nutritivo, reducción de compuestos poco nutritivos, mejor procesabilidad y mejor capacidad de almacenamiento.

Son plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención plantas híbridas que ya expresan las propiedades de heterosis o del efecto híbrido, lo que en general conduce a mayor cosecha, mayor crecimiento, mejor salud y mejor resistencia contra factores de estrés bióticos y abióticos. Tales plantas se producen de forma típica de modo que se cruza una línea padre de polen estéril cultivada en consanguinidad (la pareja de cruce hembra) con otra línea padre de polen fértil cultivada en consanguinidad (la pareja de cruce macho). La semilla híbrida se cosecha de forma típica a partir de la planta de polen estéril

y se comercializa la descendencia. A veces se pueden producir plantas de polen estéril (por ejemplo, en el maíz) mediante mutilación (es decir, separación mecánica de los órganos sexuales masculinos o de las flores masculinas); sin embargo, es habitual que la esterilidad del polen se base en determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, especialmente si se trata de las semillas con el producto deseado, debido a que se cosechará a partir de las plantas híbridas, normalmente es válido asegurar que se restaura completamente la fertilidad del polen en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen. Esto se puede conseguir si se asegura que las parejas de cruce masculinas poseen genes de restauración de la fertilidad correspondientes que sean capaces de restaurar la fertilidad del polen en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos que son responsables de la esterilidad del polen. Los determinantes genéticos de la esterilidad del polen pueden estar localizados en el citoplasma. Se describieron ejemplos de esterilidad del polen citoplasmática (CMS), por ejemplo, para especies de *Brassica*. No obstante los determinantes genéticos de esterilidad del polen pueden estar localizados también en el genoma del núcleo celular. Se pueden obtener plantas de polen estéril también con procedimientos de biotecnología vegetal como ingeniería genética. Un agente especialmente válido para la producción de plantas de polen estéril se describe en el documento WO 89/10396, en el que por ejemplo se expresa una ribonucleasa como una barnasa selectivamente en las células del tapiz en las hojas cargadas de polvo. La fertilidad se puede restaurar luego mediante expresión de un inhibidor de ribonucleasa como barstar en las células del tapiz.

Son plantas o variedades de plantas (que se obtienen con procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención plantas tolerantes a herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes

a uno o varios herbicidas dados. Se pueden obtener plantas de este tipo, que contienen una mutación que aporta tal tolerancia a herbicidas, bien por transformación genética o bien por selección de plantas.

Plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, es decir, plantas que se han hecho tolerantes frente al herbicida glifosato o sus sales. De este modo se pueden obtener, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato mediante transformación de la planta con un gen que codifica el enzima 5-enolpiruvilshiquimat-3-fosfatsintasa (EPSPS). Ejemplos de tales genes de EPSPS son el gen AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*, el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.*, los genes que codifican un EPSPS de la petunia, un EPSPS del tomate o un EPSPS de la eleusina. Se puede tratar también de un EPSPS mutado. Se puede obtener plantas tolerantes a glifosato también de modo que se expresa un gen que codifica un enzima glifosato-oxidoreductasa. Se pueden obtener también plantas tolerantes a glifosato expresando un gen que codifica un enzima glifosato-acetiltransferasa. También se pueden obtener plantas tolerantes a glifosato seleccionando plantas que contienen mutaciones de origen natural de los genes citados anteriormente.

Otras plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, plantas que se han hecho tolerantes frente los herbicidas que inhiben el enzima glutaminsintasa como bialafós, fosfinotricina o glufosinato. Tales plantas se pueden obtener expresando un enzima que envenena el herbicida o un mutante del enzima glutaminsintasa que es resistente a la inhibición. Un enzima envenenado de forma efectiva de este tipo es, por ejemplo, un enzima que codifica una fosfinotricin-acetiltransferasa (como, por ejemplo, la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Se describen plantas que expresan una fosfinotricin-acetiltransferasa exógena.

Otras plantas tolerantes a herbicidas son también plantas que se han hecho

tolerantes a los herbicidas que inhiben el enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que se transforma para-hidroxifenilpiruvato (HPP) en homogentisato. Se pueden transformar plantas que son tolerantes a inhibidores de HPPD con un gen que codifica un enzima HPPD resistente de origen natural, o un gen que codifica un enzima HPPD mutado. Se puede conseguir también una tolerancia frente a inhibidores de HPPD transformando plantas con genes que codifican enzimas determinados que hacen posible la formación de homogentisato a pesar de la inhibición del enzima HPPD nativo con los inhibidores de HPPD. La tolerancia de plantas frente a inhibidores de HPPD se puede mejorar transformando plantas con un gen que codifica un enzima de prephenatodeshidrogenasa además de con un gen que codifica un enzima tolerante a HPPD.

Otras plantas resistentes a herbicidas son plantas que se han hecho tolerantes a inhibidores de acetolactatosintasa (ALS). A inhibidores de ALS conocidos pertenecen, por ejemplo, sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidina, pirimidiniloxi(tio)benzoatos y/o herbicidas de sulfonilaminocarbonilimidazolinona. Se sabe que las distintas mutaciones en el enzima ALS (también conocido como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) aporta una tolerancia frente a distintos herbicidas y grupos de herbicidas. Se describe la producción de plantas tolerantes a sulfonilurea y plantas tolerantes a imidazolinona. Otras plantas tolerantes a imidazolinona se describen también. Otras plantas tolerantes a sulfonilurea e imidazolinona se describen también, por ejemplo, en el documento WO 2007/024782.

Otras plantas tolerantes frente a imidazolinona y/o sulfonilurea se pueden obtener mediante mutagénesis inducida, selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o mediante generación de mutación.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron según procedimientos de biotecnología vegetal, tal como ingeniería genética), que se pueden tratar igualmente de

acuerdo con la invención, son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes contra el ataque de determinados insectos diana. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que aporta tal resistencia a insectos.

- 5 El término "planta transgénica resistente a insectos" comprende en este contexto aquellas plantas que contienen al menos un gen transgénico que comprende una secuencia de codificación que codifica lo siguiente:

- 10 1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una porción insecticida de la misma, tal como las proteínas cristalinas insecticidas que se describen en línea en:
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), o porciones insecticidas de las mismas, por ejemplo, proteínas de las clases de proteínas Cry; Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae o Cry3Bb o porciones insecticidas de las mismas; o
- 15 2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma que es insecticida en presencia de una segunda proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma, tal como la toxina binaria que se compone de las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o
- 20 3) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de proteínas cristalinas insecticidas distintas de *Bacillus thuringiensis* tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105, que se produce en el evento del maíz MON98034; (documento WO 2007/027777); o
- 25 4) una proteína según uno de los puntos 1) a 3) anteriores, en la que particularmente 1 a 10 aminoácidos fuesen reemplazados por otro

- aminoácido para conseguir una mayor actividad insecticida frente a una especie de insecto diana, y/o para ampliar el espectro de especies de insecto diana afectadas, y/o con motivo de modificaciones que fueron inducidas en el ADN de codificación durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3Bb1 en eventos de maíz MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el evento del maíz MIR 604;
- 5
- 5) una proteína secretada insecticida de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* o una porción insecticida de la misma, tal como las proteínas insecticidas vegetativas (vegetative insecticidal proteins, VIP), que se citan en http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo, proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o
- 10
- 6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal como la toxina binaria que se compone de las proteínas VIP1A y VIP2A; o
- 15
- 7) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de distintas proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o
- 20
- 8) una proteína según uno de los puntos 1) a 3) anteriores en la que algunos, particularmente 1 a 10, aminoácidos han sido reemplazados por otro aminoácido para conseguir una actividad insecticida mayor frente a una especie de insecto diana, y/o para ampliar el espectro de especies de insecto diana afectado, y/o con motivo de modificaciones que fueron inducidas en el ADN de codificación durante la clonación o transformación (mientras se codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa en el evento
- 25

del algodón COT 102.

Evidentemente a las plantas transgénicas resistentes a insectos pertenecen a este respecto también aquellas plantas que comprenden una combinación de genes que codifican las proteínas de una de las clases 1 a 8 anteriormente citadas. En una forma de
5 realización una planta resistente a insecticidas contiene más de un gen transgénico, que codifica una proteína según uno de los puntos 1 a 8 anteriormente citados, para ampliar el espectro de especies de insectos diana correspondiente o para demorar el desarrollo de una resistencia de los insectos contra las plantas usándose distintas proteínas que sean insecticidas para la misma especie de insecto diana, pero que presenten una forma
10 de actuación distinta como unión a distintos puntos de unión al receptor en el insecto.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que se pueden tratar igualmente de acuerdo con la invención son tolerantes a factores de estrés abióticos. Se pueden obtener estas plantas mediante transformación genética o mediante selección de plantas
15 que contienen una mutación que aporta una resistencia al estrés de este tipo. A plantas especialmente útiles con tolerancia al estrés pertenecen las siguientes:

- a. Plantas que contienen un gen transgénico que puede reducir la expresión y/o actividad del gen de la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de la planta o plantas.
- 20 b. Plantas que contienen un gen transgénico que refuerza la tolerancia al estrés, que puede reducir la expresión y/o actividad de los genes que codifican PARP de las plantas o células de plantas;
- c. Plantas que contienen un gen transgénico que refuerza la tolerancia al estrés que codifica un enzima funcional en plantas de la ruta de biosíntesis alterna
25 de nicotinamidadenindinucleótido, entre ellos nicotinamidasas,

nicotinatfosforibosiltransferasa, ácido nicotínico
 mononucleotidadeniltransferasa, nicotinamidadenindinucleotidsintetasa o
 nicotinamidafosforibosiltransferasa.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron según procedimientos de
 5 biotecnología vegetal, como la ingeniería genética), que se pueden tratar igualmente de
 acuerdo con la invención presentan una cantidad, calidad y/o capacidad de
 almacenamiento del producto de cosecha distintas y/o propiedades modificadas de
 determinados constituyentes del producto de cosecha como, por ejemplo:

- 1) Plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado que está
 10 modificado en lo relativo a sus propiedades físico-químicas, especialmente
 del contenido de amilosa o de la relaciones amilasa/amilopectina, del grado de
 ramificación, de la longitud de cadena media, de la distribución de cadenas
 laterales, del comportamiento de viscosidad, de la resistencia a geles, del
 tamaño de partícula de almidón y/o morfología de partícula de almidón en
 15 comparación con el almidón sintetizado en células de plantas o plantas de tipo
 salvaje, de modo que este almidón modificado es más adecuado para
 determinadas aplicaciones.
- 2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros de hidratos de carbono distintos
 del almidón, o polímeros de hidratos de carbono distintos del almidón cuyas
 20 propiedades se ven modificadas en comparación con plantas de tipo salvaje
 sin modificación genética. Son ejemplos plantas que producen polifruetosa,
 particularmente del tipo de inulina y levano, plantas que producen alfa-1,4-
 glucano, plantas que producen el alfa-1,4-glucano ramificado con alfa-1,6, y
 plantas, que producen alternano
- 25 3) Plantas transgénicas que producen hialuronano

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que se pueden tratar igualmente de acuerdo con la invención son plantas como plantas de algodón con propiedades de fibra modificadas. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que aporta tales propiedades de fibra modificadas; a estas pertenecen:

- a) Plantas como plantas de algodón que contienen una forma modificada de genes de celulosasintasa,
- b) Plantas como plantas de algodón que contienen una forma modificada de ácidos nucleicos homólogos rsw2 o rsw3;
- c) Plantas como plantas de algodón con una mayor expresión de sacarosafosfatasa;
- d) Plantas como plantas de algodón con una mayor expresión de sacarosintasa;
- e) Plantas como plantas de algodón en las que el momento de control del flujo de plasmodesmos se modifica en base a las células de fibras, por ejemplo, mediante regulación de la β -1,3-glucanasa selectiva de fibras;
- f) Plantas como plantas de algodón con fibras con reactividad modificada, por ejemplo mediante expresión del gen de N-acetilglucosamintransferasa, entre ellos también nodC, y de genes de quitina.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron según procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que se pueden tratar igualmente de acuerdo con la invención son plantas como colza o plantas de *Brassica* usadas con propiedades modificadas de composición de aceite. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que aporta a estas propiedades de aceite modificadas; a estas pertenecen:

- a) Plantas como plantas de colza, que producen aceite con un elevado contenido en ácido oleico;
- b) Plantas como plantas de colza que producen aceite con un contenido en ácido linoleico bajo.
- 5 c) Plantas como plantas de colza que producen aceite con un contenido en ácidos grasos saturados bajo.

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, son las plantas transgénicas que se comercializan con las referencias comerciales siguientes:

- 10 YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), BiteGard(R) (por ejemplo, maíz), BT-Xtra(R) (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón), Nucotn 33B(R) (algodón), NatureGard(R) (por ejemplo, maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Plantas tolerantes a herbicidas que son de citar son, por ejemplo, variedades de maíz, variedades de algodón y variedades
- 15 de soja que se comercializan con las referencias comerciales siguientes: Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y SCS® (tolerancia frente a sulfonilureas), por ejemplo, maíz. A plantas resistentes a herbicida (plantas criadas convencionalmente con tolerancia a herbicida),
- 20 pertenecen también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz).

- Plantas transgénicas especialmente habituales que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que contienen eventos de transformaciones, o una combinación de eventos de transformaciones y que se indican, por ejemplo, en los
- 25 archivos de distintas autoridades nacionales o regionales (véase, por ejemplo,

http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Las plantas citadas se pueden tratar de forma especialmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de fórmula (I) general o bien las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos dados
5 anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas citadas especialmente en el presente texto.

Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden usar, por ejemplo, para proteger plantas dentro de un periodo de tiempo determinado después del
10 tratamiento contra la infestación por los agentes patógenos dañinos citados. El periodo de tiempo dentro de cual se provoca la protección se extiende por lo general de 1 a 28 días, preferiblemente de 1 a 14 días, con especial preferencia de 1 a 10 días, con muy especial preferencia de 1 a 7 días tras el tratamiento de las plantas con los principios activos o bien hasta 200 días tras un tratamiento de la semilla.

15 La preparación y el uso de los principios activos de acuerdo con la invención de fórmula (I) se desprende de los siguientes ejemplos. Sin embargo la invención no se limita a estos ejemplos.

Generalidades: en tanto no se indique otra cosa las etapas de purificación o separación cromatográficas se llevaron a cabo en gel de sílice y con un gradiente de
20 disolventes de acetato de etilo / ciclohexano 0:100 hasta acetato de etilo/ciclohexano 100:0.

Preparación de sustancias de partida de fórmula (IX):

4-(4-Acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IX-I)

Se añade por goteo a una solución de 4-[4-(1-hidroxietil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-
25 carboxilato de terc-butilo (VIII-1, 2,06 g) en diclorometano (40 ml) a temperatura ambiente

1,1,1-triacetoxi-1,1-dihidro-1,2-benziodoxol-3(1H)-ona (solución al 15% en diclorometano, 28 g). Se agita la mezcla de reacción durante la noche a temperatura ambiente luego se añaden 5 g de gel de sílice y se separa el disolvente a vacío. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 4-(4-acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo
5 (1,65 g).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 8,34 (s, 1H), 4,00 (d, 2H), 3,26 (m, 1H), 2,93 (td, 2H), 2,54 (s, 3H), 2,09-2,03 (m, 2H), 1,60 (cd, 2H), 1,41 (s, 9H)

EM (ESI): 255 (M-C(CH₃)₃+H)

Preparación de sustancias de partida de fórmula (IVa), (IVb) y (IVc):

10 **4-[4-(2-Feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-I)**

Se añade por goteo a una solución de 1-bromo-4-fenilbutan-2-ona (2,00 g) en etanol (20 ml) a 0° C una solución de 4-carbamotioilpiperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,95 g). Se agita la mezcla de reacción en argon durante la noche a temperatura ambiente. Se añade trietilamina (1,7 ml), se diluye la mezcla con acetato de etilo y se lava con solución
15 de ácido clorhídrico concentrado. Se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida, obteniéndose una mezcla de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo y 4-[4-hidroxi-4-(2-feniletil)-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo. Ambos compuestos se separan por cromatografía. Se obtiene
20 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (800 mg) y 4-[4-hidroxi-4-(2-feniletil)-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (640 mg). Ambos compuestos se pueden usar en el procedimiento 1.2, ya que este último en las condiciones de reacción se transforma en el primero.

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,28-7,25 (m, 2H), 7,22-7,22 (m, 2H), 7,20-7,18 (m, 1H), 7,13 (s, 1H), 4,00 (sa, 2H), 3,35 (s, 2H), 3,16 (m, 1H), 2,95 (s, 4H), 2,00 (d, 2H), 1,52 (cd, 2H),
25

1,41 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 373 ([M+H]⁺)

4-{4-[(E)-2-(Naftalen-1-il)etenil-13,-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-2)}

5 Se disuelve en argon 1-naftalilmetilfosfonato de dietilo (1,88 g) en tetrahidrofurano (20 ml) y se enfría a 0° C. Se añade 757 mg de terc-butanolato de potasio, volviéndose la solución roja oscura. Tras 10 minutos adicionales de agitación se añade 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,00 g). Se agita la mezcla durante 30 minutos a 0° C y luego se calienta a temperatura ambiente. Después de otros 20 minutos
10 se adiciona solución de cloruro de amonio concentrado. Se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio, se concentra y se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 4-{4-[(E)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,16 g) como isómero E.

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 8,23 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,83 (d, 1H),
15 7,62 (s, 1H), 7,62-7,51 (m, 3H), 7,26 (d, 1H), 4,04 (d, 2H), 3,27 (m, 1H), 2,94 (t, 2H), 2,15-2,05 (m, 2H), 1,66 (cd, 2H), 1,42 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 421 ([M+H]⁺)

4-{4-[(Z)-2-(Naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-3)}

20 Se disuelve cloruro de (1-naftilmetil)trifenilfosfonio chloride (2,96 g) en 20 ml de tetrahidrofurano, se enfría en argon a 0° C y se adiciona terc-butanolato de potasio (757 mg), volviéndose la solución roja oscura. Después de 10 minutos de agitación se añade 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,00 g). Se agita la mezcla durante 30 min a 0° C y luego se calienta lentamente hasta temperatura ambiente.
25 Después de 20 minutos más se adiciona solución de cloruro de amonio saturada y se

separa la fase acuosa. Tras extracción de la fase acuosa con acetato de etilo se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 4-{4-[(Z)-2-(naftalen-1-yl)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,2 g, isómero Z).

- 5 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,92 (t, 2H), 7,87-7,80 (m, 1H), 7,50-7,48 (m, 4H), 7,10 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 6,86 (s, 1H), 3,75 (d, 2H), 2,98 (m, 1H), 2,80 (t, 2H), 1,80-1,70 (m, 2H), 1,40 (s, 9H), 1,30 (cd, 2H) ppm

EM (ESI): 421 ([M+H]⁺)

4-{4-[(1Z)-4-Fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-4)

10

Se hace reaccionar 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,00 g) con yoduro de trifenil(3-fenilbutil)fosfonio (3,53 g) y se purifica como se describe en IV-3. Se obtiene 4-{4-[(1Z)-4-fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,23 g) en forma del isómero Z.

- 15 RMN ¹H (DMSO-Ci₆): δ 7,30 (s, 1H), 7,26-7,22 (m, 4H), 7,15 (m, 1H), 6,33 (s, 1H), 5,59 (m, 1H), 3,98 (d, 2H), 3,19 (m, 1H), 3,00-2,83 (m, 5H), 2,06-1,97 (m, 2H), 1,60 (cd, 2H), 1,41 (s, 9H), 1,24 (d, 3H) ppm

EM (ESI): 413 ([M+H]⁺)

4-[4-(3-Fenilprop-1-en-1-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-5)

20

Se añaden a una solución desgasificada de 4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (X-1, 310 mg) en tetrahydrofurano (4 ml) en argon cloruro de bencilo (134 mg), bis(acetonitril)dicloropalladio (II) (5,5 mg), 2-diciclohexilfosfina-2',4',6'-triisopropilbifenilo (30 mg) y carbonato de cesio (363 mg). Se calienta luego la mezcla a 65° C. Tras el subsiguiente enfriamiento se separa el catalizador mediante filtración en

- 25 Celite y se concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 4-[4-

(3-fenilprop-1-in-1-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (329 mg).

RMN ^1H (CD_3CN): δ 7,40-7,20 (m, 6H), 4,10-4,05 (m, 2H), 3,83 (s, 2H), 3,15 (m, 1H), 2,94-2,35 (m, 2H), 2,08-2,00 (m, 2H), 1,63 (cd, 2H), 1,43 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 383 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

5 **4-[4-(Naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-6)**

Se añaden a una solución de 4-{4-[(trimetilsilil)etinil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (XI-1, 600 mg) y 1-bromonaftaleno (375 mg) en N,N-dimetilformamida desgasificada, tetraquis(trifenilfosfin)paladio (0) (95 mg), yoduro de cobre (I) (31 mg) y trietilamina (200 mg). Tras calentar a 85° C se añade gota a gota
10 fluoruro de tetra-n-butilamonio (1M en THF, 1,81 ml). Se diluye la mezcla de reacción a continuación con agua y se extrae con acetato de etilo. Se secan los extractos orgánicos en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 4-[4-(naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (576 mg).

15 RMN ^1H (CD_3CN): δ 8,38 (d, 1H), 7,95 (d, 2H), 7,79 (d, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,67-7,50 (m, 3H), 4,12 (d, 2H), 3,24 (m, 1H), 2,94 (t, 2H), 2,15-2,08 (m, 2H), 1,72 (cd, 2H), 1,45 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 419 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

4-[4-(Piridin-3-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-7)

20 Se hace reaccionar 4-{4-[(trimetilsilil)etinil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (XI-1, 610 mg) de forma análoga al ejemplo IV-6 con 3-bromopiridina (291 mg). Se obtiene 4-[4-(piridin-3-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (469 mg).

RMN ^1H (CD_3CN): δ 8,74 (d, 1H), 8,55 (dd, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,35 (dd, 1H),
25 4,10 (d, 2H), 3,20 (m, 2H), 2,93 (t, 2H), 2,13-2,05 (m, 2H), 1,69 (cd, 2H), 1,44 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 270 ($[M+2H-C=OOC(CH_3)_3]^+$)

4-{4-[2-(Naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-8)

Se disuelve 4-{4-[(Z)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-3, 1,5 g) en 90 ml de metanol y se hidrogena a 30° C con Pd/C al 10% como catalizador a 1000 kPa (10 bar) de hidrógeno. Tras filtración del catalizador y separación del disolvente a presión reducida se obtiene 4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,48 g) como aceite incoloro.

RMN 1H (DMSO $_d$): δ 8,08 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,74 (d, 1H), 7,55-7,45 (m, 2H), 7,42-7,32 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 4,00 (d, 2H), 3,43 (t, 2H), 3,32-3,06 (m, 3H), 2,92 (t, 2H), 2,04-1,98 (m, 2H), 1,58 (cd, 2H), 1,42 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 423 ($[M+H]^+$)

Preparación de sustancias de partida de fórmula (X):

4-(4-Etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (X-1)

Se disuelve 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (600 mg) en argon en metanol y se adiciona carbonato de potasio (839 mg) y fosfonato de dimetil-1-diazo-2-oxopropilo (786 mg). Se agita la mezcla a temperatura ambiente durante 3 horas. Tras procesamiento acuoso se extrae con acetato de etilo, se secan los extractos con sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (493 mg).

RMN 1H (CD $_3$ CN): δ 7,51 (s, 1H), 4,07 (d, 2H), 3,36 (s, 1H), 3,16 (m, 1H), 2,90 (t, 2H), 2,10-2,00 (m, 2H), 1,65 (cd, 2H), 1,43 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 237 ($[M+2H-C(CH_3)_3]^+$)

Preparación de sustancias de partida de fórmula (XI):

4-{4-[(Trimetilsilil)etinil]-1,3-tiazol-2-il}-piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (XI-1)

Se disuelve en argon 4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (X-1, 940 mg) a -78° C en tetrahidrofurano y se añade gota a gota hexametildisilazano de litio (1M en hexano, 4,82 ml). Después 30 min se añade por goteo cloruro de trimetilsililo (699 mg) y se retira el enfriamiento. Tras agitar durante la noche se adiciona solución de cloruro de amonio saturada y se extrae con acetato de etilo. Se secan los extractos orgánicos en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 4-{4-[(trimetilsilil)etinil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,28 g).

RMN ¹H (CD₃CN): δ 7,42 (s, 1H), 4,05-3,97 (m, 2H), 3,09 (m, 1H), 2,83 (t, 2H), 2,05-1,90 (m, 2H), 1,59 (cd, 2H), 1,37 (s, 9H), 0,17 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 309 ([M+2H-C(CH₃)₃]⁺)

Preparación de sustancias de partida de fórmulas (IIa), (IIb) y (IIc):

Clorhidrato de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1)

Se añade por goteo a una solución de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-1, 640 mg) a 0° C una solución 2 molar de ácido clorhídrico en dietiléter. Se agita la mezcla de reacción a 0° C y luego se calienta lentamente hasta temperatura ambiente. Tras agitar durante la noche se separa el disolvente y el ácido clorhídrico en exceso. Se obtiene clorhidrato de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (590 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,25-7,23 (m, 2H), 7,19-7,16 (m, 3H), 7,11 (s, 1H), 3,40-3,30 (m, 5H), 2,98 (s, 4H), 2,21-2,14 (m, 2H), 1,95-1,87 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 273 ([M-Cl]⁺)

Clorhidrato de 4-[4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-2)

Se añade en argon a 4-[4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-2, 1,40 g) y a 0°C una solución de ácido clorhídrico en dietiléter (2 M, 25

ml). Se agita la mezcla a 0° C y luego se calienta lentamente hasta temperatura ambiente. Tras agitar durante la noche se separan el ácido y el disolvente en exceso a presión reducida. Se obtiene clorhidrato de 4-[4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il]piperidina (1,28 g).

5 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 9,18 (sa, 1H), 8,93 (sa, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,56- 7,45 (m, 2H), 7,73-7,32 (m, 2H), 7,16 (s, 1H), 3,45 (d, 1H), 3,43 (d, 1H), 3,38-3,28 (m, 2H), 3,15- 2,95 (m, 4H), 2,25-2,17 (m, 2H), 2,00 (cd, 2H) ppm

EM (ESI): 323 ([M-Cl]⁺)

4-[5-Bromo-4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-3)

10 Se añade por goteo a una solución de clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 200 mg) en ácido acético (2 ml) a 0° C bromo (123 mg). Se agita la mezcla durante 30 minutos y luego se adiciona solución de bicarbonato de sodio saturada. Se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Se secan las fases orgánicas reunidas en carbonato de sodio anhidro, se concentra a presión reducida y se
15 purifica por cromatografía. Se obtiene 4-[5-bromo-4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (127 mg).

logP (pH2,3): 1.72

EM (ESI): 351, 353 ([M+I]⁺)

Preparación de compuestos de fórmula (Ia)

20 Procedimiento A:

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-53)

Se añaden a una solución de ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (185 mg) en diclorometano a 0° C cloruro de oxalilo (134 mg) y una gota de N,N-
25 dimetilformamida. Se agita la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 3 h. Se

separan el disolvente y el reactivo en exceso a presión reducida. Se disuelve de nuevo el residuo sólido en diclorometano y se añade por goteo a 0° C a una solución de clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 250 mg) y trietilamina (410 mg) en diclorometano. Posteriormente se adiciona a la solución de reacción solución de cloruro de amonio concentrada, se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio anhidro y se concentra. Se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (122 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,28-7,26 (m, 2H), 7,22-7,21 (m, 2H), 7,19-7,15 (m, 2H), 6,51 (s, 1H), 5,33 (d, 1H), 5,25 (d, 1H), 4,36 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,35-3,20 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,82 (t, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,09 (d, 1H), 2,07 (d, 1H), 1,78 (m, 1H), 1,53 (m, 1H) ppm

EM (ESI): 463 ([M+H]⁺)

1-{4-[4-(2-Feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}pentan-1-ona (I-58)

Se añade a una solución de clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg) y trietilamina (0,7 ml) en diclorometano (3 ml) cloruro de pentanoilo (133 mg). Se agita la mezcla durante la noche y luego se adiciona agua. Se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo y luego se secan las fases orgánicas reunidas con sulfato de sodio y se concentra. Se purifica el residuo. Se obtiene 1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}pentan-1-ona (179 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,27-7,21 (m, 2H), 7,20-7,14 (m, 3H), 7,05 (s, 1H), 4,37 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,26-3,18 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,80 (sa, 1H), 2,33 (t, 2H), 2,04 (d, 2H), 1,55 (sa, 2H), 1,50 (tt, 2H), 1,33 (tc, 2H), 0,90 (t, 3H) ppm

EM (ESI): 357 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-81)

Se añaden a una solución de ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (100 mg) en diclorometano (5 ml) cloruro de oxalilo (183 mg) y una gota de N,N-dimetilformamida. Se agita la mezcla de reacción durante la noche a temperatura ambiente. Tras separar el disolvente a presión reducida se disuelve el residuo en diclorometano (5 ml) y se adiciona a 0° C por goteo una solución de clorhidrato de 4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina (II-2, 172 mg) y de base de Hünig (186 mg) en diclorometano (5 ml). Tras adición de solución de cloruro de amonio concentrado se separa la fase acuosa y se extrae con acetato de etilo. Se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (150 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 8,09 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,56-7,46 (m, 2H), 7,42-7,33 (m, 2H), 7,12 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,31 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,44 (t, 2H), 3,35-3,26 (m, 2H), 3,15-3,05 (m, 2H), 2,90 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,05 (m, 2H), 1,75 (sa, 1H), 1,62 (sa, 1H) ppm

EM (ESI): 513 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(4-fenilpentil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-80)

Se disuelve 4-{4-[(1Z)-4-fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-4, 1,00 g) en metanol y se hidrogena a 40° C en H₂ a 1000 kPa (10 bar) durante 5 horas en presencia de Pd/C (al 10%). Tras filtración y separación del disolvente a presión reducida se obtiene 4-[4-(4-fenilpentil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (1,00 g) como aceite incoloro. Este se desprotege luego de forma análoga al ejemplo II-2. Se obtiene 850 mg de clorhidrato de 4-[4-(4-fenilpentil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina. Se hacen reaccionar luego 169 mg de forma análoga al ejemplo I-81 con

ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (100 mg). Tras purificación cromatográfica se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(4-fenilpentil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (180 mg) como aceite incoloro.

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,28-7,23 (m, 2H), 7,19-7,14 (m, 3H), 7,02 (s, 1H), 6,44 (s, 1H),
 5,20 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,30-3,20 (m, 2H), 2,87 (sa, 1H), 2,72 (m, 1H),
 2,67-2,62 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,07-2,02 (m, 2H), 1,72 (sa, 1H), 1,63-1,47 (m, 5H), 1,19
 (d, 3H) ppm

EM (ESI): 505 ([M+H]⁺)

**1-{4-[5-Bromo-4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-
 1H-pirazol-1-il]etanona (I-78)**

Se hace reaccionar 4-[5-bromo-4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-3, 127 mg) de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (118 mg). Tras purificación cromatográfica se obtiene 1-{4-[5-bromo-4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (52
 15 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,27-7,22 (m, 2H), 7,18-7,13 (m, 3H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H),
 4,38 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,33-3,20 (m, 2H), 2,94 (s, 4H), 2,93 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H),
 2,09-2,02 (m, 2H), 1,80-1,50 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 541 ([M+H]⁺)

20 Procedimiento B:

1-{4-[4-(2-Feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-(tiofen-3-il)etanona (I-63)

Se disuelven ácido tiofen-3-ilacético (156 mg) y base de Hünig (323 mg) en diclorometano (10 ml) y se agita durante 30 min. Se añade clorhidrato de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg), preparado según el procedimiento 1.2, y se agita la
 25 mezcla otros 5 minutos, antes de añadirse hexafluorofosfato de bromo-tris-pirrolidino-

fosfonio (599 mg). Se agita la mezcla de reacción durante la noche a temperatura ambiente. Tras separación del disolvente a presión reducida se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 1-{4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-(tiofen-3-il)etanona (99 mg).

- 5 RMN ^1H (DMSO- d_6): δ 7,44-7,43 (m, 1H), 7,28-7,12 (m, 6H), 7,05 (s, 1H), 6,99 (d, 1H), 4,38 (sa, 1H), 3,99 (sa, 1H), 3,72 (s, 2H), 3,22-3,15 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,81 (sa, 1H), 2,00 (d, 2H), 1,52 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 397 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

2-[2-Cloro-5-(trifluorometil)fenil]-1-{4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-67)

10

Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg) de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido [2-cloro-5-(trifluorometil)fenil]acético (262 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-[2-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-1-{4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (210 mg).

- 15 RMN ^1H (DMSO- d_6): δ 7,71-7,58 (m, 3H), 7,27-7,12 (m, 5H), 7,07 (s, 1H), 4,37 (sa, 1H), 4,05 (sa, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,35-3,23 (m, 2H), 2,97 (s, 4H), 2,88 (sa, 1H), 2,07 (d, 2H), 1,65 (sa, 2H) ppm. EM (ESI): 439 ($\text{PvM}-\text{H}]^+$)

2-(5-Cloro-1-metil-1H-pirazol-4-il)-1-{4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-65)

20

Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 280 mg) de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido (5-cloro-1-metil-1H-pirazol-4-il)acético (174 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-(5-cloro-1-metil-1H-pirazol-4-il)-1-{4-[4-(2-feniletil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (89 mg).

- RMN ^1H (DMSO- d_6): δ 7,40 (s, 1H), 7,26-7,15 (m, 5H), 7,06 (s, 1H), 4,35 (sa, 1H), 4,05 (sa, 1H), 3,76 (s, 3H), 3,49 (s, 2H), 3,30-3,19 (m, 2H), 2,99 (s, 4H), 2,82 (sa, 1H), 2,08-
- 25

2,00 (m, 2H), 1,58 (sa, 2H) ppm

EM (ESI): 429 ([M+H]⁺)

2-[4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}propan-1-ona (I-64)

5 Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg) wird de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido 2-[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]propanoico (282 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-[4-cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il} propan-1-ona (165 mg).

10 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,13 (m, 3H), 7,06 (s, 1H), 5,70 (m, 1H), 4,30 (sa, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,30-3,19 (m, 2H), 2,96 (s, 5H), 2,26 (d, 3H), 2,08-1,96 (m, 2H), 1,64-1,54 (m, 5H) ppm

EM (ESI): 511 ([M+H]⁺)

[2,5-Bis(trifluorometil)fenil]{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}metanona (I-61)

15 Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg) de forma análoga al ejemplo I-63 con cloruro de 2,5-bis(trifluorometil)benzolcarbonilo (304 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica [2,5-bis(trifluorometil)fenil]{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}metanona (282 mg).

20 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 8,07-7,90 (m, 3H), 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,14 (m, 3H), 7,08 (s, 1H), 4,50 (d, 1H), 3,35-3,23 (m, 4H), 2,97 (s, 4H), 2,22-2,10 (m, 1H), 2,00-1,87 (m, 2H), 1,87-1,45 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 513 ([M+H]⁺)

3-(3,4-Dimetoxifenil)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}propan-1-ona (I-66)

25

Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg) de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido 3-(3,4-dimetoxifenil)propanoico (231 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 3-(3,4-dimetoxifenil)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}propan-1-ona (139 mg).

5 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,12 (m, 3H), 7,05 (s, 1H), 6,85-6,80 (m, 3H), 6,75-6,71 (dd, 1H), 3,93 (sa, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 3,20 (m, 1H), 2,96 (s, 4H), 2,80-2,74 (m, 2H), 2,65-2,55 (sa, 2H), 2,04-1,97 (m, 2H), 1,58-1,42 (m, 2H), 1,28 (t, 2H) ppm. EM (ESI): 465 ([M+H]⁺)

2-(1,3-Benzotiazol-2-il)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-71)

10 Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 308 mg) de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido 1,3-benzotiazol-2-ilacético (252 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-(1,3-benzotiazol-2-il)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (109 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 8,03 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,40 (t, 1H), 7,25-7,16 (m, 5H), 7,06 (s, 1H), 4,40 (sa, 1H), 4,34 (s, 2H), 4,09 (sa, 1H), 3,40-3,15 (m, 3H), 2,96 (s, 4H), 2,08-2,02 (m, 2H), 1,65 (sa, 2H) ppm

EM (ESI): 448 ([M+H]⁺)

2-(2H-Indazol-2-il)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-70)

20 Se hace reaccionar clorhidrato de 4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidina (II-1, 309 mg), preparado según el procedimiento 1.2, de forma análoga al ejemplo I-63 con ácido 2H-indazol-2-ilacético (194 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-(2H-indazol-2-il)-1-{4-[4-(2-feniletíl)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (67 mg).

RMN ¹H (CD₃CN): δ 8,10 (s, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,29-7,15 (m, 6H), 7,07 (dd, 1H), 6,87 (s, 1H), 5,45 (d, 1H), 5,36 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 4,00 (d, 1H), 3,35-3,23 (m, 2H), 3,00 (s, 4H), 2,86 (t, 1H), 2,18-2,06 (m, 2H), 1,80 (cd, 1H), 1,66 (cd, 1H) ppm

EM (ESI): 431 ($[M+H]^+$)

Procedimiento C:

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-81)

- 5 Se disuelve 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-(naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-50, 157 mg) en metanol (1,5 ml) y se adiciona a 60° C formiato de amonio (195 mg) y $Pd(OH)_2/C$ al 20% (4 mg) como catalizador. Tras filtración del catalizador y separación del disolvente a presión reducida se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[2-(naftalen-1-il)etil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (86 mg) como aceite incoloro.
- 10

El producto se caracterizó como el compuesto descrito previamente.

Preparación de compuestos de fórmula (Ib)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-27)

- 15 Se desprotege 4-{4-[(E)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-2, 171 mg) de forma análoga al ejemplo II-2 y luego se hace reaccionar de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (100 mg). Tras purificación cromatográfica se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (180 mg).
- 20

RMN 1H (DMSO- d_6): δ 8,23 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,64 (s, 1H), 7,63-7,51 (m, 3H), 7,27 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 5,24 (sa, 2H), 4,38 (sa, 1H), 4,03 (sa, 1H), 3,40 (m, 1H), 3,32 (sa, 1H), 2,94 (sa, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,23-2,12 (m, 2H), 1,85 (sa, 1H), 1,70 (sa, 1H) ppm

- 25 EM (ESI): 511 ($[M+H]^+$)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(Z)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-2)

Se desprotege 4-{4-[(Z)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-3, 171 mg) de forma análoga al ejemplo II-2 y luego se hace reaccionar de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (100 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-(naftalen-1-il)etenil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (200 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,95-7,92 (m, 2H), 7,87-7,84 (m, 1H), 7,52-7,43 (m, 4H), 7,11 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,05 (sa, 1H), 3,74 (sa, 1H), 3,20-3,05 (m, 2H), 2,88 (sa, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,90-1,78 (sa, 2H), 1,50 (sa, 1H), 1,35 (sa, 1H) ppm

EM (ESI): 511 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(1Z)-4-fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-3)

Se desprotege 4-{4-[(1Z)-4-fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-4, 168 mg), de forma análoga al ejemplo II-2 y luego se hace reaccionar de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (100 mg). Se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(1Z)-4-fenilpent-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (200 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,32 (s, 1H), 7,29-7,22 (m, 4H), 7,15 (m, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,35 (d, 1H), 5,60 (m, 1H), 5,20 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,38-3,25 (m, 2H), 3,05-2,84 (m, 4H), 2,22 (s, 3H), 2,17-2,05 (m, 2H), 1,85-1,56 (m, 2H), 1,26 (d, 3H) ppm

EM (ESI): 503 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(Z)-2-(2-naftil)vinil]-1,3-tiazol-2-

il)piperidin-1-il)etanona (I-20)

Se disuelve cloruro de (2-naftilmetil)(trifenil)fosfonio (454 mg) en 5 ml de tetrahidrofurano, se enfría en argón a 0° C y se adiciona terc-butilato de potasio (125 mg), volviéndose la solución roja oscura. Después de 10 min de agitación se añade 2-(1-[[5-
 5 metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbaldehído (200 mg). Se agita de nuevo la mezcla durante 30 minutos a 0° C y luego se calienta lentamente a temperatura ambiente. Después de 10 minutos más se adiciona solución de cloruro de amonio saturada y se separa la fase acuosa. Tras extracción de la fase acuosa con acetato de etilo se secan las fases orgánicas reunidas en sulfato de sodio y se
 10 concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(Z)-2-(2-naftil)vinil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (260 mg).

EM (ESI): 511 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-feniletetil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-93)

Se añade a una solución de 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-feniletetil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (141 mg) en cloroformo (1 ml) y 1,2-dimetoxietano (2 ml) anhídrido de ácido metoxifenilditiofosfónico (62 mg). Se agita la mezcla de reacción durante 24 horas a temperatura ambiente y se agita durante 3 horas
 20 a 40° C. Tras separación del disolvente a presión reducida se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(E)-2-feniletetil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (45 mg) como aceite incoloro.

RMN ¹H (CD₃CN): δ 7,55 (d, 2H), 7,43 (d, 1H), 7,37 (t, 2H), 7,30-7,28 (m, 2H), 7,18 (d, 1H), 6,39 (s, 1H), 5,41 (d, 1H), 5,26 (s, 2H), 4,42 (d, 1H), 3,54 (t, 1H), 3,45 (m, 1H), 3,38
 25 (t, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,30-2,23 (m, 2H), 1,95-1,80 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 477 ($[M+H]^+$)

Preparación de compuestos de fórmula (Ic)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-50)

5 Se desprotege 4-[4-(naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-6, 200 mg) de forma análoga al ejemplo II-2 y luego se hace reaccionar de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (117 mg). Se obtiene tras purificación cromatográfica 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(naftalen-1-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (112 mg).

10 RMN 1H (CD_3CN): δ 8,39 (d, 1H), 7,96 (d, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,67-7,50 (m, 3H), 6,37 (s, 1H), 5,05 (s, 2H), 4,45 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,40-3,20 (m, 2H), 2,93 (sa, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,25-2,15 (m, 2H), 1,90-1,75 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 509 ($[M+H]^+$)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(piridin-3-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (I-51)

15 Se desprotege 4-[4-(piridin-3-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-7, 469 mg) de forma análoga al ejemplo II-2, de modo que se obtenga clorhidrato de 3-[[2-(piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]etinil]piridina (407 mg). Este se hace reaccionar en torno a temperatura ambiente con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (277 mg) en presencia de 4-dimetilaminopiridina (16 mg) y 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (268 mg) en diclorometano (5 ml). Después de agitar a temperatura ambiente durante la noche, concentrar y purificación cromatográfica se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(piridin-3-iletinil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (65 mg).

25 RMN 1H (CD_3CN): δ 8,74 (dd, 1H), 8,59 (dd, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,96 (m, 1H), 7,45 (dd,

1H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,35 (sa, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,40-3,20 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,17-2,10 (m, 2H), 1,90-1,55 (m, 2H) ppm

EM (ESI): 460 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(3-fenilprop-1-in-1-il)-1,3-tiazol-2-

5 il]piperidin-1-il}etanona (I-52)

Se desprotege luego 4-[4-(3-fenilprop-1-in-1-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (IV-5, 320 mg) de forma análoga al ejemplo II-2 y luego se hace reaccionar de forma análoga al ejemplo I-81 con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (174 mg). Tras purificación cromatográfica se obtiene 2-[5-metil-3-

10 (trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(3-fenilprop-1-in-1-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (33 mg).

RMN ¹H (CD₃CN): δ 7,46 (s, 1H), 7,42-7,34 (m, 4H), 7,30-7,25 (m, 1H), 6,39 (s, 1H), 5,09 (d, 1H), 5,02 (d, 1H), 4,45 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,84 (s, 2H), 3,25 (m, 2H), 2,82 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,18-2,05 (m, 2H), 1,82 (cd, 1H), 1,66 (cd, 1H) ppm

15 EM (ESI): 473 ([M+H]⁺)

1-[4-(4-Etil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (I-86)

Se disuelve en argon 2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil} piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-carbaldehído (200 mg) en metanol 5 ml) y se adiciona carbonato de

20 potasio (215 mg) y fosfonato de dimetil-1-diazo-2-oxopropilo (199 mg). Se agita la mezcla a 40° C. Tras procesar en medio acuoso se extrae con acetato de etilo, se secan los extractos con sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 1-[4-(4-etil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5- metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (67 mg).

25 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,86 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 5,20 (sa, 2H), 4,31 (sa, 1H), 4,08 (s,

1H), 3,98 (sa, 1H), 3,31 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,88 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,13-2,05 (m, 2H), 1,78 (sa, 1H), 1,61 (sa, 1H) ppm

EM (ESI): 383 ([M+H]⁺)

2-[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(trimetilsilil)etnil]-1,3-tiazol-2-

5 il}piperidin-1-il)etanona (I-98)

Se disuelve 1-[4-(4-etnil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1 H-pirazol-1-il]etanona (I-86, 525 mg) en argon a -78° C en tetrahidrofurano (10 ml) y se añade por goteo hexametildisilazano de litio (1M en hexano, 1,40 ml). Después de 10 minutos se añade por goteo durante 10 minutos cloruro de trimetilsililo (179 mg). Después
10 de agitar durante 30 minutos se adiciona solución de cloruro de amonio saturada y se extrae con acetato de etilo. Se secan los extractos orgánicos en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Se purifica el residuo por cromatografía. Se obtiene 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(trimetilsilil)etnil]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)etanona (540 mg).

15 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,70 (s, 1H), 6,27 (s, 1H), 5,08 (d, 1H), 5,01 (d, 1H), 4,12 (da, 1H), 3,76 (da, 1H), 3,05 (t, 1H), 2,59 (t, 1H), 1,97 (s, 3H), 1,88-1,77 (m, 2H), 1,56 (tdd, 1H), 1,30 (tdd, 1H), 0,00 (s, 9H) ppm

EM (ESI): 455 ([M+I]⁺)

1-(4-{4-[(4-Metoxifenil)etnil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-

20 1H-pirazol-1-il]etanona (I-100)

Se añaden a una solución de 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(trimetilsilil)etnil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (I-98, 200 mg) y 1-bromo-4-metoxibenceno (91 mg) en N,N-dimetilformamida desgasificada (2 ml) tetraquis(trifenilfosfn)paladio (0) (25 mg), yoduro de cobre (I) (8 mg) y trietilamina (53
25 mg). Tras calentar a 85° C se añade por goteo fluoruro de tetra-n-butilamonio (1M en

THF, 0,48 ml). A continuación se diluye la mezcla de reacción con agua y se extrae con acetato de etilo. Se secan los extractos orgánicos en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 1-(4-{4-[(4-metoxifenil)etnil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

5 il]etanona (84 mg).

RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,84 (s, 1H), 7,49 (d, 2H), 6,98 (d, 2H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,34 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,15- 2,09 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm

EM (ESI): 489 ([M+H]⁺)

10 **1-(4-{4-[(2-Metoxifenil)etnil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (I-103)**

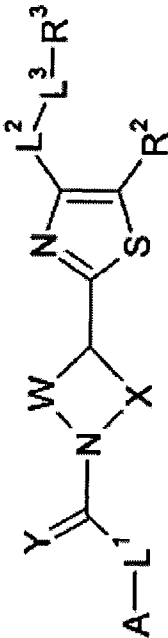
Se añaden a una solución de 1-[4-(4-etnil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (I-86, 150 mg) y 1-yodo-2-metoxibenceno (101 mg) en N,N-dimetilformamida desgasificada (1,5 ml) tetraquis(trifenilfosfin)paladio (0) (25
15 mg), yoduro de cobre (I) (7 mg) y trietilamina (48 mg). Tras agitar a 85° C durante 2 horas se diluye a continuación la mezcla de reacción con agua y se extrae con acetato de etilo. Se secan los extractos orgánicos en sulfato de sodio y se concentra a presión reducida. Tras purificación cromatográfica se obtiene 1-(4-{4-[(2-metoxifenil)etnil]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (100 mg).

20 RMN ¹H (DMSO-d₆): δ 7,86 (s, 1H), 7,47 (dd, 1H), 7,40 (td, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,98 (td, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,23 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,35 (m, 1H), 3,29 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,08 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm

EM (ESI): 489 ([M+H]⁺)

Ejemplos

De forma análoga a los procedimientos previamente indicados se pueden obtener los compuestos de fórmula I indicados en la tabla 1 siguiente.



con

Tabla I

Ej.	A	L ¹	Y	W	X	R ²	L ²	L ³	R ³	log P
I-1	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Fenilo	3,91 ^(b)
I-2	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,52 ^(b)
I-3	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	CH ₂ CHCH ₃	Fenilo	4,84 ^(b)
I-4	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Ciclohexilo	
I-5	3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Ciclohexilo	
I-6	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Ciclohexilo	

I- 17	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	3-(Trifluorometil)fenilo	5,03 ^(b)
I- 18	3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,35 ^(b)
I- 19	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,14 ^(b)
I- 20	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-2-ilo	4,61 ^(b)
I- 21	3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-2-ilo	4,35 ^(b)
I- 22	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-2-ilo	5,08 ^(b)
I- 23	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	CH ₂	Fenilo	4,41 ^(b)
I- 24	3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	CH ₂	Fenilo	
I- 25	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	CH ₂	Fenilo	
I- 26	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	Enlace	Fenilo	3,99 ^(b)

I- 27	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,63 ^(b)
I- 28	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	CF ₃	
I- 29	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	Terc-butilo	
I- 30	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	Etenilo	
I- 31	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	Etinilo	
I- 32	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	Ciclohexilo	
I- 33	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂	Morfolin-4-ilo	
I- 34	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	Enlace	Piridin-3-ilo	
I- 35	5-(Difluorometil)-3-metil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	3,37 ^(b)
I- 36	3,5-Dicloro-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 37	3,5-Dicloro-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 38	2-Bromo-5-(trifluorometil)fenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	

I- 39	5-Bromo-2-metilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 40	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 41	2,5-Dibromofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 42	5-Yodo-2-metilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I- 43	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,89 ^(b)
I- 44	5-(Difluorometil)-3-metil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 45	3,5-Dicloro-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 46	3,5-Dicloro-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 47	2-Cloro-5-(trifluorometil)fenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 48	2-Bromo-5-(trifluorometil)fenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 49	5-Bromo-2-metilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	
I- 50	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,66 ^(c)

I- 51	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Piridin-3-ilo	2,68 ^(b)
I- 52	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	CH ₂	Fenilo	3,88 ^(b)
I- 53	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	3,79 ^(b)
I- 54	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	2,86 ^(a)
I- 55	3-(Trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	3,57 ^(b)
I- 56	3-(Trifluorometil)fenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,26 ^(b)
I- 57	3-Clorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,1 ^(b)
I- 58	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	3,73 ^(b)
I- 59	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,45 ^(b)
I- 60	4-Cloro-5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,34 ^(b)
I- 61	2,5-Bis(trifluorometil)fenilo	Enlace	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,67 ^(b)
I-	3-(Trifluorometil)fenilo	Enlace	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,23 ^(b)

I-74	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	3,85 ^(c)
I-75	Piridin-4-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	
I-76	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	Naftalen-1-ilo	3,73 ^(b)
I-77	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	Enlace	Naftalen-1-ilo	3,58 ^(b)
I-78	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo	4,71 ^(b)
I-79	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	3,39 ^(c)
I-80	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CHCH ₃	Fenilo	4,77 ^(b)
I-81	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,37 ^(b)
I-82	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Piridin-3-ilo	
I-83	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CHCH ₃	Fenilo	3,83 ^(b)
I-84	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	Enlace	Fenilo	3,04 ^(b)
I-85	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (E)	CH ₂ CHCH ₃	Fenilo	3,83 ^(c)

I- 86	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		C≡C	Enlace	H		2,57 ^(b)
I- 87	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo		
I- 88	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo		
I- 89	5-Yodo-2-metilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo		
I- 90	3-Cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo		
I- 91	3-Cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo		
I- 92	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	S	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo		
I- 93	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	S	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH=CH (E)	Enlace	Fenilo		4,65 ^(b)
I- 94	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH=CH (E)	Enlace	3-(Trifluorometil)fenilo		4,46 ^(b)
I- 95	1,3-Benzodioxol-5-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH ₂ CH ₂	Enlace	Fenilo		
I- 96	3,5-Dimetil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H		CH=CH (E)	Enlace	3-(Trifluorometil)fenilo		3,56 ^(b)

I- 97	2,3,6-Trifluorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,71 ^(b)
I- 98	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Trimetilsililo	4,28 ^(b)
I- 99	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Fenilo	3,82 ^(b)
I- 100	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	4-Metoxifenilo	3,79 ^(b)
I- 101	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Clorofenilo	4,12 ^(b)
I- 102	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	4-Clorofenilo	4,37 ^(b)
I- 103	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Metoxifenilo	3,67 ^(b)
I- 104	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,4-Dimetoxifenilo	3,67 ^(b)
I- 105	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,4-Diclorofenilo	4,72 ^(b)
I- 106	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,5-Dimetoxifenilo	3,65 ^(b)
I- 107	3,5-Dietil-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,04 ^(b)
I- 108	5-Etil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,65 ^(b)

I- 109	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,25 ^(b)
I- 110	3-terc-Butil-5- (trifluorometil)-1H- pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,36 ^(b)
I- 111	3-terc-Butil-5- (trifluorometil)-1H- pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,14 ^(b)
I- 112	3-terc-Butil-5- (pentafluorometil)-1H- pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,78 ^(b)
I- 113	3-terc-Butil-5- (pentafluorometil)-1H- pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,54 ^(b)
I- 114	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,03 ^(b)
I- 115	3,5-Dietil-1H-pirazol-1- ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,2 ^(b)
I- 116	5-Etil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,8 ^(b)
I- 117	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	4,41 ^(b)
I- 118	3-terc-Butil-5- (trifluorometil)-1H-	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Naftalen-1-ilo	5,48 ^(b)

I- 140	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Ciclohexilo	5,76 ^(b)
I- 141	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	1,2,3,4- Tetrahidronaftalen- 1-ilo	
I- 142	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Metilfenilo	
I- 143	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Bromofenilo	
I- 144	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2,6-Difluorofenilo	
I- 145	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 146	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	
I- 147	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol- 4-ilo	
I- 148	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Ciclohexilo	4,87 ^(b)
I- 149	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	1,2,3,4- Tetrahidronaftalen- 1-ilo	4,78 ^(b)
I- 150	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Metilfenilo	

I- 151	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Bromofenilo	
I- 152	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2,6-Difluorofenilo	
I- 153	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 154	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	
I- 155	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol-4-ilo	
I- 156	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Ciclohexilo	
I- 157	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	1,2,3,4-Tetrahidronaftalen-1-ilo	
I- 158	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Metilfenilo	4,77 ^(c) 4,67 ^(b)
I- 159	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2-Bromofenilo	
I- 160	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	2,6-Difluorofenilo	4,55 ^(c) 4,48 ^(b)
I- 161	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 162	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₂	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	

169	1H-pirazol-1-ilo								(mezcla de isómeros (Z) y (E))			
I- 170	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	
I- 171	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol-4-ilo	
I- 172	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	Ciclohexilo	4,99 y 5,07 ^(b)
I- 173	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H			CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	1,2,3,4-Tetrahidronaftalen-1-ilo	4,02 y 4,10 ^(b)

I- 174	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Metilfenilo	4,93 ^(b)
I- 175	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Bromofenilo	4,99 ^(b)
I- 176	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2,6-Difluorofenilo	4,88 ^(b)
I- 177	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 178	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	

I- 198	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Metilfenilo	
I- 199	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Bromofenilo	
I- 200	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2,6-Difluorofenilo	
I- 201	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 202	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	

I- 210	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	2,95 ^(c) 2,72 ^(b)
I- 211	5-Metil-3-(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol- 4-ilo	
I- 212	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Metilfenilo	4,73 ^(b)
I- 213	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Bromofenilo	4,74 ^(b)
I- 214	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,6-Difluorofenilo	4,4 ^(b)
I- 215	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 216	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	3,37 ^(b)
I- 217	3,5-Bis(trifluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol- 4-ilo	
I- 218	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Metilfenilo	4,02 ^(c) 3,99 ^(b)
I- 219	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Bromofenilo	4,04 ^(c) 4,04 ^(b)
I- 220	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,6-Difluorofenilo	3,73 ^(c) 3,7 ^(b)
I- 221	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Quinolin-8-ilo	

I- 222	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	2,86 ^(c) 2,68 ^(b)
I- 223	3,5-Bis(difluorometil)- 1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol- 4-ilo	3,09 ^(b)
I- 224	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Metilfenilo	4,91 ^(b)
I- 225	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Bromofenilo	4,91 ^(b)
I- 226	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,6-Difluorofenilo	4,52 ^(b)
I- 227	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Quinolin-8-ilo	
I- 228	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	3,55 ^(c) 3,35 ^(b)
I- 229	2,5-Diclorofenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol- 4-ilo	3,86 ^(b)
I- 230	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Metilfenilo	4,78 ^(c) 4,75 ^(b)
I- 231	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2-Bromofenilo	4,8 ^(c) 4,77 ^(b)
I- 232	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	2,6-Difluorofenilo	4,39 ^(c) 4,36 ^(b)
I- 233	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	Quinolin-8-ilo	

I- 234	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	
I- 235	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	3,5-Dimetilisoxazol-4-ilo	3,71 ^(c) 3,67 ^(b)
I- 236	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	3-Metilpiridin-2-ilo	2,46 ^(b)
I- 237	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (Z)	Enlace	2-Metilfenilo	4,95 ^(c) 4,86 ^(b)
I- 238	2,5-Dimetilfenilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	H	2,93 ^(b) 2,95 ^(c)
I- 239	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	C≡C	Enlace	H	2,45 ^(b)
I- 240	3,5-Bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Cloro-6-fluorofenilo	4,85 5,09 ^(b) y
I- 241	3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla de isómeros (Z) y (E))	Enlace	2-Cloro-6-fluorofenilo	4,09 4,33 ^(b) y
I- 242	5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂	H	CH=CH (mezcla)	Enlace	2-Cloro-6-fluorofenilo	4,48 ^(b)

[illegible]

La determinación de los valores de log P se realizó según el Anexo V.A 8 de la Directiva CEE 79/831 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en columnas de fase inversa (C18), con los siguientes procedimientos:

(a) La determinación se realizó en medio ácido a pH 2,3 con ácidos fosfórico acuoso al 0,1% y acetonitrilo como eluyenes; gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%.

(b) La determinación con la CL-EM en medio ácido se realizó a pH 2,7 con ácido fórmico acuoso al 0,1% y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1%) como eluyentes; gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%.

(c) La determinación con la CL-EM en medio neutro se realizó a pH 7,8 con 0,001 molar de solución de hidrogenocarbonato de amonio acuoso y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1%) como eluyentes; gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%.

La calibración se realizó con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores de $\log P$ son conocidos (determinación de los valores de $\log P$ mediante los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores de $\lambda_{\text{máx}}$ se determinaron en función de los espectros UV de 200 nm a 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Datos de RMN de ejemplos seleccionados

Ejemplo	Datos de RMN
I-1	RMN ^1H δ = 7,46 (m, 2H), 7,31-7,18 (m, 4H), 6,62 (d, 1H), 6,57 (d, 1H), 6,44 (s, 1H), 5,19 (sa, 2H), 4,20 (sa, 1H), 3,90 (sa, 1H), 3,26 (m, 2H), 2,90 (m, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,05(m, 2H), 1,80-1,50(m, 2H) ppm
I-2	RMN ^1H δ = 7,95-7,92 (m, 2H), 7,87-7,84 (m, 1H), 7,52-7,43 (m, 4H), 7,11 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,05 (sa, 1H), 3,74 (sa, 1H), 3,20-3,05 (m, 2H), 2,88 (sa, 1 H), 2,24 (s, 3H), 1,90-1,78 (sa, 2H), 1,50 (sa, 1H), 1,35 (sa, 1H) ppm
I-3	RMN ^1H δ = 7,32 (s, 1H), 7,29-7,22 (m, 4H), 7,15 (m, 1H), 6,44 (s, 1H), 6,35 (d, 1H), 5,60 (m, 1H), 5,20 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,38-3,25 (m, 2H), 3,05-2,84 (m, 4H), 2,22 (s, 3H), 2,17-2,05 (m, 2H), 1,85-1,56 (m, 2H), 1,26 (d, 3H) ppm
I-26	RMN ^1H δ = 7,56 (d, 2H), 7,50 (s, 1 H), 7,39-7,34 (m, 3H), 7,28-7,18 (m, 2H), 6,45 (s, 1H), 5,23 (sa, 2H), 4,37 (sa, 1H), 4,01 (sa, 1H), 3,35 (m, 1H), 3,32 (1,s, 1H), 2,90 (sa, 1 H), 2,23 (s, 3H), 2,18-2,10 (m, 2H), 1,80 (sa, 1 H), 1,63 (sa, 1 H) ppm
I-27	RMN ^1H δ = 8,23 (d, 1H), 8,16 (d, 1 H), 7,95 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,83 (d, 1 H), 7,64 (s, 1H), 7,63-7,51 (m, 3H), 7,27 (d, 1H), 6,46 (s, 1H), 5,24 (sa, 2H), 4,38 (sa, 1H), 4,03 (sa, 1H), 3,40 (m, 1H), 3,32 (sa, 1H), 2,94 (sa, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,23-2,12 (m, 2H), 1,85 (sa, 1H), 1,70 (sa, 1H) ppm
I-50	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 8,39 (d, 1H), 7,96 (d, 2H), 7,80 (d, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,67-7,50 (m, 3H), 6,37 (s, 1H), 5,05 (s, 2H), 4,45 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,40-3,20 (m, 2H), 2,93 (sa, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,25-2,15 (m, 2H), 1,90-1,75 (m, 2H) ppm
I-51	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 8,74 (dd, 1H), 8,59 (dd, 1H), 7,99 (s, 1 H), 7,96 (m, 1 H), 7,45 (dd, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,35 (sa, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,40-3,20 (m, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,17-2,10 (m, 2H), 1,90-1,55 (m, 2H) ppm
I-52	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,46 (s, 1H), 7,42-7,34(m, 4H), 7,30-7,25 (m, 1H), 6,39(s, 1H), 5,09 (d, 1H), 5,02 (d, 1H), 4,45 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,84 (s, 2H), 3,25 (m, 2H), 2,82 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,18-2,05 (m, 2H), 1,82 (cd, 1H), 1,66 (cd, 1H) ppm
I-53	RMN ^1H δ = 7,28-7,26 (m, 2H), 7,22-7,2 1 (m, 2H), 7,19-7,15 (m, 2H), 6,51 (s,

	1H), 5,33 (d, 1H), 5,25 (d, 1H), 4,36 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,35-3,20 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,82 (t, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,09 (d, 1H), 2,07 (d, 1H), 1,78 (m, 1H), 1,53 (m, 1H) ppm
I-54	RMN ^1H δ = 7,26-7,13 (m, 5H), 7,06 (s, 1H), 5,77 (s, 1H), 4,91 (sa, 2H), 4,28 (m, 1H), 4,03 (m, 1H), 3,25 (m, 1H), 3,16 (m, 1H), 2,97 (m, 4H), 2,85 (m, 1H), 2,11 (s, 3H), 2,10-1,97 (m+s, 5H), 1,61 (m, 2H) ppm
I-55	RMN ^1H δ = 7,85 (d, 1H), 7,26-7,13 (m, 5H), 7,06 (s, 1H), 6,66 (d, 1H), 5,27 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,26 (m, 1H), 3,20-2,80 (m+s, 6H), 2,07 (m, 2H), 1,80-1,50 (m, 2H) ppm
I-57	RMN ^1H δ = 7,34-7,12 (m, 9H), 7,04 (s, 1H), 4,38 (sa, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,75 (s, 2H), 3,27-2,98 (m, 2H), 2,96 (m, 4H), 2,80 (sa, 1H), 2,02 (m, 2H), 1,51 (m, 2H) ppm
I-58	RMN ^1H δ = 7,27-7,21 (m, 2H), 7,20-7,14 (m, 3H), 7,05 (s, 1H), 4,37 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,26-3,18 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,80 (sa, 1H), 2,33 (t, 2H), 2,04 (d, 2H), 1,55 (sa, 2H), 1,50 (tt, 2H), 1,33 (tg, 2H), 0,90 (t, 3H) ppm
I-59	RMN ^1H δ = 7,47 (s, 1H), 7,26-7,13 (m, 5H), 7,07 (s, 1H), 5,46 (m, 2H), 4,27 (sa, 1H), 3,93 (sa, 1H), 3,30 (m, 1H), 3,20-2,85 (m+s, 6H), 2,05 (m, 2H), 1,79 (sa, 1H), 1,57 (sa, 1H) ppm
I-60	RMN ^1H δ = 7,26-7,13 (m, 5H), 7,07 (s, 1H), 5,29 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,92 (sa, 1H), 3,28 (m, 1H), 3,20 (m, 1H), 3,00-2,80 (m, 5H), 2,20 (s, 3H), 2,07 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,60 (sa, 1H) ppm
I-61	RMN ^1H δ = 8,07-7,90 (m, 3H), 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,14 (m, 3H), 7,08 (s, 1H), 4,50 (d, 1H), 3,35-3,23 (m, 4H), 2,97 (s, 4H), 2,22-2,10 (m, 1H), 2,00-1,87 (m, 2H), 1,87-1,45 (m, 2H) ppm
I-63	RMN ^1H δ = 7,44-7,43 (m, 1H), 7,28-7,12 (1H, 6H), 7,05 (s, 1H), 6,99 (d, 1H), 4,38 (sa, 1H), 3,99 (sa, 1H), 3,72 (s, 2H), 3,22-3,15 (m, 2H), 2,96 (s, 4H), 2,81 (sa, 1H), 2,00 (d, 2H), 1,52 (m, 2H) ppm
I-64	RMN ^1H δ = 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,13 (m, 3H), 7,06 (s, 1H), 5,70 (m, 1H), 4,30 (sa, 1H), 4,00 (sa, 1H), 3,30-3,19 (m, 2H), 2,96 (s, 5H), 2,26 (d, 3H), 2,08-1,96 (m, 2H), 1,64-1,54 (m, 5H) ppm
I-65	RMN ^1H δ = 7,40 (s, 1H), 7,26-7,15 (m, 5H), 7,06 (s, 1H-E), 4,35 (sa, 1H), 4,05 (sa, 1H), 3,76 (s, 3H), 3,49 (s, 2H), 3,30-3,19 (m, 2H), 2,99 (s, 4H), 2,82 (sa, 1H), 2,08-2,00 (m, 2H), 1,58 (sa, 2H) ppm

I-66	RMN ^1H δ = = 7,26-7,21 (m, 2H), 7,20-7,12 (m, 3H), 7,05 (s, 1H), 6,85-6,80 (m, 3H), 6,75- 6,71 (dd, 1H), 3,93 (sa, 1H), 3,74 (s, 3H), 3,69 (s, 3H), 3,20 (m, 1H), 2,96 (s, 4H), 1,80-2,74 (m, 2H), 2,65-2,55 (sa, 2H), 2,04-1,97 (m, 2H), 1,58-1,42 (m, 2H), 1,28 (t, 2H) ppm
I-67	RMN ^1H δ = 7,7 1-7,58 (m, 3H), 7,27-7,12 (m, 5H), 7,07 (s, 1H), 4,37 (sa, 1H), 4,05 (sa, 1H), 3,97 (s, 2H), 3,35-3,23 (m, 2H), 2,97 (s, 4H), 2,88 (sa, 1H), 2,07 (d, 2H), 1,65 (sa, 2H) ppm
I-68	RMN ^1H δ = 7,99 (d, 1H), 7,26-7,12 (m, 5H), 7,05 (s, 1H), 6,69 (d, 1H), 5,74 (q, 1H), 4,40-3,95 (m, 2H), 3,24 (m, 1H), 3,20-2,75 (m+s, 6H), 2,05 (m, 2H), 1,30-1,70 (m+d, 5H) ppm
I-70	RMN ^1H (CD ₃ CN) δ = 8,10 (s, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,60 (d, 1H), 7,29-7,15 (m, 6H), 7,07 (dd, 1H), 6,87 (s, 1H), 5,45 (d, 1H), 5,36 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 4,00 (d, 1H), 3,35-3,23 (m, 2H), 3,00 (s, 4H), 2,86(1, 1H), 2,18-2,06 (m, 2H), 1,80 (cd, 1H), 1,66 (cd, 1H) ppm
I-71	RMN ^1H δ = 8,03 (d, 1H), 7,93 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,40 (t, 1H), 7,25-7,16 (m, 5H), 7,06 (s, 1H), 4,40 (sa, 1H), 4,34 (s, 2H), 4,09 (sa, 1H), 3,40-3,15 (m, 3H), 2,96 (s, 4H), 2,08- 2,02 (m, 2H), 1,65 (sa, 2H) ppm
I-74	RMN ^1H δ = 8,31 (d, 1H), 8,02 (d, 2H), 7,82 (d, 1H), 7,69 (t, 1H), 7,63 - 7,51 (m, 3H), 5,79 (s, 1H), 4,95 (s, 2H), 3,41 - 3,32 (m, 2H), 2,19 - 2,09 (m, 3H), 2,12 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,81 - 1,53 (m, 4H) ppm
I-76	RMN ^1H δ = = 8,21 (d, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,95 (d, 1 H), 7,89 (d, 1H), 7,84 (d, 1 H), 7,62 - 7,51 (m, 4H), 7,28 (d, 1H), 5,79 (s, 1H), 4,92 (s, 1H), 3,42 - 3,31 (m, 2H), 2,21 - 2,09 (m, 3H), 2,12 (s, 3H), 2,07 (s, 3H), 1,85 - 1,59 (m, 4H) ppm
I-77	RMN ^1H δ = 7,29 (dd, 2H), 7,85 (dd, 1 H), 7,55 - 7,41 (m, 4H), 7,11 (d, 1H), 6,90 (t, 2H), 5,79 (s, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,10 (m, 1H), 2,51 (m, 2H), 2,11 (s, 3H), 2,06 (s, 3H), 2,88 -2,72 (m, 2H), 1,49 - 1,31 (m, 4H) ppm
I-78	RMN ^1H δ = 7,27-7,22 (m, 2H), 7,18-7,13 (m, 3H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,38 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,33-3,20 (m, 2H), 2,94 (s, 4H), 2,93 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,09-2,02 (m, 2H), 1,80-1,50 (m, 2H) ppm
I-79	RMN ^1H δ = 8,09 (d, 1H), 7,89 (d, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,56 - 7,43 (m, 2H), 7,41 - 7,32 (m, 2H), 7,11 (s, 1H), 5,78 (s, 1H), 4,92 (s, 2H), 3,47 - 3,41 (m, 4H), 3,46 - 3,22 (m, 3H), 2,12(s, 3H), 2,09 -2,02(m, 2H), 2,06(s, 3H), 1,77 - 1,49 (m, 4H) ppm

I-80	RMN ^1H δ = 7,28-7,23 (m, 2H), 7,19-7,14 (m, 3H), 7,02 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 5,20 (sa, 2H), 4,30 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,30-3,20 (m, 2H), 2,87 (sa, 1H), 2,72 (m, 1H), 2,67-2,62 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,07-2,02 (m, 2H), 1,72 (sa, 1H), 1,63-1,47 (m, 5H), 1,19 (d, 3H) ppm
I-81	RMN ^1H δ = 8,09 (d, 1 H), 7,90 (d, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,56-7,46 (m, 2H), 7,42-7,33 (m, 2H), 7,12 (s, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,31 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,44 (t, 2H), 3,35-3,26 (m, 2H), 3,15-3,05 (m, 2H), 2,90 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,05 (m, 2H), 1,75 (sa, 1 H), 1,62 (sa, 1H) ppm
I-83	RMN ^1H δ = 7,32-7,21 (m, 2H), 7,19-7,11 (m, 4H), 7,02 (s, 1H), 5,75 (s, 1H), 4,87 (s, 1H), 3,26 - 3,12 (m, 2H), 2,72 - 2,68 (m, 2H), 2,67 - 2,59 (m, 4H), 2,11 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 2,02- 1,91 (m,4H), 1,61 - 1,42(m,4H), 1,19 (d,3H) ppm
I-84	RMN ^1H δ = 7,56 (d, 2H), 7,50 (s, 1H), 7,37 (d, 2H), 7,34 (s, 1H), 7,30 - 7,16 (m, 2H), 5,79 (s, 1H), 4,93 (s, 2H), 3,41 - 3,26 (m, 2H), 2,93 - 2,76 (m, 1H), 2,12 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 2,11 - 2,03 (m, 2H), 1,78 - 1,54 (m, 4H) ppm
I-85	RMN ^1H δ = 7,31 - 7,21 (m, 5H), 7,19 - 7,12 (m, 1H), 6,33 (d, 1H), 5,79 (s, 1H), 5,62 -5,52 (m, 1H), 4,92 (s, 2H), 4,38 - 4,12 (m, 1H), 4,12 - 3,92 (m, 1 H), 3,33 - 3,22 (m, 2H), 2,96 - 2,81 (m, 4H), 2,10 (s, 3H), 2,03 (s, 3H), 1,72 - 1,53 (m, 4H), 1,21 (d, 3H) ppm
I-86	RMN ^1H δ = 7,86 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 5,20 (sa, 2H), 4,31 (sa, 1H), 4,08 (s, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,31 (ni, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,88 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,13-2,05 (m, 2H), 1,78 (sa, 1H), 1,61 Çsa, 1H) ppm
I-93	RMN ^1H (CD ₃ CN) δ = 7,55 (d, 2H), 7,43 (d, 1 H), 7,37 (t, 2H), 7,30-7,28 (m, 2H), 7,18 (d, 1 H), 6,39 (s, 1H), 5,41 (d, 1H), 5,26 (s, 2H), 4,42 (d, 1 H), 3,54 (1, 1H), 3,45 (m, 1H), 3,38 (t, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,30-2,23 (m, 2H), 1,95-1,80 (m, 2H) ppm
I-94	RMN ^1H δ = 7,91 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,61 - 7,49 (m, 2H), 7,47 (s, 1H), 6,65 (s, 1H), 6,44 (s, 1H), 5,12 (s, 1H), 3,29 - 3,18 (m, 2H), 2,89 - 2,74 (m, 1H), 2,23 - 2,17 (m, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,01 (d, 2H), 1,72 - 1,61 (m, 2H), 1,61 - 1,49(m, 2H) ppm
I-96	RMN ^1H δ = 7,92 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,61 - 7,51 (ni, 2H), 7,45 (s, 1 H), 6,64 (s, 1 H), 5,78 (s, 1H), 4,85 (s, 1H), 3,28 - 3,12 (m, 2H), 3,11 - 3,05 (m, 1H), 2,12 - 2,09 (m, 2H), 2,10 (s, 3H), 2,05 (s, 3H), 1,98 (d, 2H), 1,63 - 1,48 (m, 4H) ppm

I-97	RMN ^1H δ = 8,34 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,01 (d, 2H), 7,83 (dd, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,62 (m, 1H), 7,57 (dd, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 4,37 (sa, 1H), 4,15 (sa, 1H), 3,86 (sa, 2H), 3,40 (m, 1H), 3,34 (sa, 1H), 2,88 (sa, 1H), 2,16 (sa, 2H), 1,78 (sa, 1H), 1,64 (sa, 1H) ppm
I-98	RMN ^1H δ = 7,70 (s, 1H), 6,27 (s, 1H), 5,08 (d, 1H), 5,01 (d, 1H), 4,12 (bd, 1H), 3,76 (bd, 1H), 3,05 (t, 1H), 2,59 (t, 1H), 1,97 (s, 3H), 1,88-1,77 (m, 2H), 1,56 (tdd, 1H), 1,30 (tdd, 1H), 0,00 (s, 911) ppm
I-99	RMN ^1H δ = 7,92 (s, 1H), 7,57-7,54 (m, 2H), 7,45-7,41 (m, 3H), 6,45 (s, 1H), 5,23 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,36 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,16-2,08 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-100	RMN ^1H δ = 7,84 (s, 1H), 7,49 (d, 2H), 6,98 (d, 2H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,34 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,15-2,09 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-101	RMN ^1H δ = 7,99 (s, 1H), 7,67 (dd, 1H), 7,56 (dd, 1H), 7,45 (td, 1H), 7,39 (td, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,23 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,37 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,09 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-102	RMN ^1H δ = 7,95 (s, 1H), 7,60-7,55 (m, 2H), 7,52-7,46 (m, 2H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,35 (m, 1H), 3,28 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,15-2,08 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-103	RMN ^1H δ = 7,86 (s, 1H), 7,47 (dd, 1H), 7,40 (td, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,98 (td, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,23 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,35 (m, 1H), 3,29 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,08 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-104	RMN ^1H δ = 7,81 (s, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,56 (dd, 1H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,33 (sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,81 (s, 3H), 3,34 (m, 1H), 3,29 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,22 (s, 3H), 2,15-2,07 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,64 (sa, 1H) ppm
I-105	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,67 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,38 (dd, 1H), 6,37 (s, 1H), 5,04 (sa, 2H), 4,46 (sa, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,33 (m, 1H), 3,29 (sa, 1H), 2,90 (sa, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,20-2,13 (m, 2H), 1,90-1,66 (m, 2H) ppm
I-106	RMN ^1H δ = 7,87 (s, 1H), 7,04-6,95 (m, 3H), 6,45 (s, 1H), 5,22 (sa, 2H), 4,33

	(sa, 1H), 3,98 (sa, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 3,34 (m, 1R), 3,29 (sa, 1H), 2,89 (sa, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15-2,08 (m, 2H), 1,80 (sa, 1H), 1,63 (sa, 1H) ppm
I-123	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,44 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 7,18 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 6,40 (s, 1H), 5,11 (d, 1H), 5,04 (d, 1H), 4,45 (da, 1H), 3,91 (bd, 1H), 3,27 (m, 1H), 3,09 (t, 2H), 3,00 (t, 2H), 2,84 (td, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (da, 1H), 2,10 (da, 1H), 1,81 (tdd, 1H), 1,63 (tdd, 1H) ppm
I-124	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 8,40 (d, 1H), 7,98 (d, 2H), 7,82 (dd, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,68 (m, 1H), 7,62 (m, 1H), 7,56-7,45 (m, 3H), 7,33 (dd, 1H), 4,45 (da, 1H), 4,06 (bd, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,36 (m, 1H), 3,30 (t, 1H), 2,84 (t, 1H), 2,25-2,10 (m, 2H), 1,84 (m, 1H), 1,70 (m, 1H) ppm
I-125	RMN ^1H δ = 7,93 (s, 1H), 7,46-7,40 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 4,45-4,35 (m, 1H), 4,23 (s, 1H), 4,11-4,02 (m, 1H), 3,87 (d, 2H), 2,88-2,72 (m, 1H), 2,15-2,00 (m, 2H), 1,79-1,66 (m, 1H), 1,60-1,46 (m, 1H)
I-126	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,16-7,05 (m, 4H), 6,87 (s, 1H), 6,39 (s, 1H), 5,11 (d, 1H), 5,03 (d, 1H), 4,46 (d, 1H), 3,91 (d, 1H), 3,32-3,23 (m, 2H), 3,01-2,93 (m, 4H), 2,84 (t, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,18-2,07 (m, 2H), 1,82 (tdd, 1H), 1,65 (tdd, 1H)
I-128	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,28-7,19 (m, 1H), 6,96-6,88 (m, 3H), 6,39 (s, 1H), 5,10 (d, 1H), 5,03 (d, 1H), 4,43 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,32-3,19 (m, 2H), 3,07-2,94 (m, 4H), 2,88 (td, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,16-2,03 (m, 2H), 1,79 (tdd, 1H), 1,62 (tdd, 1H)
I-132	RMN ^1H δ = 7,12 (s, 1H), 6,49 (s, 1H), 5,31 (d, 1H), 5,22 (d, 1H), 4,35 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,45-3,20 (m, 2H), 2,82 (dd, 1H), 2,67 (dd, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,06 (dd, 2H), 1,80-1,49 (m, 8H), 1,30-1,09 (m, 5H), 0,98-0,85 (m, 2H) ppm
I-133	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,16-7,12 (m, 1H), 7,11-7,02 (m, 3H), 6,93 (s, 1H), 6,38 (s, 1H), 5,08 (d, 1H), 5,01 (d, 1H), 4,45 (da, 1H), 3,99 (bd, 1H), 3,28-3,18 (m, 2H), 2,86-2,65 (m, 5H), 2,21 (s, 3H), 2,17-2,03 (m, 3H), 1,94-1,57 (m, 8H) ppm
I-134	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,17 (s, 1H), 7,14-7,07 (m, 4H), 6,88 (s, 1H), 5,35 (d, 1H), 5,28 (d, 1H), 4,43 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 3,31-3,24 (m, 2H), 3,00-2,95 (m, 4H), 2,86 (ddd, 1H), 2,27 (s, 3H), 2,16 (d, 1H), 2,10 (d, 1H), 1,82 (tdd, 1H), 1,65 (tdd, 1H) ppm

I-136	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,21 (m, 1H), 7,17 (s, 1H), 6,94-6,86 (m, 3H), 5,34 (d, 1H), 5,28 (d, 1H), 4,39 (d, 1H), 3,84 (d, 1H), 3,30-3,22 (m, 2H), 3,02 (t, 2H), 2,97(t, 2H), 2,87 (ddd, 1H), 2,13 (d, 1H), 2,06 (d, 1H), 1,79 (tdd, 1H), 1,61 (tdd, 1H) ppm
I-138	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 8,32 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,17 (s, 1H), 7,06 (dd, 1H), 6,89 (s, 1H), 5,34 (d, 1H), 5,28 (d, 1H), 4,42 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 3,30-3,23 (m, 2H), 3,12 (s, 4H), 2,86 (ddd, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (d, 1H), 2,09 (d, 1H), 1,80 (tdd, 1H), 1,62 (tdd, 1H) ppm
I-140	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,17 (s, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,35 (d, 1H), 5,27 (ci, 1H), 4,42 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 3,32-3,21 (m, 2H), 2,86 (ddd, 1H), 2,75-2,67 (m, 2H), 2,20-2,04 (m, 2H), 1,85-1,50 (m, 9H), 1,42-1,12 (m, 4H), 1,00-0,88 (m, 2H) ppm
I-148	RMN ^1H δ = 7,18 (t, 1H), 7,13 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,91 (s, 1H), 5,43 (d, 1H), 5,35 (s, 1H), 4,32 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 3,30-3,21 (m, 2H), 2,82 (dd, 1H), 2,67 (dd, 2H), 2,10- 2,00 (m, 2H), 1,83-1,48 (m, 8H), 1,35-1,10 (m, 5H), 0,95-0,85 (m, 2H) ppm
I-149	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,17-7,10 (m, 1H), 7,11-7,03 (m, 3H), 6,95 (s, 1H), 6,89(t, 1H), 6,82 (s, 1H), 6,78 (t, 1H), 5,23 (d, 1H), 5,17 (d, 1H), 4,44 (da, 1H), 3,88 (da, 1H), 3,30-3,21 (m, 2H), 2,98-2,67 (m, 5H), 2,15-2,03 (m, 3H), 1,94-1,58 (tu, 8H) ppm
I-158	RMN ^1H δ = 7,18-7,05 (m, 5H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,47 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 3,70 (d, 1H), 3,62 (d, 1H), 3,35-3,22 (m, 2H), 2,95-2,85 (m, 4H), 2,78 (t, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,10-1,94 (m, 2H), 1,61-1,45 (m, 2H)
I-160	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,28-7,17 (m, 1H), 7,05(d, 1H), 6,96(d, 1H), 6,95-6,85(m, 4H), 4,52 (d, 1H), 3,93 (4, 1H), 3,68 (d, 1H), 3,62 (d, 1H), 3,26-3,11 (m, 2H), 3,06-2,92 (m, 4H), 2,79 (td, 1H), 2,26 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 2,09-1,97 (m, 2H), 1,60 (cd, 2H)
I-166	RMN ^1H δ = 7,65-7,54 (m, 2H), 7,25-7,10 (m, 4H), 6,88 y 6,74 (s, 1H), 6,50 (s, 1H), 5,37-5,18 (m, 2H), 4,40 y 4,20 (d, 1H), 4,00 y 3,85 (d, 1H), 3,42-3,18 (m, 2H), 2,85 (dd, 1H), 2,38 y 2,20 (s, 3H), 2,22 y 2,20 (s, 3H), 2,19-2,10 y 2,05-1,93 (m, 2H), 1,83 y 1,67 (tdd, 1 H), 1,59 y 1,48 (tdd, 1H) ppm
I-167	RMN ^1H δ = 7,86 (dd, 1H), 7,67-7,62 (m, 2H), 7,56 (dd, 1H), 7,43 (dd, 1H),

	7,27 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 6,50 (s, 1H), 5,34 (d, 1H), 5,24 (d, 1H), 4,40 (d, 1H), 3,99 (d, 1H), 3,45- 3,20 (m, 2H), 2,83 (dd, 1H), 2,20 (s, 3H), 2,18-2,08 (m, 2H), 1,82 (tdd, 1H), 1,58 (tdd, 1H) ppm
I-172	RMN ^1H δ = 7,37 y 7,30 (s, 1H), 6,49 (s, 1H), 6,44 y 5,49 (dd, 1H), 6,35 y 6,24 (d, 1H), 5,35-5,18 (m, 2H), 4,37 y 4,29 (d, 1H), 3,95 (sa, 1H), 3,35-3,13 (m, 3H), 2,93 y 2,82 (dd, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,18-2,02 (m, 2H), 1,85-1,48 (m, 6H), 1,35-1,05 (m, 6H) ppm
I-173	RMN ^1H δ = 7,51 y 7,34 (s, 1H), 7,13-7,04 (m, 4H), 6,54 y 5,67 (dd, 1H), 6,48 y 6,47 (s, 1H), 6,45 y 6,38 (d, 1H), 5,30 y 5,29 (d, 1H), 5,21 y 5,19 (d, 1H), 4,94 y 3,62 (m, 1H), 4,32 y 4,29 (d, 1H), 3,94 (m, 1H), 3,36-3,20 (m, 2H), 2,92-2,73 (m, 3H), 2,20 y 2,18 (s, 3H), 2,16-1,63 (m, 7H), 1,58 (m, 1H) ppm
I-174	RMN ^1H δ = 7,65-7,55 (m, 3H), 7,24-7,17 (m, 4H), 7,15 y 7,11 (s, 1H), 6,89 y 6,72 (s, 1H), 5,65-5,46 (m, 2H), 4,37 y 4,16 (d, 1H), 3,98 y 3,82 (d, 1H), 3,43-3,19 (m, 2H), 2,87 (dd, 1H), 2,38 y 2,20 (s, 3H), 2,18-2,10 y 2,05-1,92 (m, 2H), 1,82 y 1,66 (tdd, 1H), 1,58 y 1,43 (tdd, 1H) ppm
I-175	RMN ^1H δ = 7,84 (dd, 1H), 7,67-7,56 (m, 4H), 7,41 (t, 1H), 7,27 (d, 1H), 7,23 (td, 1H), 5,62 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,98 (d, 1H), 3,45-3,15 (m, 2H), 2,87 (dd, 1H), 2,18-2,09 (m, 2H), 1,82 (tdd, 1H), 1,56 (tdd, 1H) ppm
I-180	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,17 (s, 1H), 7,13 y 7,02 (s, 1H), 6,49 y 5,55 (dd, 1H), 6,37 y 6,23 (d, 1H), 5,34 (d, 1H), 5,31 (d, 1H), 4,43 y 4,37 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 3,37- 3,18 (m, 31H), 2,96 y 2,87 (ddd, 1H), 2,22-2,07 (m, 2H), 1,95-1,52 (m, 6H), 1,42-1,08 (m, 6H) ppm
I-181	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,25-7,03 (m, 6H), 6,58 y 5,71 (dd, 1H), 6,46 y 6,39 (d, 1H), 5,35-5,23 (m, 2H), 4,98 y 4,67 (m, 1H), 4,42 y 4,34 (d, 1H), 3,84 y 3,63 (m, 1H), 3,34-3,23 (m, 2H), 2,96-2,65 (m, 3H), 2,20-2,04 (m, 2H), 2,00-1,58 (m, 611) ppm
I-182	RMN ^1H δ = 7,65-7,57 (m, 2H), 7,33-6,70 (m, 8H), 5,43-5,33 (m, 2H), 4,38 y 4,17 (da, 1H), 3,99 y 3,84 (da, 1H), 3,43-3,18 (m, 2H), 2,85 (t, 1H), 2,38 y 2,20 (s, 3H), 2,17-1,90 (m, 2H), 1,88-1,42 (m, 2H) ppm
I-183	RMN ^1H δ = 7,86 (ddd, 1H), 7,68-7,62 (m, 2H), 7,55 (dd, 1H), 7,45-7,38 (m, 1H), 7,27 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,50-5,32 (m, 2H), 4,38 y 4,12 (d, 1H), 3,99 y 3,80 (d, 1H), 3,45-3,15 (m, 2H), 2,86 (dd, 1H), 2,18-2,08 (m, 2H), 1,95 y 1,83 (tdd, 1H), 1,59 y 1,43 (tdd, 1H) ppm

I-188	RMN ^1H δ = 7,37 y 7,30 (s, 1H), 7,18 y 7,16 (t, 1H), 7,03 y 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 6,44 y 5,49 (dd, 1H), 6,35 y 6,24 (d, 1H), 5,45-5,30 (m, 2H), 4,35 y 4,28 (d, 1H), 3,94(d, 1H), 3,40-3,15 (m, 3H), 2,93 y 2,82 (dd, 1H), 2,20-2,02 (m, 2H), 1,85-1,48 (m, 6H), 1,37-1,05 (m, 6H) ppm
I-189	RMN ^1H δ = 7,52 y 7,38 (s, 1H), 7,17 y 7,15 (t, 1H), 7,13-7,03 (m, 4H), 7,03 y 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 6,54 y 5,67 (dd, 1H), 6,45 y 6,38 (d, 1H), 5,45-5,32 (m, 2H), 4,95 y 3,63 (dd, 1H), 4,33 y 4,28 (d, 1H), 3,96-3,90 (m, 1H), 3,40-3,20 (m, 2H), 2,85 y 2,80 (dd, 1H), 2,82-2,70 (m, 2H), 2,16-1,68 (m, 6H), 1,60-1,49 (m, 2H) ppm
I-206	RMN ^1H (CD_3CN) δ = 7,62 (s, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,3 3-7,26 (m, 2H), 7,25-7,17 (m, 1H), 6,39 (s, 1H), 5,10 (d, 1H), 5,03 (d, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,36-3,21 (m, 2H), td (2,84, 1H), 2,48 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,20-2,09 (m, 2H), 1,85 (tdd, 1H), 1,68 (tdd, 1H)
I-207	RMN ^1H δ = 8,05 (s, 1H), 7,76 (dd, 1H), 7,68 (dd, 1H), 7,46 (td, 1H), 7,38 (td, 1H), 6,49 (s, 1H), 5,32 (d, 1H), 5,23 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,98 (d, 1H), 3,43-3,20 (m, 2H), 2,84 (t, 1H), 2,20(s, 3H), 2,09 (t, 2H), 1,82 (tdd, 1H), 1,58 (tdd, 1H)
I-208	RMN ^1H δ = 8,14 (s, 1H), 7,62-7,51 (m, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,26 (d, 1H), 6,49 (s, 1H), 5,32 (d, 1H), 5,23 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,97 (d, 1H), 3,44-3,20 (m, 2H), 2,85 (t, 1H), 2,21 (s,3H), 2,12 (t, 2H), 1,89-1,76 (m, 1H), 1,65-1,50 (m, 1H)
I-210	RMN ^1H δ = 8,44 (d, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,49 (s, 1H), 5,32 (d, 1H), 5,23 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,98 (d, 1H), 3,44-3,21 (m, 2H), 2,85 (t, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,08-1,96 (m,2H), 1,88-1,65 (m, 1H), 1,65-1,51 (m, 1H)
I-212	RMN ^1H δ = 7,98 (s, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,33 (m, 2H), 7,24 (m, 1H), 5,60 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,34 (m, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,40-3,25 (m, 2H), 2,86 (m, 1H), 2,45 (s, 3H), 2,09 (m,2H), 1,80 (m, 1H), 1,55 (m, 1H) ppm
I-213	RMN ^1H δ = 8,05 (s, 1H), 7,76 (dd, 1H), 7,68 (dd, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,45 (td, 1H), 7,36 (td, 1H), 5,60 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,34 (m, 1H), 3,95 (m, 1H), 3,25-3,39 (m, 2H), 2,86 (m, 1H), 2,10 (m, 2H), 1,80 (m, 1H), 1,55 (m, 1H) ppm
I-214	RMN ^1H δ = 8,14 (s, 1H), 7,60-7,52 (m, 2H), 7,3 1-7,25 (m, 2H), 5,59 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,33 (m, 1H), 3,96 (m, 1H), 3,49-3,15 (m, 2H), 2,86 (m, 1H), 2,11

	(m, 2H), 1,80 (m, 1H), 1,54 (m, 1H) ppm
I-216	RMN ^1H δ = 8,44 (dd, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,34 (dd, 1H), 5,60 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,34 (m, 1H), 3,97 (m, 1H), 3,42-3,26 (m, 2H), 2,87 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,81 (m, 1H), 1,56 (m, 1H) ppm
I-218	RMN ^1H δ = 7,98 (s, 1H), 7,60-7,50 (m, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,30-7,21 (m, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,43 (d, 2H), 4,41-4,32 (m, 1H), 4,02-3,91 (m, 1H), 2,90-2,80 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,19-2,05 (m, 2H), 1,90-1,73 (m, 1H), 1,65-1,52 (m, 1H)
I-219	RMN ^1H δ = 8,05 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,46 (t, 1H), 7,39 (t, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,39 (d, 2H), 4,40-4,29 (m, 1H), 4,01-3,91 (m, 1H), 2,92-2,81 (m, 1H), 2,19-2,06 (m, 2H), 1,89-1,74 (m, 1H), 1,65-1,50 (m, 1H)
I-220	RMN ^1H δ = 8,14 (s, 1H), 7,65-7,52 (m, 1H), 7,30-7,21 (m, 2H), 7,18 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,39 (d, 2H), 4,40-4,29 (m, 1H), 4,02-3,91 (m, 1H), 2,90-2,77 (m, 1H), 2,18-2,02 (m, 2H), 1,90-1,76 (m, 1H), 1,68-1,51 (m, 1H)
I-222	RMN ^1H δ = 8,45 (sa, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,38-7,33 (m, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,39 (d, 2H), 4,39-4,31 (m, 1H), 4,01-3,92 (m, 1H), 3,00-2,78 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,18-2,03 (m, 2H), 1,89-1,76 (m, 1H), 1,65-1,52 (m, 1H)
I-223	RMN ^1H δ = 8,02 (s, 1H), 7,15 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,38 (d, 2H), 4,39-4,30 (m, 1H), 4,04-3,91 (m, 1H), 2,87-2,79 (m, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,16-2,04 (m, 2H), 1,90-1,73 (m, 1H), 1,62-1,49 (m, 1H)
I-224	RMN ^1H δ = 7,98 (s, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,47-7,42 (m, 2H), 7,39-7,32 (m, 3H), 7,27-7,20 (m, 1H), 4,46-4,38 (m, 1H), 4,12-4,04 (m, 1H), 3,88 (d, 2H), 2,85-2,76 (m, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,17-2,05 (m, 2H), 1,79-1,67 (m, 1H), 1,62-1,48 (m, 1H)
I-225	RMN ^1H δ = 8,05 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,50-7,44 (m, 3H), 7,41-7,30 (m, 2H), 4,46-4,36 (m, 1H), 4,11-4,02 (m, 1H), 3,87 (d, 2H), 2,86-2,74 (m, 1H), 2,17-2,05 (m, 2H), 1,80-1,68 (m, 1H), 1,64-1,50 (m, 1H)
I-226	RMN ^1H δ = 8,13 (s, 1H), 7,65-7,52 (m, 2H), 7,49-7,43 (m, 2H), 7,35 (d, 1H), 7,25 (t, 1H), 4,46-4,37 (m, 1H), 4,13-4,04 (m, 1H), 3,88 (d, 2H), 2,86-2,75 (m, 1H), 2,18-2,04 (m, 2H), 1,80-1,69 (m, 1H), 1,62-1,50 (m, 1H)
I-228	RMN ^1H δ = 8,46 (sa, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,76 (d, 1H), 7,68-7,52 (m, 1H), 7,48-

	7,42 (m, 2H), 7,39-7,32 (m, 1H), 4,46-4,39 (m, 1H), 4,13-4,04 (m, 1H), 3,87 (d, 2H), 2,88-2,75 (m, 1H), 2,47 (s, 3H), 2,18-2,05 (m, 2H), 1,81-1,69 (m, 1H), 1,62-1,50 (m, 1H)
I-229	RMN ^1H δ = 8,01 (s, 1H), 7,47-7,41 (m, 2H), 7,34 (d, 1H), 4,44-4,35 (m, 1H), 4,12-4,04 (m, 1H), 3,87 (d, 2H), 2,86-2,75 (m, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,17-2,04 (m, 2H), 1,80-1,68 (m, 1H), 1,61-1,50 (m, 1H)
I-230	RMN ^1H δ = 7,97(s, 1H), 7,51 (d, 1H), 7,34 (d, 2H), 7,28-7,20 (m, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,97 (d, 1H), 3,69 (d, 1H), 3,64 (d, 1H), 3,40-3,25 (m, 1H), 3,20 (t, 1H), 2,78 (t, 1H), 2,45 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,02 (t, 2H), 1,65-1,47 (m, 2H)
I-231	RMN ^1H δ = 8,03 (s, 1H), 7,76 (dd, 1H), 7,68 (dd, 1H), 7,45 (td, 1H), 7,38 (td, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,98 (d, 1H), 3,70 (d, 1H), 3,64 (d, 1H), 3,40-3,26 (m, 1H), 3,20 (t, 1H), 2,79 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,03 (t, 2H), 1,68-1,47(m, 2H)
I-232	RMN ^1H δ = 8,12 (s, 1H), 7,62-7,51 (m, 1H), 7,27 (t, 2H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,53-4,45 (m, 1H), 4,01-3,93 (m, 1H), 3,69 (d, 1H), 3,63 (d, 1H), 3,40-3,15 (m, 2H), 2,78 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,14-2,00 (m, 2H), 1,68-1,48 (m, 2H)
I-235	RMN ^1H δ = 8,00 (s, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,89 (s, 1H), 4,48 (d, 1H), 3,96 (d, 1H), 3,68 (d, 1H), 3,63 (d, 1H), 3,40-3,15 (m, 2H), 2,77 (t, 1H), 2,28 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,15 (s, 3H), 2,04 (t, 2H), 1,65-1,48 (m, 2H)
I-236	RMN ^1H δ = 8,40 (dd, 1H), 7,74-7,56 (m, 5H), 7,17 (dd, 1H), 5,62 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,37 (m, 1H), 3,97 (m, 1H), 3,50-3,20 (m, 2H), 2,87 (m, 1H), 2,40 (s, 3H), 2,12 (m, 2H), 1,85 (m, 1H), 1,57(m, 1H) ppm
I-237	RMN ^1H δ = 7,68-7,50 (m, 3H), 7,25-7,15 (m, 3H), 7,11 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,51 (d, 1H), 3,97 (d, 1H), 3,71 (d, 1H), 3,63 (d, 1H), 3,40-3,15 (m, 2H), 2,79 (t, 1H), 2,38 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,12-2,00 (m, 2H), 1,65-1,48 (m, 2H)
I-238	RMN ^1H δ = 7,92 (s, 1H), 7,02 (d, 1H), 6,93 (d, 1H), 6,89 (s, 1H), 4,46 (d, 1H), 4,22 (s, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,68 (d, 1H), 3,62 (d, 1H), 3,34-3,23 (m, 1H), 3,18 (t, 1H), 2,77 (t, 1H), 2,23 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,02 (t, 2H), 1,63-1,44 (m, 2H)
I-239	RMN ^1H δ = 7,93 (s, 1H), 7,17 (t, 1H), 7,02 (t, 1H), 6,90 (s, 11-U), 5,38 (d, 2H), 4,37-4,30 (m, 1H), 4,23 (s, 1H), 4,01-3,89 (m, 1H), 2,89-2,77 (m, 1H),

	2,15-2,00 (m, 2H), 1,84- 1,70 (m, 1H), 1,61-1,49 (m, 1H)
I-240	RMN ¹ H δ = 7,73 (s, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,42-7,27 (m, 4H), 5,63 (d, 1H), 5,50 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,98 (d, 1H), 3,45-3,20 (m, 2H), 2,87 (dd, 1H), 2,18-2,08 (m, 2H), 1,83 (tdd, 1H), 1,58 (tdd, 1H) ppm
I-241	RMN ¹ H δ = 7,73 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,42-7,27 (m, 4H), 7,19 (t, 1H), 7,03 (t, 1H), 6,91 (s 1H), 5,45 (d, 1H), 5,36 (d, 1H), 4,38 (d, 1H), 4,01 (d, 1H), 3,45-3,22 (m, 2H), 2,86 (dd, 1H), 2,20-2,09 (m, 2H), 1,83 (tdd, 1H), 1,60 (tdd, 1 H) ppm
I-242	RMN ¹ H δ = 7,92 (d, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,58-7,53 (dd, 1H), 7,45-7,28 (m, 3H), 6,50 (s, 1H), 5,34 (d, 1H), 5,23 (d, 1H), 4,40 (d, 1H), 3,99 (d, 1H), 3,43-3,20 (m, 2H), 2,85 (dd, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,18-2,09 (m, 2H), 1,84 (tdd, 1H), 1,59 (tdd, 1H) ppm

Los desplazamientos de RMN químicos se midieron en ppm a 400 MHz en tanto no se indique otra cosa en el disolvente DMSO-d₆ con tetrametilsilano como patrón interno.

Las siguientes abreviaturas describen la conformación de señales:

b = ancho, s = singlete, d = doblete, t = triplete, c = cuádruplete, m = multiplete

5 **Ejemplos de aplicación**

Ejemplo A

Ensayo de *Phytophthora* (tomate) / protector

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

10 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para el ensayo de la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes de tomate con el preparado de principio activo en la cantidad de aplicación indicada. 1 día después
15 del tratamiento se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* y se mantienen luego durante 24 h a 100% de humedad relativa y a 22° C. A

continuación se disponen las plantas en una celda climatizada a aproximadamente 96% de humedad relativa y a una temperatura de aproximadamente 20° C.

7 días después de la inoculación se realiza la valoración. A este respecto 0% significa un grado de efecto que corresponde al del control, mientras que un grado de efecto de 100% significa que no se observa infestación alguna.

En este ensayo los compuestos de acuerdo con la invención 1-1, 1-2, 1-3, 1-9, 1-15, 1-26, 1-27, 1-35, 1-43, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-59, 1-74, 1-77, 1-79, 1-80, 1-81, 1-83, 1-93, 1-96, 1-98, 1-99, 1-100, 1-101, 1-102, 1-103, 1-104, 1-105, 1-107, 1-108, 1-109, 1-114, 1-115, 1-116, 1-117, 1-121, 1-122 y 1-123 muestran con una concentración de principio activo de 500 ppm un grado de efecto de 70% o más.

Ejemplo B

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona

24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para el ensayo de la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con el preparado de principio activo a la cantidad de aplicación indicada. Tras secado de la capa de pulverización se inoculan plantas con una suspensión de esporas acuosa de *Plasmopara viticola* y se mantienen 1 día en una cabina de incubación a aproximadamente 20° C y 100% de humedad relativa. A continuación se disponen las plantas durante 4 días en el invernadero a aproximadamente 21° C y aproximadamente 90% de humedad. Las plantas se humeden luego y se disponen 1 día en una cabina de

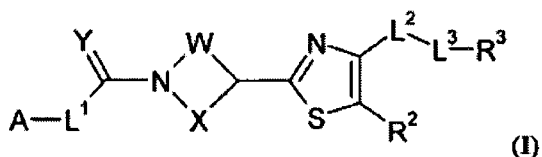
incubación.

6 días después de la inoculación se realiza la valoración. A este respecto 0% significa un grado de efecto que correspondía al del control, mientras que un grado de efecto de 100% significa que no se observa infestación alguna.

- 5 En este ensayo los compuestos de acuerdo con la invención 1-1, 1-9, 1-35, 1-43, 1-50, 1-51, 1-53, 1-59, 1-74, 1-80, 1-81, 1-93, 1-96, 1-98, 1-99, 1-100, 1-101, 1-102, 1-103, 1-104, 1-105, 1-108, 1-109, 1-114, 1-115, 1-116 y 1-117 muestran con una concentración de principio activo de 100 ppm un grado de efecto de 70% o más.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I),



- 5 en la que los símbolos tienen los siguientes significados:

A representa metilo

o

A representa fenilo no sustituido o sustituido,

seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista

- 10 ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio,
- 15 CHO, COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, CR⁶=NOR⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

- 20 o

A es un heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido, dado el caso benzocondensado, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista

Sustituyentes en carbono:

- ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆,
 5 halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, CHO, COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, CR⁶=NOR⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo
 10

Sustituyentes en nitrógeno:

- hidroxilo, NR⁶R⁷, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o halogenoalquinilo C₂-C₆
 15 L¹ es (C(R¹)₂)_n,
 con n = 0 a 3
 R¹ es igual o distinto independientemente uno de otro hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂ o ciano,
 con la condición de que L¹ puede contener como máximo dos R¹ que sean distintos de
 20 hidrógeno
 Y representa azufre u oxígeno,
 W es una cadena de carbono C₁ a C₃ no sustituida o sustituida una vez, seleccionándose el sustituyente de oxo, hidroxilo, ciano o alquilo C₁-C₄
 X es una cadena de carbono C₁ a C₂ no sustituida o sustituida una vez,
 25 seleccionándose el sustituyente de oxo, hidroxilo, ciano o alquilo C₁-C₄

R^2 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_2 , halogenoalquilo C_1-C_2 o halógeno

L^2 representa $-C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ o $-CR^9=CR^9-$ o $-C\equiv C-$

L^3 representa un enlace directo

o

- 5 L^3 representa una cadena de carbono C_1 a C_4 , que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , halogenoalquilo C_1-C_2 o cicloalquilo C_3-C_6

R^3 representa metilo, halogenoalquilo C_1-C_2 , $-CH=CH_2$, $-C\equiv CH$, o cicloalquilo C_3-C_{10} no

- 10 sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyente de la siguiente lista:

ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil C_1-C_2)sililo, fenilo, hidroxilo, oxo, alcoxi C_1-C_6 , halogenoalcoxi C_1-C_6 , alquenil C_2-C_6 -oxi, alquinil C_2-C_6 -oxi, alquil C_1-C_6 -tio, o halogenoalquil C_1-C_6 -tio,

- 15 o

R^3 representa fenilo no sustituido o sustituido,

en donde los sustituyentes se seleccionan independientemente unos de otros de la siguiente lista:

- 20 ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_6 , halogenoalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , halogenocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_4-C_{10} -alquilo, halogenocicloalquil C_4-C_{10} -alquilo, alquil C_4-C_{10} -cicloalquilo, alquil C_5-C_{10} -cicloalquilalquilo, cicloalquil C_4-C_{10} -alquilo, alquenilo C_2-C_6 , halogenoalquenilo C_2-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_8 , halocicloalquenilo C_3-C_8 , alquinilo C_2-C_6 , halogenoalquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_2-C_6 -alquilo, halogenoalcoxi C_2-C_6 -alquilo, alcoxi C_3-C_8 -alcoxialquilo, tri(alquil C_1-C_2)sililo,
- 25 bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 , alcoxi C_2-C_6 -alcoxi, halogenoalcoxi C_1-C_6 ,

alquenil C₂-C₆-oxi, halogenoalquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, halogenoalquinil C₂-C₆-oxi, cicloalcoxi C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-oxi, halocicloalcoxi C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquiloxi, NR⁶R⁷, SH, SF₅, alquil C₁-C₆-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, alquil C₂-C₆-alquiltio, cicloalquil C₃-C₆-tio, CHO, COOH, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, CONR⁶R⁷,
 5 CR⁶=NOR⁷, (alquil C₁-C₆)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₆)carbonilo, (alquil C₁-C₆)carboniloxi, (halogenoalquil C₁-C₆)carboniloxi, (alquil C₁-C₆)carboniltio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₆-sulfonilo, NR⁶COR⁷ o SO₂NR⁶R⁷

o

10 R³ representa naftilo o indenilo saturado o parcial o completamente insaturado, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆,
 15 alquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

o

R³ representa un resto heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

20 Sustituyentes en carbono: ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio,
 25 COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-

C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

Sustituyentes en nitrógeno: hidroxilo, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-

- 5 C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆ o fenilo

o

R³ representa heteroarilo de 5 ó 6 miembros no sustituido o sustituido benzocondensado, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose

- 10 los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₄-C₁₀-alquilo, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquil C₅-C₁₀-cicloalquilalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, alcoxi

- 15 C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, OCH₂OCH₃, SH, alquil C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₆-tio, COOH, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, CONR⁶R⁷, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carboniloxi, (alquil C₁-C₄)-carboniltio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo, NR⁶R⁷, NR⁶COR⁷, SF₅, SO₂NR⁶R⁷, alcoxi C₂-C₄-alquilo o 1-metoxiciclopropilo

- 20 Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₁₀-cicloalquilo, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆ o fenilo

o

R³ es un resto heterociclilo de 5 a 15 miembros no sustituido o sustituido una vez,

- 25 unido por un átomo de carbono, que puede contener hasta dos heteroátomos

adicionales seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆, alquenil C₂-C₆-oxi, alquinil C₂-C₆-oxi, alquil C₁-C₆-tio, o halogenoalquil C₁-C₆-tio

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo o fenilo

10 R⁶, R⁷ representan independientemente uno de otro hidrógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆

R⁸ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halogenoalquilo C₁-C₃,

R⁹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, alquilo C₁-C₄, o
15 cicloalquilo C₃-C₆,

así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

2. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1,
en la que los símbolos tienen los siguientes significados,

20 A representa metilo

o

A representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan independientemente unos de otros de la siguiente lista:

25 ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil

C₁-C₄-tio, halogenoalquil C₁-C₄-tio, (alcoxi C₁-C₄)carbonilo, (alquil C₁-C₄)carbonilo, (halogenoalquil C₁-C₄)carbonilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, halogenoalquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo o halogenoalquil C₁-C₄-sulfonilo,

o

- 5 A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: un furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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, 10 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, 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, 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1 H-bencimidazol- 1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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-benzoxazol-2-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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo, o isoquinolin-8-ilo, 15 20
- 25 que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes

independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, hidroxí, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o halogenoalquil C₁-C₄-tio,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alquenilo

5 C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄,

L¹ es $(C(R^1)_2)_n$

con n = 0 a 3

R¹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, cloro, flúor, metilo, CF₃ o ciano,

10 con la condición de que L¹ puede contener como máximo dos R¹, que sean distintos de hidrógeno,

Y representa azufre u oxígeno,

W es una cadena de carbono C₁ a C₂ no sustituida o sustituida una vez, seleccionándose el sustituyente de ciano o alquilo C₁-C₂,

15 X es una cadena de carbono C₁ a C₂ no sustituida o sustituida una vez, seleccionándose el sustituyente de ciano o alquilo C₁-C₂,

R² representa hidrógeno, alquilo C₁-C₂ o halógeno,

L² representa -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- o -CR⁹=CR⁹- o -C≡C-,

L³ representa un enlace directo,

20 o

L³ representa una cadena de carbono C₁ a C₄, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂ o ciclopropilo,

25 R³ representa metilo, halogenoalquilo C₁-C₂, -CH=CH₂, -C≡CH, o cicloalquilo C₃-C₁₀ no

sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyente de la siguiente lista:

halógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo u oxo,

o

- 5 R³ representa fenilo, que puede contener hasta tres sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halogenocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, halogenoalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, halogenoalquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi

- 10 C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

o

- R³ representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 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, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

- 20 ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₃-tio,

o

- R³ representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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,

- 25

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, 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,
 5 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo,

que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes
 independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃,
 cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o
 10 halogenoalquil C₁-C₄-tio,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆,
 alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ o fenilo,

o

R³ representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo,
 15 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-benzimidazol-1-ilo, 1H-benzimidazol-2-ilo, 1H-
 benzimidazol-4-ilo, benzimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo,
 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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-
 20 benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo, o
 isoquinolin-8-ilo,

que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes
 25 independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, halogenoalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio o halogenoalquil C₁-C₄-tio,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆,

5 alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ o fenilo,

o

R³ representa un resto heterocíclico de 5 a 6 miembros no sustituido o sustituido una vez, unido por un átomo de carbono, que puede contener hasta dos heteroátomos adicionales seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, seleccionándose los

10 sustituyentes de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo o fenilo,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, tri(alquil C₁-C₂)sililo o fenilo,

15 R⁸ es igual o distinto independientemente uno de otro hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, ciclopropilo o halogenoalquilo C₁-C₂,

R⁹ es igual o distinto independientemente uno de otro hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₂, o ciclopropilo

así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos.

20

3. Compuestos de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 2, en la que los símbolos tienen los siguientes significados,

A representa metilo,

o

25 A representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los

sustituyentes independientes unos de otros de la siguiente lista:

ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂, hidroxí, alcoxi C₁-C₂ o halogenoalcoxi C₁-C₂,

o

- 5 A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo; pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo o 1,3-benzotiazol-2-ilo,

- 10 que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, halógeno, alquilo C₁-C₂, halogenoalquilo C₁-C₂, hidroxí, alcoxi C₁-C₂ o halogenoalcoxi C₁-C₂,

Sustituyentes en nitrógeno: alquilo C₁-C₂ o halogenoalquilo C₁-C₂,

- 15 L¹ es (C(R¹))₂)_n

con n = 0 a 3,

R¹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno o metilo, con la condición de que L¹ puede contener como máximo dos sustituyentes metilo,

Y representa azufre u oxígeno,

- 20 W representa -CH₂CH₂-,

X representa -CH₂CH₂-,

R² representa hidrógeno, metilo o halógeno,

L² representa -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- o -CR⁹=CR⁹- o -C≡C-,

L³ representa un enlace directo,

- 25 o

L³ representa una cadena de carbonos C₁ a C₄, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

metilo, metoxi o CF₃,

- 5 R³ representa metilo, halogenoalquilo C₁-C₂, -CH=CH₂, -C≡CH, o cicloalquilo C₃-C₁₀ no sustituido o sustituido una vez, seleccionándose el sustituyentes de la siguiente lista:

flúor, cloro, metilo, etilo, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

o

- 10 R³ representa fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₃, fenilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, halogenoalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio o halogenoalquil C₁-C₆-tio,

o

- 15 R³ representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 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, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1 H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3 -dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo,

- 20 que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

flúor, cloro, bromo, yodo metilo, etilo, CF₃, CHF₂, ciclopropilo, fenil,o hidroxilo, OMe, OEt, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃.

o

- 25 R³ representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-

ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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, 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 o 1,2,4-triazin-3-ilo,

que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, ciclopropilo, fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, O*iso*Pr, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃,

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, ciclopropilo o fenilo,

o

R³ representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-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, 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo,

que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, ciclopropilo, fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, OisoPr, OCF₃, OCHF₂, OC₂F₅, SMe o SCF₃,

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, ciclopropilo o fenilo,

o

R³ representa pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-2-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo o piperazin-2-ilo no sustituidos o sustituidos una vez, seleccionándose el sustituyente de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: metilo, etilo, CF₃, ciclopropilo o fenilo,

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo, ciclopropilo o fenilo,

R⁸ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo, etilo o CF₃.

R⁹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo, así como sales agroquímicamente eficaces de los mismos.

4. Compuestos de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 3, en la que los símbolos tienen los siguientes significados,

A representa metilo,

o

A representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, hidroxilo, OMe, OCF₃,

OCHF₂, OCH₂CF₃ o OC₂F₅,

o

A representa un resto heteroaromático seleccionado del siguiente grupo: tiofen-3-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-4-ilo, piridin-4-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo o 1,3-benzotiazol-2-ilo,

5 que pueden contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

Sustituyentes en carbono: ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, CF₃, CHF₂, C₂F₅, CCl₃, hidroxil, OMe, OCF₃, OCHF₂, OCH₂CF₃, o OC₂F₅.

Sustituyentes en nitrógeno: metilo, etilo o CF₃.

10 L¹ es (C(R¹)₂)_n

con n = 0 a 3,

R¹ es igual o distinto independientemente uno de otro hidrógeno o metilo,

con la condición de que L¹ puede contener como máximo un sustituyente metilo,

Y representa azufre u oxígeno,

15 W representa -CH₂CH₂-,

X representa -CH₂CH₂-,

R² representa hidrógeno, metilo, cloro o bromo,

L² representa -C(R⁸)₂-C(R⁸)₂- o -CR⁹=CR⁹- o -C≡C-,

L³ representa un enlace directo

20 o

L³ representa una cadena de carbono C₁ a C₄,

R³ representa metilo, CF₃, -CH=CH₂, -C≡CH, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo,

o

25 R³ representa fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, seleccionándose los

sustituyentes independientemente unos de otros de la siguiente lista:

ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, CF_3 , CHF_2 , C_2F_5 , CCl_3 , fenilo, hidroxilo, OMe, OEt, *O*isoPr, OCF_3 , OCHF_2 , OC_2F_5 , SMe o SCF_3 ,

o

- 5 R^3 representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 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, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-2-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-4-ilo o 2,3-dihidro-1H-inden-5-ilo,

10 o

- R^3 representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, 1H-pirrol-1-ilo, 1H-pirrol-2-ilo, 1H-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, 15 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, 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 o 1,2,4-triazin-3-ilo,

20 o

- R^3 representa 1H-indol-1-ilo, 1H-indol-2-ilo, 1H-indol-3-ilo, 1H-indol-4-ilo, 1H-indol-5-ilo, 1H-indol-6-ilo, 1H-indol-7-ilo, 1H-bencimidazol-1-ilo, 1H-bencimidazol-2-ilo, 1H-bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, 1H-indazol-1-ilo, 1H-indazol-3-ilo, 1H-indazol-4-ilo, 1H-indazol-5-ilo, 1H-indazol-6-ilo, 1H-indazol-7-ilo, 2H-indazol-2-ilo, 1- 25 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, 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, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo,

o

R³ representa pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-2-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, o piperazin-2-ilo,

R⁸ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo,

10 R⁹ es igual o distinto, independientemente uno de otro, hidrógeno, metilo o etilo, así como sales agroquímicamente eficaces de los mismos.

5. Procedimiento para combatir hongos dañinos fitopatógenos, caracterizado porque se aplican compuestos de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4, sobre los hongos dañinos fitopatógenos y/o su hábitat.

6. Agentes para combatir hongos dañinos fitopatógenos, caracterizado por un contenido de al menos uno según uno o varias de las reivindicaciones 1 a 4 además de sustancias extensoras y/o tensioactivas.

20

7. Uso de tiazoles sustituidos con heterociclilo de fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4 para combatir hongos dañinos fitopatógenos.

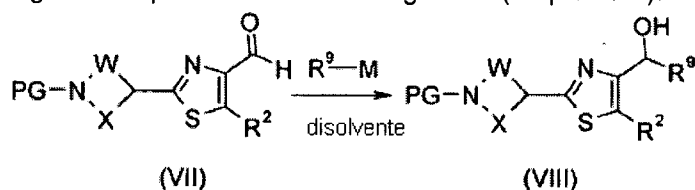
8. Procedimiento para la preparación de agentes para combatir hongos dañinos fitopatógenos, caracterizado porque se mezclan tiazoles sustituidos con heterociclilo de

25

fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4 con extensores y/o sustancias tensioactivas.

9. Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) que comprende al menos una de las siguientes etapas (a) a (n):

(a) Reacción de compuestos de fórmula (VII) dando compuestos de fórmula (VIII) en presencia de un compuesto organometálico R^9-M y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 1):



- 10 siendo

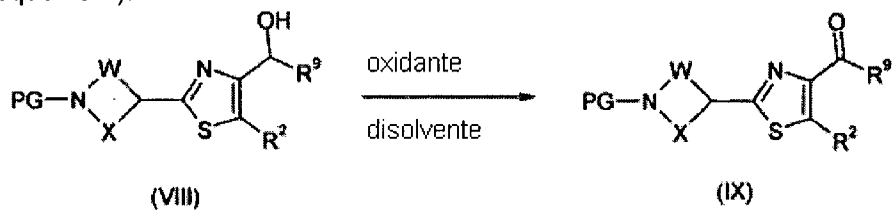
PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, o benciloxycarbonilo,

M = por ejemplo, MgCl, MgBr, MgI, Li,

- 15 R^9 = alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

W, X, y R² son como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(b) Reacción de alcoholes de fórmula (VIII) con un oxidante en presencia de un disolvente dando cetonas de fórmula (IX) según el esquema de reacción siguiente (esquema 2):



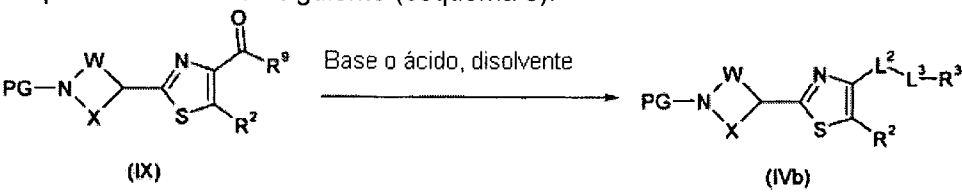
siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo, o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

5 R⁹ = alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

W, X, y R² son como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(c) Reacción de cetonas de fórmula (IX) dando compuestos de fórmula (IVb) en presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 3):



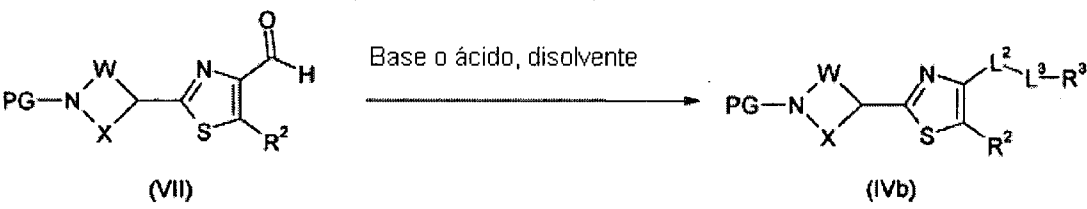
siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

15 L² = -CR⁹=CR⁹-,

W, X, L³, R², R³ y R⁹ como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(d) Reacción de aldehídos de fórmula (VII) dando compuestos de fórmula (IVb) en presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 4):



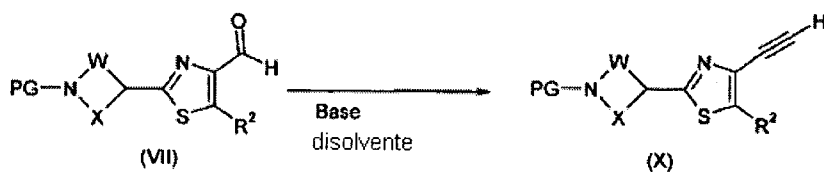
siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

5 $L^2 = -CR^9=CR^9-$,

W, X, L³, R², R³ como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(e) Reacción de aldehídos de fórmula (VII) dando alquinos de fórmula (X) en presencia de una base y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 5):



siendo

PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

15 W, X y R² como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(f) Reacción de alquinos de fórmula (X) con un halogenuro de R³-L³ en una reacción de acoplamiento C-C dado el caso catalizada en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (IVc) según el esquema de reacción siguiente (esquema 6):



siendo

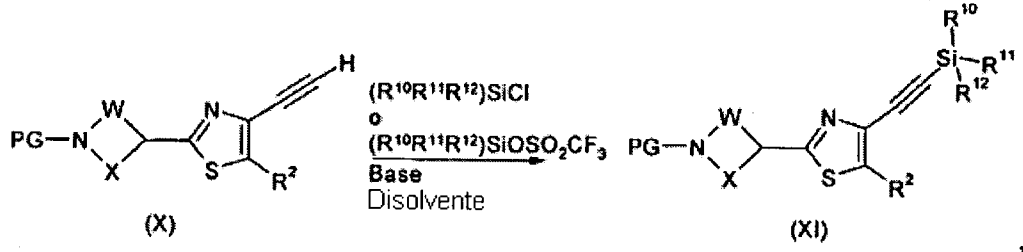
PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

5 Hal = Cl, Br o I,

L²= -C≡C-,

W, X, L³, R² y R³ como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(g) Reacción de alquinos de fórmula (X) con un cloruro de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiCl o triflato de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiOSO₂CF₃, u otros reactivos de sililación conocidos en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (XI) según el siguiente esquema de reacción (esquema 7):



siendo

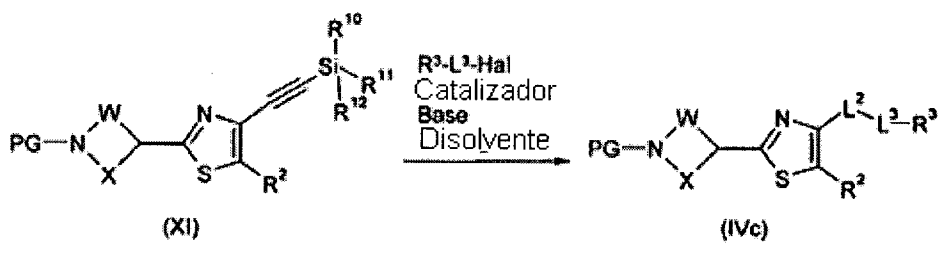
PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,

15 R¹⁰, R¹¹ y R¹² = alquilo C₁-C₄ o fenilo,

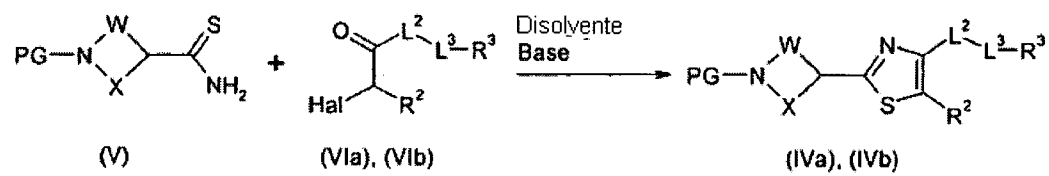
W, X y R² como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

(h) Reacción de alquinos de fórmula (XI) con un compuesto R³-L³-Hal dado el caso en presencia de un catalizador en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (IVc) según el esquema de reacción siguiente (esquema 8):

20



- siendo
- PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo,
- 5 Hal = Cl, Br o I,
- R² = hidrógeno, alquilo C₁-C₂ o halogenoalquilo C₁-C₂,
- L² = -C≡C-,
- R¹⁰, R¹¹ y R¹² = alquilo C₁-C₄ o fenilo,
- 10 W, X, L³ y R³ como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.
- (i) Reacción de tioamidas de fórmula (V) con compuestos de fórmula (VIa) o (VIb) dando compuestos de fórmulas (IVa) o (IVb), en presencia de una base y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 9):



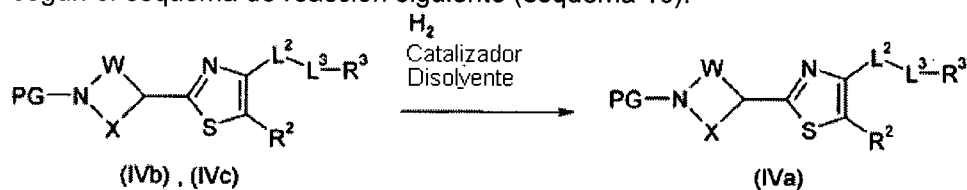
- 15 siendo
- PG = fenilmetilo no sustituido o sustituido (seleccionándose los sustituyentes independientemente unos de otros de metilo, metoxi, nitro, dioxolano), acetilo o alcoxi C₁-C₄-carbonilo o benciloxicarbonilo,
- 20 Hal = Cl, Br o I,

$L^2 = -C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ para compuestos con la fórmula (IVa) y (VIa),

$L^2 = -CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (IVb) y (VIb),

W, X, L^3 , R^2 , R^3 , R^8 y R^9 como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

- (j) Reacción de compuestos de fórmulas (IVb) o (IVc) dando compuestos de fórmula (IVa) en presencia de hidrógeno, de un catalizador y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 10):



siendo

PG = acetilo o alcoxi C_1 - C_4 -carbonilo,

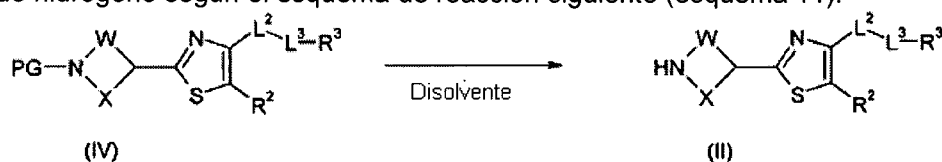
- 10 $L^2 = -C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ para compuestos con la fórmula (IVa),

$L^2 = -CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (IVb),

$L^2 = -C\equiv C-$ para compuestos con la fórmula (IVc),

W, X, L^3 , R^2 , R^3 , R^8 y R^9 como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

- (k) Reacción de compuestos de fórmula (IV) dando compuestos de fórmula (II) dado el caso en presencia de un disolvente así como 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 según el esquema de reacción siguiente (esquema 11):

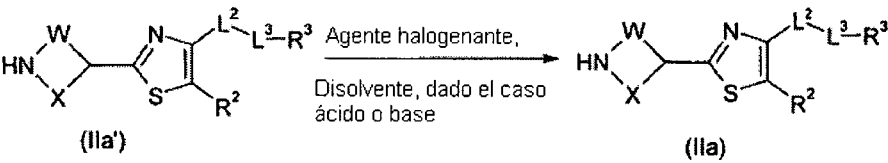


siendo

- 20 PG = acetilo, alcoxi C_1 - C_4 -carbonilo o benciloxycarbonilo,

W, X, L^2 , L^3 , R^2 , y R^3 como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

- (l) Reacción de compuestos de fórmula (IIa') dando compuestos de fórmula (IIa) en presencia de un agente halogenante, dado el caso en presencia de un ácido y de un disolvente según el esquema de reaccion siguiente (esquema 12):



5 siendo

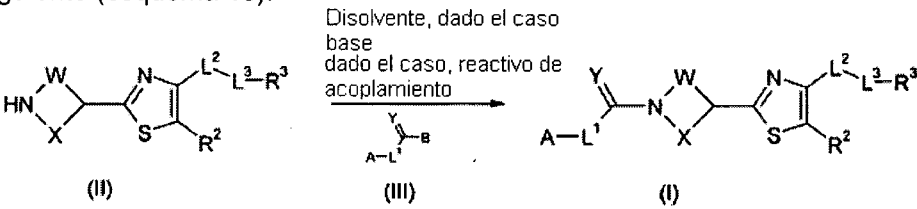
$$V = -C(R^8)_2-C(R^8)_2-,$$

$R^2 = I, Br \text{ o } Cl$ para compuestos con la fórmula (IIa),

$R^2 = \text{hidrógeno}$ para compuestos con la fórmula (IIa'),

W, X, L^3, R^3 y R^8 como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

- 10 (m) Reacción de compuestos de fórmula (IIII) con compuestos de fórmula (II) dando compuestos de fórmula (I) dado el caso en presencia de un reactivo de acoplamiento, de una base y de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 13):



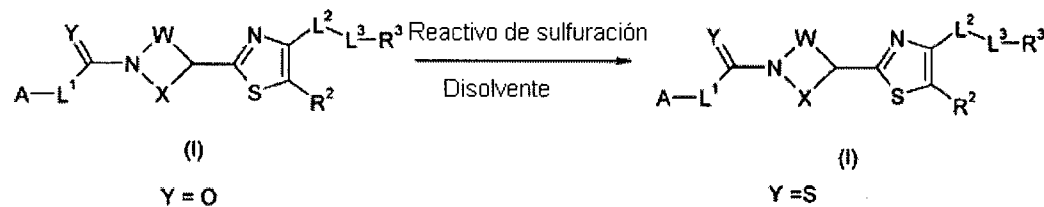
15 siendo

$B = OH, \text{ cloro, bromo o yodo,}$

$Y = \text{oxígeno,}$

$A, W, X, L^1, L^2, L^3, R^2,$ y R^3 como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

- 20 (n) Reacción de compuestos de fórmula (I) dando compuestos de fórmula (I) en presencia de un reactivo de sulfuración y dado el caso en presencia de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 14):



siendo

A, W, X, L¹, L², L³, R² y R³ como se definen para la fórmula (I) en la reivindicación 1.

10. Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) que comprende al menos una de las siguientes etapas (o) a (u):

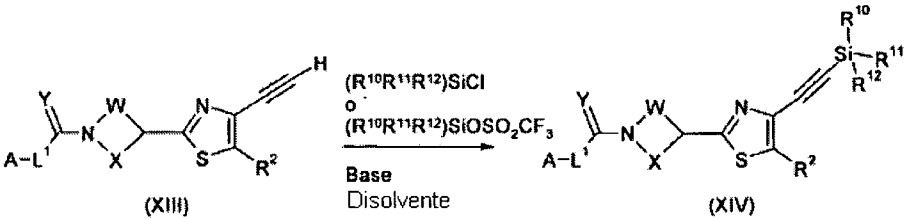
(o) Reacción de aldehídos de fórmula (XII) dando alquinos de fórmula (XIII) en presencia de una base y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 17):



siendo

A, W, X, Y, L¹ y R² como se definen anteriormente para la fórmula (I).

(p) Reacción de alquinos de fórmula (XIII) con un cloruro de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiCl o triflato de trialquilsililo (R¹⁰R¹¹R¹²)SiOSO₂CF₃, u otros reactivos de sililación conocidos en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (XIV) según el esquema de reacción siguiente (esquema 18):



siendo

R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

A, W, X, Y, L^1 y R^2 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (q) Reacción de alquinos de fórmula (XIII) con un halogenuro de R^3 - L^3 en una reacción de acoplamiento C-C dado el caso catalizada en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (Ic) según el esquema de reacción siguiente (esquema 19):



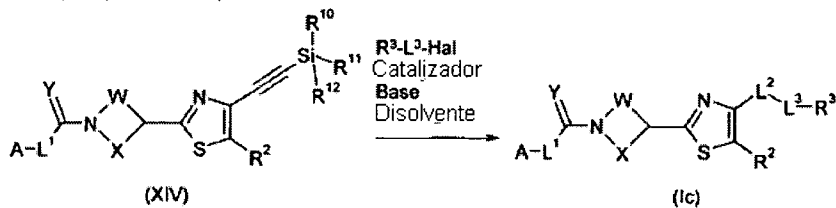
siendo

- 10 Hal = Cl, Br o I,

L^2 = $-C\equiv C-$,

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 y R^3 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (r) Reacción de alquinos de fórmula (XIV) con un compuesto R^3 - L^3 -Hal dado el caso en presencia de un catalizador en presencia de una base y dado el caso de un disolvente dando compuestos de fórmula (Ic) según el esquema de reacción siguiente (esquema 20):



siendo

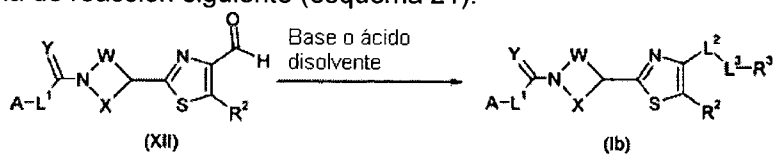
Hal = Cl, Br o I,

- 20 L^2 = $-C\equiv C-$,

R^{10} , R^{11} y R^{12} = alquilo C_1 - C_4 o fenilo,

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 y R^3 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (s) Reacción de aldehídos de fórmula (XII) dando compuestos de fórmula (Ib) en presencia de una base o de un ácido y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 21):

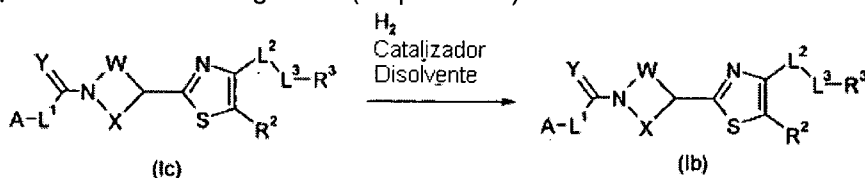


siendo

$L^2 = -\text{CR}^9=\text{CR}^9-$,

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- 10 (t) Reacción de compuestos de fórmulas (Ic) dando compuestos de fórmula (Ib) en presencia de hidrógeno, de un catalizador y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 22):



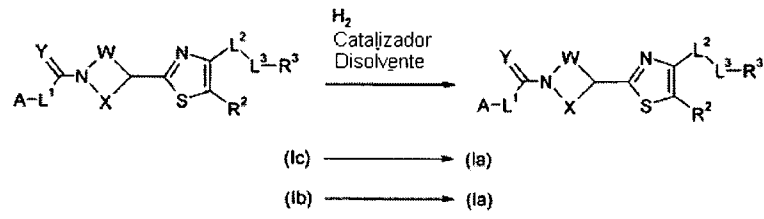
siendo

- 15 $L^2 = -\text{CR}^9=\text{CR}^9-$ para compuestos con la fórmula (Ib),

$L^2 = -\text{C}\equiv\text{C}-$ para compuestos con la fórmula (Ic),

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

- (u) Reacción de compuestos de fórmulas (Ib) o (Ic) dando compuestos de fórmula (Ia) en presencia de hidrógeno, de un catalizador de hidrógeno y dado el caso de un disolvente según el esquema de reacción siguiente (esquema 23):



siendo

$L^2 = -C(R^8)_2-C(R^8)_2-$ para compuestos con la fórmula (Ia),

$L^2 = -CR^9=CR^9-$ para compuestos con la fórmula (Ib),

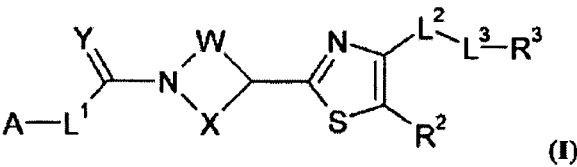
5 $L^2 = -C\equiv C-$ para compuestos con la fórmula (Ic),

A, W, X, Y, L^1 , L^3 , R^2 , R^3 , R^8 y R^9 como se definen anteriormente para la fórmula (I).

TIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES
FITOSANITARIOS

Resumen

5 Tiazoles sustituidos con heterociclilo de fórmula (I), en la que los símbolos tienen los significados dados en la descripción, así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos y su uso para combatir hongos dañinos fitopatógenos así como procedimientos para la preparación de compuestos de fórmula (I).



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; RAHN, Nicola; HERRMANN, Stefan; TSUCHIYA, Tomoki; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; VOERSTE, Arnd; BENTING, Jürgen; WASNAIRE, Pierre; HOFFMANN, Sebastian**

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

(30) Prioridad	(31)	No. Prioridad	(32)	Fecha	(33)	País
		08165625.8		01/10/2008		EP

(85) Fecha inicio fase nacional: 01/05/2011	(87)	Publicación internacional
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 08 - 04 - 10 (dd/mm/aa)
Fecha de presentación de la solicitud: 18 - 09 - 09		N° publicación: WO 2010/037479 A1
No. de solicitud PCT/EP2009/006755		

(54) Título: **TAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES FITOSANITARIOS**

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; RAHN, Nicola; HERRMANN, Stefan; TSUCHIYA, Tomoki; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike; VOERSTE, Arnd; BENTING, Jürgen; WASNAIRE, Pierre; HOFFMANN, Sebastian**(74) Apoderado: **JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS**

(30) Prioridad

(31) No. Prioridad

08165625.8

(32) Fecha

01/10/2008

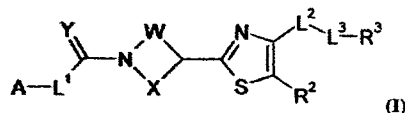
(33) País

EP(85) Fecha límite inicio fase nacional: **01/05/2011**

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

Fecha de presentación de la solicitud: **18 - 09 - 09**No. de solicitud **PCT/EP2009/006755**

(87) Publicación internacional:

Fecha: **08 - 04 - 10**No. Publicación: **WO 2010/037479 A1**(54) Título: **THIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES FITOSANITARIOS**

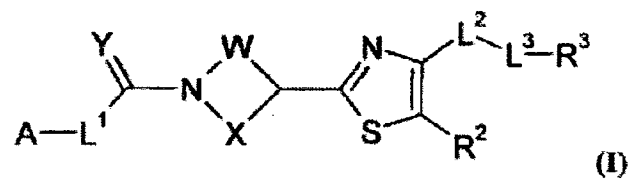
(57) Resumen: Tiazoles sustituidos con heterociclilo de fórmula (I), en la que los símbolos tienen los significados dados en la descripción, así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos y su uso para combatir hongos dañinos fitopatógenos así como procedimientos para la preparación de compuestos de fórmula (I).

CONTINUA AL RESPALDO

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 22) Fecha de solicitud:		(51) Int Cl: (71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE AG	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad 08165625.8	(32) Fecha 01/10/2008	(33) País EP
		(72) Inventor(es) CRISTAU, Pierre; RAHN, Nicola; HERRMANN, Stefan; TSUCHIYA, Tomoki; WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike VOERSTE, Arnd; BENTING, Jürgen; WASNAIRE, Pierre; HOFFMANN, Sebastian	
		(74) Apoderado: JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 01/05/2011		(87) Publicación Internacional Fecha: 08-04-10 Fecha (dd/mm/aa) N° publicación: WO 2010/037479 A1	
Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 18-09-09 No. de solicitud PCT/EP2009/006755			
(54) Titulo: TIAZOLES SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO COMO AGENTES FITOSANITARIOS			

Resumen:

Tiazoles sustituidos con heterocicliilo de fórmula (I), en la que los símbolos tienen los significados dados en la descripción, así como sales agroquímicamente efectivas de los mismos y su uso para combatir hongos dañinos fitopatógenos así como procedimientos para la preparación de compuestos de fórmula (I).



12333
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

MDE

Mario Delgado Echeverry e Hijos Ltda.

Colombia 218
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 an 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 an especial procedures for the registration and renewal of all kinds of Product and Service trademarks, deposits of name and commercial logotipe, 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 gran 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,

3371530Y Madrid
ID Card No. issued in

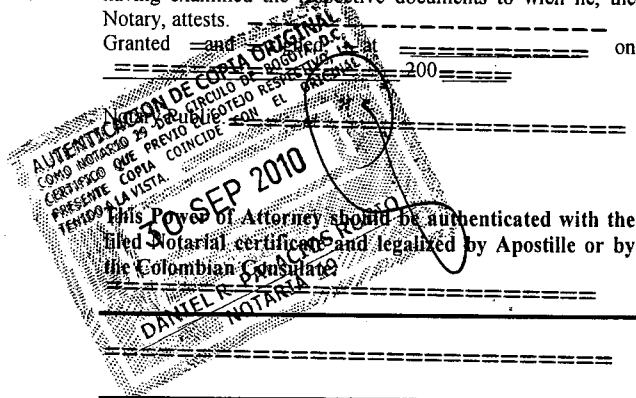
Please, submit to a public deed by public notary

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 know to the Notary due to his having examined the respective documents to wich he, the Notary, attests.

Granted and _____ on
_____ 200_____



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

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
DNI _____ Rxpedido en _____

Certificación Notarial:

El infrascrito Notario Público certifica que la firma que antecede y dice José Antonio Hernández Rodríguez es auténtica: que el firmante es (Firmante autorizado) de Bayer CropScience AG, que tiene facultad para otorgar este poder y que dicha compañía existe y está debidamente organizada de conformidad con las Leyes de Monheim, Alemania.

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

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

Notario Público. _____

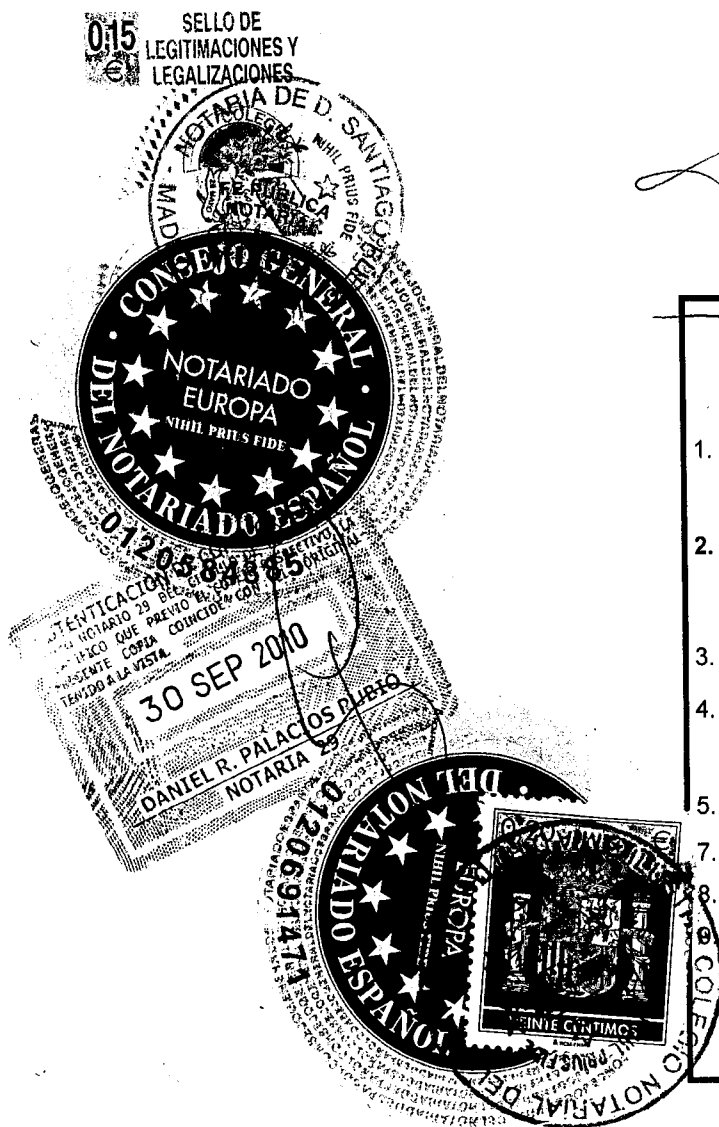
Autenticarlo ante Notario con el lleno de la Certificación Notarial y refrendarlo por Apostilla o Consulado.

LE...//

...//GITIMACIÓN: Yo, SANTIAGO RUBIO LINIERS, Notario del Ilustre Colegio de Madrid con residencia en esta Capital:-----

Conozco y considero legítima la firma que antecede 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 Rubio Liniers



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:

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



Bogotá D.C.,
2020

219

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

REFERENCIA	Radicación No.	11 036972
	Solicitud internacional	PCT/EP2009/6755
	Fecha inicio fase nacional	01/05/2011
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	08868

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 51 bis 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 Única No.10 de 2001.

JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha
adpa11

03 JUN. 2011