

# CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.caveller.com  
E-MAIL: caveller@caveller.com

EDIFICIO SISKI  
CARRERA 4 No. 72 - 35  
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611  
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

00105

Señora Jefe de la  
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES  
Superintendencia de Industria y Comercio  
E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
Radicacion : 03035666 00000001 Folios: 150  
Fecha (AMB): 2003-05-27 17:24:05  
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLEMEN  
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Trámite : 011  
Evento : 379  
Actuación: 329

Referencia : Expediente No. 03.035.666

Solicitante : DOW AGROSCIENCES LLC

Asunto : Solicitud de patente para: 4,5,DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS,1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS Y SU USO COMO FUNGUICIDA E INSECTICIDAS

Fecha de solicitud: 29 de abril de 2003.

Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, atentamente presento junto con este escrito el capítulo descriptivo y reivindicatorio en idioma español, correspondiente a la solicitud de patente en referencia.

Atentamente solicito que se continúe con la tramitación de la solicitud.

Bogotá, 27 MAY 2003  
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO  
T.P.A. No. 31.929

COLO 10975 841 005 3

MRE/MRM/  
ID-000138/WPC10975

**4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS SUSTITUIDAS, 1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS SUSTITUIDAS, Y SU USO COMO FUNGICIDAS E INSECTICIDAS**

5                Esta solicitud reclama la prioridad de la solicitud provisional de los Estados Unidos No. 60/243,803, que fue presentada el 27 de octubre de 2000.

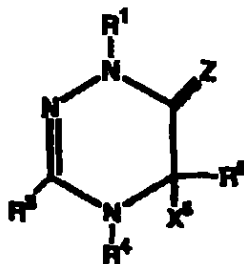
             Sigue habiendo necesidad de fungicidas e insecticidas agroquímicos de amplio espectro, mejorados. Esto se da particular-  
10            mente dado que los blancos a que se dirigen los fungicidas y los insecticidas pueden volverse resistentes a los fungicidas e insecticidas, con el tiempo, y después del uso de dichos compuestos y sus composiciones. Adicionalmente, las consideraciones ambientales pueden favorecer los fungicidas e insecticidas que  
15            tengan diferentes modos de funcionar, respecto a los actualmente usados. Esta invención se refiere a dihidrotriazinonas, triazinonas y compuestos relacionados; a composiciones que comprenden dichos compuestos y un portador agronómicamente aceptable, y a su uso como fungicidas e insecticidas de amplio espectro. Esta invención  
20            enseña también métodos para preparar esos compuestos, así como métodos para usar los compuestos como fungicidas e insecticidas.

             Ciertas            3-fenil-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6(1H)onas metiladas están descritas por Collins y coautores, *Aust. J. Chem.*, 52, 379,385 (1999), y se dice que tienen potencial como agentes de  
25            cultivos potenciales; sin embargo, las dihidrotriazinonas y las

triazinonas fungicidas e insecticidas de la presente invención no están sugeridas. Otras 4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6(1H)onas están presentadas en un resumen por Neunhoeffer y coautores, *Chemistry of 1,2,3-Triazines and 1,2,4-Triazines, Tetrazines and Pentazines*, 605-607, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, NY, E. U. A. (1978); no se sugiere utilidad para esos compuestos. Varias ariltriazinonas y ariltriazinoftalazinas están descritas por Kutscher y coinventores en ZA 938799, del 24 de noviembre de 1993, como fármacos para el tratamiento del asma bronquial, las alergias del origen más variado, procesos inflamatorios, insuficiencia cardíaca e hipertensión; no se sugiere ninguna utilización plaguicida para esos compuestos. Algunas triazinonas, entre los heterociclos que contienen nitrógeno están descritas por Kanellakopulos y coinventores en US 5,814,645, del 29 de Septiembre de 1998, por tener actividad insecticida; pero no están descritos los compuestos de la presente invención. Sanière y coautores, en *Tetrahedron Letters*, 41, 671-674 (2000), ejemplifican ciertas 4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6(1H)onas para uso como estrados para química combinatoria; no están descritos los compuestos de la presente invención ni sus usos.

Una modalidad de la presente invención se refiere a un compuesto de la fórmula (I):

60109



(I)

5

en la que:

R<sup>1</sup> es alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquenilo, haloalquenilo,  
 alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilalquinilo, alcoxialquilo,  
 10 alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo,  
 trialquilsililalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser  
 iguales o diferentes; alcoxycarbonilo, alquilocarbonilo,  
 alcoxycarbonilalquilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituido  
 con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente  
 15 del grupo que consiste de alquilo, halógeno, nitro, alcoxi,  
 alquiltio, haloalquilo, haloalquiltio y haloalcoxi; fenilalquilo o  
 fenilalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres  
 sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que  
 consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi,  
 20 piridilo o piridilo sustituido con uno o dos sustituyentes,  
 independientemente seleccionados del grupo que consiste de  
 alquilo y halógeno, furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo  
 sustituidos con halógeno o alquilo en el anillo de furilo o de  
 tienilo; benzotienilo, benzofuranilo o benzotienilo o  
 25 benzofuranilo sustituidos con halógeno, alquilo o haloalquilo;

**R<sup>3</sup>** es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, arilo seleccionado de fenilo, naftilo y fenilo y naftilo sustituidos con uno a cinco sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, o fenilo y naftilo sustituido con un grupo heteroarilo seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, y furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, sustituidos con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano; fenilo, fenoxi, y fenilo y fenoxi sustituidos con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, nitro y ciano; heteroarilo, seleccionado de furilo,

tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo,  
 piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, pirazolilo, 1,2,3-  
 tiadiazol-4-ilo, tiazolilo, triazolilo, triazinilo, isoxazolilo y  
 oxazolilo, y furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo,  
 5 pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo y oxazolilo, sustituidos con uno  
 o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de  
 halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio,  
 haloalquiltio, nitro y ciano;

**R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo,  
 10 alquilcarbonilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo,  
 cicloalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquiltio, amino,  
 alquilamino, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser  
 iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están  
 fijados, forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros;

15 ciano, alquenilo, alquenilsulfonilo, haloalquenilo,  
 alquenilcarbonilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxycarbonilo,  
 haloalcoxycarbonilo, alcoxycarbonilalquilo, alcoxycarboniltio,  
 (alquiltio)carbonilo, alquil(tiocarbonilo), alquiltiotiocarbonilo,  
 alqueniloxycarbonilo, alqueniltiotiocarbonilo, alquiniiloxi-  
 20 carbonilo, alquiniiltiotiocarbonilo, alcoxioxalilo, alquil-  
 carboniloxialcoxycarbonilo, aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo,  
 arilsulfonilalquenilo, ariloxycarbonilo, ariloxitiocarbonilo,  
 ariltiotiocarbonilo sustituido en un anillo aromático con uno o  
 dos sustituyentes seleccionados independientemente de  
 25 halógeno y alquilo; o tenilo o tenilo sustituido en el anillo de

tienilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;

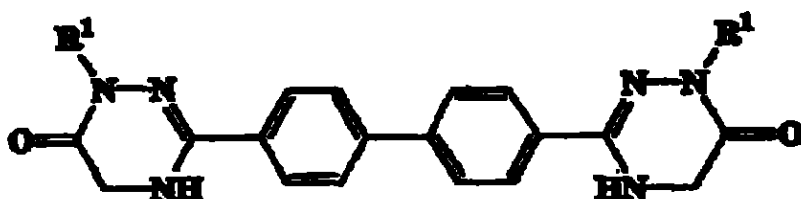
- R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, formilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniltio, alquilcarboniltio, alquiltio, hidroxí, mercapto, alquenilo, alquinilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino; donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros; arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniltio o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniltio sustituido en el anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi haloalquilo, haloalcoxi, amino, alquilamino y dialquilamino; donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros; o
- R<sup>4</sup>** puede formar un anillo fundido al sustituyente **R<sup>3</sup>**, cuando el sustituyente **R<sup>3</sup>** es arilo o heteroarilo, donde **R<sup>4</sup>** está seleccionado de -CH(R)-, -O-, -S-, -N(R)-, -C(=O)-, -O(C=O)-, -(=O)O-, -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-, -N(R)CH<sub>2</sub>-, -C(R)=N-, -N=C(R)-, -CH(R)O-, -OCH(R)-, -CH(R)S- y -SCH(R)-; o
- R<sup>3</sup>** y **R<sup>4</sup>**, tomados juntos, pueden formar un anillo de piridazinilo sustituido;
- R<sup>5</sup>** y **X<sup>5</sup>**, tomados juntos, pueden formar un carbonilo; o

$X^5$  es un átomo de hidrógeno, o tomado junto con  $R^4$  forma una ligadura de nitrógeno a carbono;

Z es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NR;

R es H o alquilo, o un compuesto de la fórmula:

5



o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente  
10 aceptables y sus mezclas; a condición de que:

cuando  $R^1$  es un aralquilo o un heteroaralquilo,  $R^4$  no sea ciano, alquilsulfonilo, arilsulfonilo o polihaloalquilo;

cuando  $R^1$  es acetilo y  $R^3$  es 2-piridilo,  $R^5$  y  $X^5$  tomados juntos no puedan formar un carbonilo; y

15 cuando  $R^3$  es fenilo, metilo o ciclohexilo,  $R^1$  no sea fenilo, metilo, nitrofenilo, etoxycarbonilo, bencilo o benciloximetilo.

El término "alquilo" incluye grupos alquilo tanto de cadena ramificada como de cadena recta. Los grupos alquilo típicos son: metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, butilo secundario,  
20 isobutilo, butilo terciario, n-pentilo, isopentilo, n-hexilo, n-heptilo, isooctilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo, y similares.

El término "halógeno" o "halo" se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo.

El término "haloalquilo" se refiere a un grupo alquilo  
25 sustituido con uno o más grupos halógeno, por ejemplo: clorometilo,

2-bromoetilo, 3-yodopropilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, perfluoropropilo, 8-clorononilo, y similares.

El término "cianoalquilo" se refiere a un grupo alquilo sustituido con un grupo ciano, por ejemplo: ciano metilo, 2-  
5 cianoetilo, y similares.

El término "alcoxi" incluye grupos alquilo tanto ramificados como de cadena recta fijados a un átomo de oxígeno terminal. Los grupos alcoxi típicos incluyen: metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, butoxi terciario, y similares.

10 El término "alcoxialquilo" se refiere a un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi, por ejemplo, isopropoximetilo.

El término "haloalcoxi" se refiere a un grupo alcoxi sustituido con uno o más grupos halógeno, por ejemplo: clorometoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, perfluoroisobutoxi y similares.

15 El término "haloalcoxycarbonilo" se refiere a un grupo alcoxi sustituido con uno o más grupos halógeno fijados a un grupo carbonilo, por ejemplo: clorometoxycarbonilo, trifluorometoxycarbonilo, difluorometoxycarbonilo, perfluoroisobutoxicarbonilo, y similares.

20 El término "alquiltio" incluye grupos alquilo tanto ramificados como de cadena recta, fijados a un átomo de azufre terminal, por ejemplo, metilitio.

El término "haloalquiltio" se refiere a un grupo alquiltio sustituido con uno o más grupos halógeno, por ejemplo,  
25 trifluorometiltio.

El término "alquiltioalquilo" se refiere a un alquilo de cadena recta o ramificada, como se definió más arriba, sustituido con un grupo alquiltio; por ejemplo, metiltiometilo, 3-(isobutiltio)heptilo, y similares.

5 El término "alquilsulfinilo" se refiere a una porción sulfinilo sustituida con un grupo alquilo, por ejemplo: metilsulfinilo, n-propilsulfinilo y similares.

El término "alquilsulfonilo" se refiere a una porción sulfonilo sustituida con un grupo alquilo, por ejemplo, mesilo, n-  
10 propilsulfonilo y similares.

El término "alquilamino" se refiere a un grupo alquilo, fijado a un átomo de nitrógeno, por ejemplo, metilamino, isopropilamino, y similares.

El término "dialquilamino" se refiere a dos grupos alquilo,  
15 que pueden ser iguales o diferentes, fijados a un átomo de nitrógeno, por ejemplo: dimetilamino, N-etil-N-metilamino, y similares.

El término "trialquilsililalquilo" se refiere a tres grupos alquilo, que pueden ser iguales o diferentes, fijados a un átomo de silicio que, a su vez, está fijado a un grupo alquilo, por ejemplo,  
20 trimetilsililmetilo.

El término "alcoxicarbonilo" se refiere a un alcoxi de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo, por ejemplo, etoxycarbonilo, metoxycarbonilo, y similares.

El término "ariloxi" se refiere a un grupo arilo no  
25 sustituido o sustituido, fijado a un átomo de oxígeno, por ejemplo,

fenoxi, 4-(trifluorometil)fenoxi, 2-clorofenoxi, 4-fluoro-1-naftoxi, y similares.

El término "ariltio" se refiere a un grupo arilo no sustituido o sustituido, fijado a un átomo de azufre; por ejemplo:  
5 feniltio, 4-(trifluorometil)feniltio, 2-clorofeniltio, 4-fluoro-1-naftiltio y similares.

El término "ariloxicarbonilo" se refiere a un ariloxi fijado a un grupo carbonilo, por ejemplo, fenoxicarbonilo, y similares.

El término "alcoxioxalilo" se refiere a un alcoxi de cadena  
10 recta o ramificado, fijado a un grupo oxalilo, por ejemplo, etoxioxalilo, metoxioxalilo, y similares.

El término "alquilcarboniloxialcoxicarbonilo" se refiere a un aciloxialcoxicarbonilo de cadena recta o ramificado, por ejemplo, acetoximetoxicarbonilo, y similares.

15 El término "alcoxicarboniltio" se refiere a un alcoxi de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de azufre; por ejemplo, etoxicarboniltio, metoxicarboniltio, y similares.

El término "alquilcarbonilo" se refiere a una funcionalidad  
20 alquilceto, por ejemplo, acetilo, n-butirilo y similares.

El término "arilcarbonilo" se refiere a una funcionalidad arilceto, por ejemplo, benzofilo y similares.

El término "alquilcarbonilalquilo" se refiere a una funcionalidad alquilcetoalquilo, por ejemplo, acetilmetilo y similares.

25 El término "cicloalquilcarbonilo" se refiere a una

funcionalidad cicloalquilceto, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo, y similares.

El término "alquil(tiocarbonilo)" se refiere a una funcionalidad alquilo fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo, 5 tioacetilo, y similares.

El término "(alquiltio)carbonilo" se refiere a una funcionalidad alquiltio fijada a un grupo carbonilo, por ejemplo, metiltiocarbonilo, y similares.

El término "aril(tiocarbonilo)" se refiere a una 10 funcionalidad arilo fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo, tiobenzolilo, y similares.

El término "(ariltio)carbonilo" se refiere a una funcionalidad ariltio fijada a un grupo carbonilo, por ejemplo, feniltiocarbonilo y similares.

15 El término "alquiltiotiocarbonilo" se refiere a una funcionalidad alquiltio fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo, propiltiotiocarbonilo, y similares.

El término "alqueniltiotiocarbonilo" se refiere a una funcionalidad alqueniltio fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo, 20 aliltiotiocarbonilo, y similares.

El término "alquíniltiotiocarbonilo" se refiere a una funcionalidad alquíniltio fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo, propargiltiotiocarbonilo, y similares.

El término "ariloxitiocarbonilo" se refiere a una 25 funcionalidad aroxi fijada a un grupo tiocarbonilo, por ejemplo,

fenoxitio carbonilo y similares.

El término "ariltiotio carbonilo" se refiere a una funcionalidad ariltio fijada a un grupo tio carbonilo, por ejemplo, feniltiotio carbonilo, y similares.

5 El término "alcoxicarbonilalquilo" se refiere a un alquilo de cadena recta o ramificado, sustituido con un alcoxicarbonilo; por ejemplo: etoxycarbonilmetilo, 2-(metoxycarbonil)propilo, y similares.

El término "alquenilo" se refiere a un grupo de hidrocarburo etilénicamente insaturado, de cadena recta o  
10 ramificada, que tiene 1 o 2 ligaduras etilénicas, por ejemplo: vinilo, alilo, 1-butenilo, 2-butenilo, isopropenilo, 2-pentenilo, alenilo y similares.

El término "haloalquenilo" se refiere a un grupo alquenilo sustituido con uno o más grupos halógeno.

15 El término "alqueniloxicarbonilo" se refiere a un alquenilo de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo, por ejemplo, aliloxicarbonilo, viniloxicarbonilo y similares.

El término "alquinilo" se refiere a un grupo de hidrocarburo insaturado, de cadena recta o ramificado, que tiene una  
20 o dos ligaduras acetilénicas, por ejemplo, etinilo, propargilo y similares.

El término "haloalquinilo" se refiere a un grupo alquinilo sustituido con uno o más grupos halógeno.

El término "alquiniloxicarbonilo" se refiere a un alquinilo  
25 de cadena recta o ramificada, fijado a un grupo carbonilo, por

ejemplo, propargiloxycarbonilo y similares.

El término "cicloalquilo" se refiere a una estructura cíclica de anillo alifático, opcionalmente sustituida con alquilo, hidroxilo y halógeno, tal como: ciclopropilo, metilciclopropilo, ciclobutilo, 2-hidroxíciclopentilo, ciclohexilo, 4-clorociclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y similares.

El término "cicloalquilalquinilo" se refiere a un grupo cicloalquilo como se definió aquí con anterioridad, fijado a un grupo alquinilo, por ejemplo: ciclopropilpropargilo, 4-ciclopentil-2-butinilo y similares.

El término "arilo" se refiere a fenilo o naftilo, que puede estar opcionalmente sustituido. Los sustituyentes típicos del arilo incluyen, pero sin limitación a ellos: fenilo, 4-clorofenilo, 4-fluorofenilo, 4-bromofenilo, 3-nitrofenilo, 2-metoxifenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-etilfenilo, 2-metil-3-metoxifenilo, 2,4-dibromofenilo, 3,5-difluorofenilo, 3,5-dimetilfenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 4-metoxifenilo, 4-(trifluorometoxi)fenilo, naftilo, 2-cloronaftilo, 2,4-dimetoxifenilo, 4-(trifluorometil)fenilo y 2-yodo-4-metilfenilo.

El término "heteroarilo" se refiere a un anillo insaturado de 5 o 6 miembros, sustituido o no sustituido, que contiene uno, dos o tres heteroátomos, de preferencia uno o dos heteroátomos, seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, o a un sistema anular insaturado, bicíclico, que contiene hasta 10 átomos que incluyen un heteroátomo seleccionado de oxígeno,

nitrógeno y azufre. Los ejemplos de heteroarilos incluyen, pero sin limitación a ellos: 2-, 3- ó 4-piridinilo, pirazinilo, 2-, 4- ó 5-pirimidinilo, piridazinilo, triazolilo, imidazolilo, 2- ó 3-tienilo, 2- ó 3-furilo, pirrolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, quinolilo, isoquinolilo, benzofuranilo y benzotiofuranilo (benzotienilo). El anillo heterocíclico puede estar sustituido opcionalmente con hasta dos sustituyentes, tales como, pero sin limitación a ellos: alquilo, halógeno y haloalquilo.

El término "aralquilo" es usado para describir un grupo en el que la cadena de alquilo puede ser cadena recta o ramificada, con la porción arilo, tal como se definió anteriormente, formando una porción terminal de la porción aralquilo. Los ejemplos de grupos aralquilo incluyen, pero sin limitación a ellos: bencilo y fenetilo opcionalmente sustituidos, tales como 4-clorobencilo, 2,4-dibromobencilo, 2-metilbencilo, 2-(3-fluorofenil)etilo, 2-(4-metilfenil)etilo, 2-(4-(trifluorometil)fenil)etilo, 2-(2-metoxifenil)etilo, 2-(3-nitrofenil)etilo, 2-(2,4-diclorofenil)etilo, 2-(3,5-dimetoxifenil)etilo, 4-(trifluorometoxi)bencilo, y similares.

El término "heteroaralquilo" es usado para describir un grupo en el cual la cadena de alquilo puede ser una cadena ramificada o recta, con la porción heteroarilo, como se definió aquí con anterioridad, formando una porción terminal de la porción heteroaralquilo; por ejemplo, 3-furilmetilo, tenilo (tienilmetil), furfurilo, y similares.

El término "arilsulfonilo" se refiere a una porción sulfonilo

sustituida con un grupo arilo, por ejemplo, toluensulfonilo, y similares.

El término "alquilcarboniloxi" se refiere a un alquilo de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de oxígeno, por ejemplo, acetoxi, 5 terbutilcarboniloxi, y similares.

El término "alquilcarboniltio" se refiere a un alquilo de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de azufre, por ejemplo: etilcarboniltio, 10 metilcarboniltio, y similares.

El término "alcoxycarboniloxi" se refiere a un alcoxi de cadena recta o ramificado, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de oxígeno, por ejemplo, etoxycarboniloxi, metoxycarboniloxi, y similares.

15 El término "alcoxycarboniltio" se refiere a un alcoxi de cadena recta o ramificada, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de azufre, por ejemplo, etoxycarboniltio, metoxycarboniltio y similares.

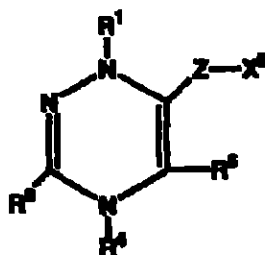
El término "arilcarboniloxi" se refiere a un arilo no sustituido o sustituido, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, está fijado a un átomo de oxígeno, por ejemplo, benzoiloxi y 20 similares.

El término "arilcarboniltio" se refiere a un arilo no sustituido o sustituido, fijado a un grupo carbonilo que, a su vez, 25 está fijado a un átomo de azufre, por ejemplo, 4-clorofenilcarboniltio

y similares.

Los compuestos de la fórmula (I) también comprenden las formas tautoméricas de la invención, por ejemplo:

5



10 en la que X<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno y R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>6</sup> y Z son como se los definió previamente.

Un modo preferido de esta primera modalidad lo constituyen los compuestos de la fórmula (I), en los que:

15 R<sup>1</sup> es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialkilsilil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcóxicarbonilo de 1 a 20 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de 25 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de

carbono, alcoxicarbonil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o benzofuranilo;

$R^3$  es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo, naftilo, o fenilo o naftilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxí de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono,

alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, dialquil  
de 1 a 4 átomos de carbono-amino, donde los grupos alquilo  
pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que  
están fijados forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros,  
5 quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo o  
quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo o benzotienilo  
sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados  
independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de  
carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4  
10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono,  
alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;  
R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,  
haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquylcarbonilo de 1 a  
4 átomos de carbono, alquylcarbonil de 1 a 4 átomos de  
15 carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a  
8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 8 átomos de carbono-  
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquylcarbonilo de 3 a  
8 átomos de carbono, alquylsulfonilo de 1 a 4 átomos de  
carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono,  
20 alquenilsulfonilo de 2 a 8 átomos de carbono, fenilsulfonil-  
alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8  
átomos de carbono, alquenylcarbonilo de 2 a 8 átomos de  
carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxicarbonilo  
de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxicarbonilo de 1 a 4  
25 átomos de carbono, alcóxicarbonil de 1 a 4 átomos de carbono-

- alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquil de 1 a 4 átomos de carbono-carboniloximetoxicarbonilo, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-carboniltio, (alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono)-carbonilo, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono-tiocarbonilo, 5 alqueniloxicarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, alquiniloxicarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquiniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, alcoxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alcoxicarbonilo de 10 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzofilo, fenoxicarbonilo, fenoxitiocarbonilo, feniltiotiocarbonilo o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzofilo, fenoxicarbonilo, fenoxitiocarbonilo, feniltiotiocarbonilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a dos 15 sustituyentes, independientemente seleccionados de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o tenilo o tenilo sustituido en el anillo de tienilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
- 20 R<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxil, mercapto, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que 25 consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos

de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y

X<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno o, tomado junto con R<sup>4</sup>, forma una ligadura de nitrógeno a carbono.

5 Un modo más preferido de esta modalidad está constituido por los compuestos de la fórmula (I) en los cuales:

R<sup>1</sup> es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;

15 R<sup>3</sup> es fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

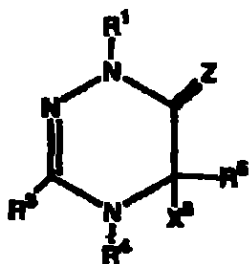
20 R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, alkilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarboniltilio de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquiniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono o alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-oxalilo; y

25 R<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o alkiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

Un modo todavía más preferido de esta primera modalidad está constituido por los compuestos de la fórmula (I), en los cuales:

- R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;
- R<sup>3</sup>** es fenilo disustituido con halógeno, fenilo disustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo disustituido con haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo monosustituido con halomonoalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo monosustituido con monohaloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
- R<sup>4</sup>** y **R<sup>6</sup>** son hidrógeno.

Una segunda modalidad de la presente invención se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de la fórmula (IA):



(IA)

en la que:

- R<sup>1</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, trialquilsililalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcoxicarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilalquilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, nitro, alcoxi, alquiltio, haloalquilo, haloalquiltio y haloalcoxi, fenilalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, piridilo o piridilo sustituido con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo y halógeno, furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo sustituidos con halógeno o alquilo en el anillo de furilo o de tienilo, benzotienilo, benzofuranilo o benzotienil o benzofuranilo sustituidos con halógeno, alquilo o haloalquilo;
- R<sup>3</sup>** es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi; arilo seleccionado de fenilo, naftilo y fenilo y naftilo sustituido con

uno a cinco sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, halogenoalcoxi, alquiltio, halogenoalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos

5 alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, o fenilo o naftilo sustituidos con un grupo heteroarilo seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo,

10 pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo; y furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, sustituidos con uno o dos

15 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano, fenilo, fenoxi, y fenilo y fenoxi sustituidos con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi,

20 alquiltio, nitro y ciano, heteroarilo, seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, pirazolilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, tiazolilo, triazolilo, triazinilo, isoxazolilo y oxazolilo, y furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo,

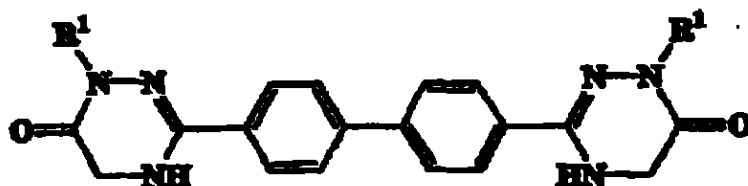
25 pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo y oxazolilo, sustituidos con uno

o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, haloalquiltio, nitro y ciano;

**R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alcoxi, alquiltio, amino, alquilamino, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, ciano, alquenilo, alquenilsulfonilo, haloalquenilo, alquenilcarbonilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alcoxicarboniltio (alquiltio)carbonilo, alquil(tiocarbonilo), alquiltiotiocarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alqueniltiotiocarbonilo, alquiniloxicarbonilo, alquiniltiotiocarbonilo, alcoxloxalilo, alquilcarboniloxialcoxicarbonilo, aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, arilsulfonilalquenilo, ariloxicarbonilo, ariloxitiocarbonilo, ariltiotiocarbonilo o aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, arilsulfonilalquenilo, ariloxicarbonilo, ariloxitiocarbonilo, ariltiotiocarbonilo, sustituido en un anillo aromático con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;

**R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, formilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alcoxicarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniltio,

- alquilcarboniltio, alquiltio, hidroxí, mercapto; alquenilo, alquinilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, sustituidos en el anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, amino, alquilamino y dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; o
- $R^4$  puede formar un anillo fundido al sustituyente  $R^3$  cuando el sustituyente  $R^3$  es arilo o heteroarilo, donde  $R^4$  está seleccionado de  $-CH(R)-$ ,  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-N(R)-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-O(C=O)-$ ,  $-CH_2CH_2-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $N(R)CH_2-$ ,  $-C(R)=N-$ ,  $-N=C(R)-$ ,  $-CH(R)O-$ ,  $-OCH(R)-$ ,  $-CH(R)S-$  y  $-SCH(R)-$ ; o
- $R^3$  y  $R^4$  tomados juntos pueden formar un anillo de piridazinilo sustituido;
- $R^5$  y  $X^5$  tomados juntos pueden formar un carbonilo; o
- $X^5$  es un átomo de hidrógeno, o tomado junto con  $R^4$  forma una ligadura de nitrógeno a carbono;
- $Z$  es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, o  $NR$ ;
- $R$  es H o alquilo, o un compuesto de la fórmula:



5

o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente aceptables, y sus mezclas; y un portador agronómicamente aceptable.

Un modo preferido de esta segunda modalidad está  
10 constituido por composiciones fungicidas que comprenden un compuesto de la fórmula (IA), en la que:

R¹ es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcóxicarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxicarbonil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes,

15  
20  
25

seleccionados independientemente del grupo que, consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o benzofuranilo;

**R<sup>3</sup>** es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo, naftilo, o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, nitro, clano, dialquilamino de 1 a 4 átomos de

carbono, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo o quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo o benzotienilo, sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;

**R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilcarbonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 8 átomos de carbono, fenilsulfonil-alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilcarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbono-metóxicarbonilo, alcóxicarboniltio de 1

135

- a 4 átomos de carbono, (alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono-tiocarbonilo, alqueniloxicarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, 5 alqunilloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquiniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, alcoxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzollo, fenoxycarbonilo, 10 fenoxitocarbonilo, feniltiotiocarbonilo o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzollo, fenoxycarbonilo, fenoxitocarbonilo, feniltiotiocarbonilo, sustituido en el anillo de fenilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
- 15  $R^5$  es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxí, mercapto, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, 20 alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;
- $Z$  es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y
- $X^5$  es un átomo de hidrógeno o tomado junto con  $R^4$  forma una ligadura de nitrógeno a carbono.

25 Un modo más preferido de esta segunda modalidad está

constituido por composiciones fungicidas que comprenden un compuesto de la fórmula (IA), en la que:

- 5     **R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;
- 10   **R<sup>2</sup>** es fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;
- 15   **R<sup>3</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-carboniltio, alqueniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquiniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono o alcoxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y
- 20   **R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

Un modo todavía más preferido, de esta segunda modalidad, está constituido por composiciones fungicidas que comprenden un compuesto de la fórmula (IA), en la que:

- 25   **R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10

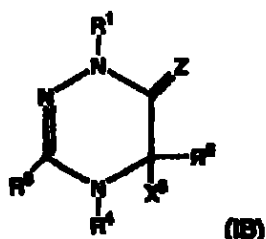
átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-  
 5 alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;

$R^3$  es fenilo disustituido con halógeno, fenilo disustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo disustituido con haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo sustituido con  
 10 monohalomonoalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo sustituido con monohalomono(haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono);

$R^4$  y  $R^5$  son hidrógeno.

Una tercera modalidad de la presente invención se refiere  
 15 a una composición insecticida que comprende una cantidad insecticidamente efectiva de un compuesto de la fórmula (IB):

20



en la que:

$R^1$  es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo,  
 25 alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo,

cicloalquilalquinilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, trialkilalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, alquilcarbonilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi; furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo sustituidos con halógeno en el anillo de furilo o de tienilo; benzotienilo o benzofuranilo;

$R^3$  es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, arilo seleccionado de fenilo y fenilo sustituido con uno a cinco sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, haloalquilo, haloalcoxi, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; heteroarilo seleccionado de furilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo y piridilo, y benzofuranilo, benzotienilo y piridilo sustituidos con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de

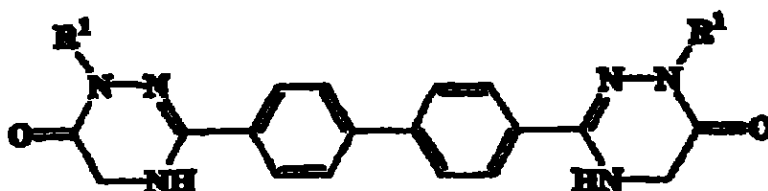
halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano;

**R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, ciano, alquenilo, alquinilo, haloalquinilo, haloalcoxicarbonilo, alcoxicarboniltio, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, alcoxioxalilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxialcoxicarbonilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, ariloxitiocarbonilo, o arilcarbonilo, arilsulfonilo, ariloxitiocarbonilo sustituidos en el anillo de arilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo; o tenilo o tenido sustituido en el anillo de tienilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;

**R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, formilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniltio, alquilcarboniltio, alquiltio, mercapto, alquenilo, alquinilo, ciano, dialquilamino, arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi o arilcarboniltio sustituidos en el anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi;

**X<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno o, tomado junto con R<sup>4</sup>, forma una ligadura de nitrógeno a carbono;

**25 Z** es un átomo de oxígeno o un compuesto de la fórmula:



5

o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente activos y sus mezclas, y un portador agronómicamente aceptable; a condición de que, cuando R¹ es un aralquilo o un heteroaralquilo, R⁴ no sea ciano, alquilsulfonilo, arilsulfonilo ni polihaloalquilo.

10

Un modo preferido de esta tercera modalidad son las composiciones insecticidas que comprenden un compuesto de la fórmula (IB), en la que:

R¹ es un átomo de hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4

átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o benzofuranilo;

$R^3$  es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, dialquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis

miembros; benzofuranilo, benzotienilo benzofuranilo o benzotienilo sustituidos con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;

**R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloximetoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarboniltio de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquiniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono o alcioxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

**R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono.

Un modo más preferido de esta tercera modalidad está constituido por composiciones insecticidas que comprenden un

compuesto de la fórmula (IB), en la que:

5  $R^1$  es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;

10  $R^3$  es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, benzotienilo sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, 15 haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;

20  $R^4$  es un átomo de hidrógeno, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarboniltio de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquiniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono o alcoxiotalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

$R^6$  es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

25 Una cuarta modalidad de la presente invención se refiere

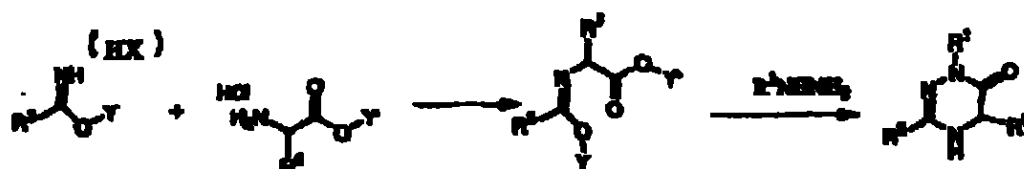
a un método para controlar un hongo, que comprende: aplicar una cantidad fungicidamente efectiva de una composición fungicida que comprende un compuesto de la fórmula (IA) al hongo, al sitio del hongo o al medio en que se desarrolla dicho hongo.

5 Una quinta modalidad de la presente invención se refiere a un método para controlar un insecto, que comprende aplicar una cantidad insecticidamente efectiva de una composición insecticida que comprende un compuesto de la fórmula (IB), al insecto, al sitio del insecto o al medio de desarrollo de dicho insecto.

10 Se puede preparar los compuestos de la presente invención usando los métodos A a K:

### MÉTODO A

15



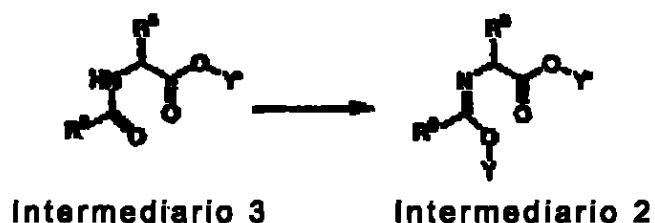
Se puede formar ésteres imídicos (intermediario 1) mediante métodos comunes y corrientes (por ejemplo, Neilson, D. G., en *The Chemistry of Amidines and Imidates* (S. Patai, ed.), Wiley Publishing Co., Nueva Cork, NY E. U. A. (1975), páginas 385-413, y las referencias citadas allí; Klessling, A. J. y McClure, C. K., *Synthetic Communications*, 27(5), 923-927 (1997); y Schafer, F. C. y Peters, G. A., *J. Org. Chem.*, (1961) 26, 412). En la ecuación

25

anterior, X es un ion contrario, tal como cloruro o bromuro, e Y es alquilo o arilo. Los ésteres imídicos pueden ser neutros o pueden ser sales; en el caso de las sales, se añade a la reacción aproximadamente un equivalente de la base. Se puede llevar a cabo las reacciones en cloruro de metileno, dioxano con una cantidad pequeña de etanol, solventes alcohólicos, tales como etanol, metanol o isopropanol o, de preferencia, en cloruro de metileno con 5% de etanol. Se puede llevar a cabo las reacciones a la temperatura ambiente, o se la puede calentar. Se hace reaccionar el Intermediario 2 del producto con una hídrazina para dar el producto deseado. Los solventes para esta reacción incluyen: tetrahidrofurano, dioxano o, de preferencia, un alcohol, tal como etanol, propanol, etc.

Alternativamente se puede preparar el intermediario 2 a partir de un aminoácido acilado, como el mostrado, utilizando tetrafluoroborato de trietiloxonio (o derivados relacionados) o triflato de metilo, como se muestra para el método B.

### MÉTODO B

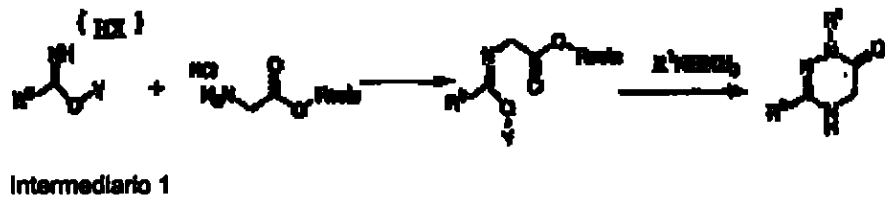


MÉTOD C

146

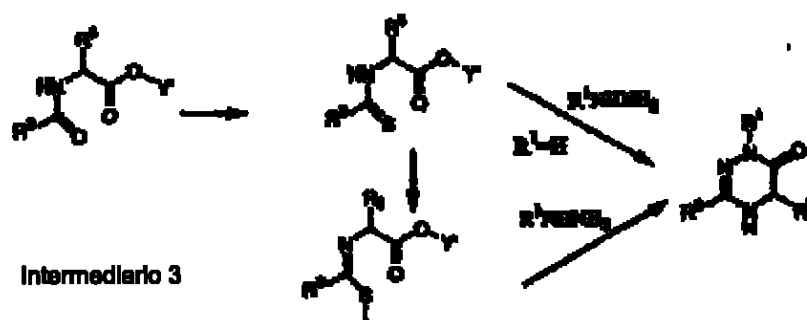
Se puede usar la fase sólida para formar el compuesto de la presente invención:

5

MÉTODO D

Se puede preparar los compuestos descritos en la presente invención a partir de aminoácidos acilados, mediante la reacción mostrada en el esquema que viene a continuación. Se llevó a cabo la preparación de la tioamida con pentasulfuro de fósforo en tolueno, a 90 grados Celsius. Sin embargo, se puede usar otros reactivos, tal como el reactivo de Lawesson y otros solventes. Se llevó a cabo la alquilación de la tioamida usando yoduro de metilo en metanol, con metóxido de sodio o en acetona con carbonato de potasio como base. De preferencia se lleva a cabo la reacción de los intermediarios con hidrazinas en solventes alcohólicos.

25

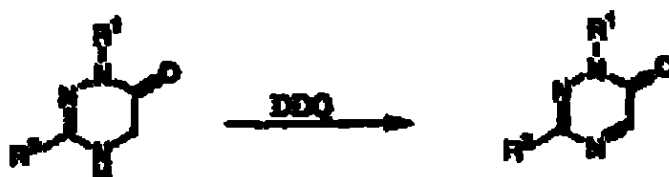


10

**MÉTODO E**

Se puede oxidar las dihidrotriazinonas a las triazinonas usando 2,3-dicloro-5,6-diclorano-1,4-benzoquinona (DDQ). De preferencia se lleva a cabo la reacción en acetato de etilo, si bien se puede usar otros solventes, tales como los hidrocarburos aromáticos.

20



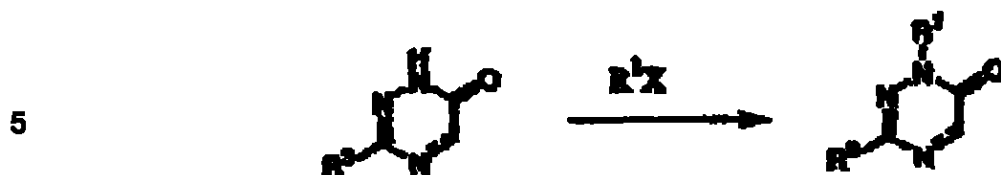
Ocasionalmente ocurre espontáneamente oxidación de una dihidrotriazinona a triazinona durante una reacción, o durante la purificación.

25

**MÉTODO F**

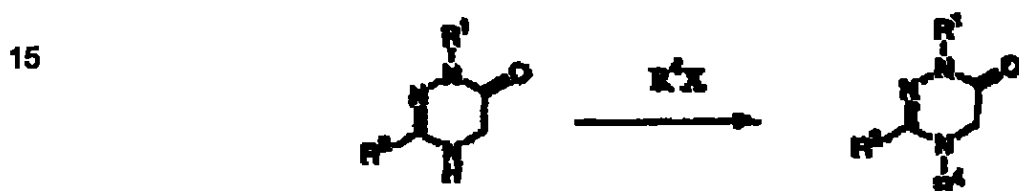
Se puede alquilar los compuestos en N<sup>1</sup> usando una base fuerte, tal como hidruro de sodio o terbutóxido de potasio, en

solventes tales como DMF o THF.  $R^1X$  es cualquier agente alquilante.



### MÉTODO G

10 Se puede formar derivado de  $N^4$  usando una base fuerte, tal como hidruro de sodio o terbutóxido de potasio y un electrófilo. Para los electrófilos reactivos, tales como bicarbonato de dterbutilo, no es necesaria una base ni una base suave, tal como trietilamina.



### MÉTODO H

20

Se puede convertir el carbonilo a un tlocarbonilo usando pentasulfuro de fósforo en tolueno. Se podría usar tanto otros reactivos, tal como el reactivo de Lawesson, como otros solventes.

25

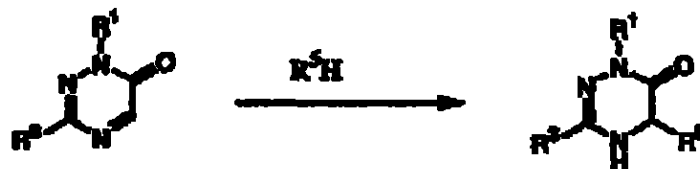


5

**MÉTODO I**

Las 1,2,4-triazin-6-onas pueden reaccionar con nucleófilos, tales como alcoholes o tioles, para formar derivados 5-

10 sustituidos.

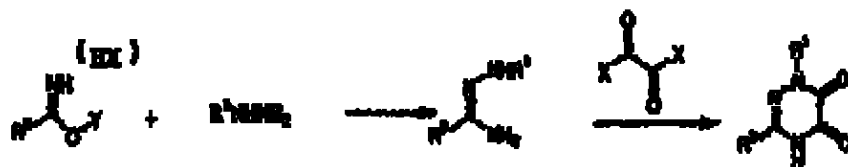


15

**MÉTODO J**

Se puede preparar 1,2,4-triazin-5,6-dionas a partir de amidrazona, mediante reacción con cloruro de oxalilo o con oxalato de dietilo.

20 de dietilo.



25

**MÉTODO K**

;

Se puede añadir un reactivo de Grignard a una 1,2,4-triazin-6-ona en un solvente adecuado, tal como éter o THF, para dar  
5 una dihidrotriazinona.



10

**EJEMPLOS QUE DEMUESTRAN LOS MÉTODOS**

Se llevó a cabo todas las reacciones bajo manto de nitrógeno. Se llevó a cabo las purificaciones cromatográficas usando  
15 gel de sílice bajo aire o, de preferencia, bajo presión de nitrógeno, o bajo presión reducida, o mediante cromatografía de líquido (LC) en fase inversa

**MÉTODO A**

20 **PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(3-CLORO-4-FLUOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 1)**

Se preparó una suspensión de 17.7 gramos (74 mmoles) de clorhidrato de 3-cloro-4-fluorobenzimidato de O-etilo, 12.6 gramos  
25 (90 mmoles) de clorhidrato de etilglicina, 140 mL de cloruro de

metileno y 7 mL de etanol seco. Después de diez minutos de agitación se añadió 9.60 gramos (95 mmoles) de trietilamina durante tres minutos. No resultó una exoterma de importancia. Se dejó agitar la reacción durante la noche a la temperatura ambiente. Se diluyó la reacción con 100 mL de cloruro de metileno y se lavó con dos porciones de 70 mL de agua. Se secó la fase orgánica y se la concentró a presión reducida para producir 15.9 gramos de N-(2-acetato de etilo)-3-cloro-4-fluorobenzimidato de O-etilo, como un aceite color ámbar oscuro. Se hizo reaccionar el material sin purificación ulterior.

Se añadió a gotas, en el término de dos minutos, 2.17 gramos (13.3 mmoles) de 2,2,2-trifluoroetilhidrazina, como una solución al 70 por ciento en agua, a una solución de 3.82 gramos (13.2 mmoles) de N-(2-acetato de etilo)-3-cloro-4-fluorobenzimidato de O-etilo en 25 mL de etanol seco. Se dejó agitar la reacción durante la noche a la temperatura ambiente. Se puso al reflujo la reacción durante una hora, se dejó enfriar, se diluyó con 10 mL de agua. Se recogió el sólido en un embudo de Buchner, se enjuagó con varios mililitros de metanol, y se secó. El rendimiento fue de 1.3 gramos de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3-cloro-4-fluorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

**MÉTODO B****PREPARACIÓN DE 1-BUTIL-3-(2,4-DICLOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 2)**

5                    Se disolvió 6.28 gramos (22.7 mmoles) de etil-2,4-diclorobenzoilglicina en 40 mL de cloruro de metileno. Se añadió de una sola vez 4.89 gramos (30 mmoles) de triflato de metilo, y se dejó agitando la reacción a la temperatura ambiente durante tres días. Se concentró la reacción a presión reducida. Luego se añadió 30 mL de  
10    tolueno y se eliminó a presión reducida para producir 10.6 gramos de trifluorometansulfonato de N-(2-acetato de etilo)-2,4-diclorobenzimidato de O-metilo, como un líquido claro.

                  Se enfrió en un baño de agua con hielo una solución de 5.3 gramos (12 mmoles) de trifluorometansulfonato de N-(2-acetato  
15    de etilo)-2,4-diclorobenzimidato de O-metilo en 30 mL de etanol seco. Se añadió 2.05 gramos (11.5 mmoles) de oxalato de n-butilhidrazina, luego se añadió 5.1 gramos (50 mmoles) de trietilamina, en pequeñas porciones, durante cinco minutos. Se dejó calentar la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente  
20    durante una hora, y a continuación se calentó al reflujo durante la noche. Se concentró la reacción a presión reducida y se dividió entre 125 mL de acetato de etilo y 70 mL de agua. Se concentró la fase orgánica a presión reducida y se cromatografió con acetato de etilo/hexanos. El rendimiento fue de 2.0 gramos de 1-butil-3-(2,4-  
25    diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, como un aceite.

**MÉTODO C****PREPARACIÓN DE 1-BUTIL-3-(4-FENOXIFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-  
TRIAZIN-6-ONA (compuesto 3)****5 Preparación de Fmoc-Gly-resina de Wang**

Se hinchó 70 g (119 mmoles) de resina de Wang (PL-Wang, Polymer Labs, 1.7 mmol/g) en 550 mL de cloruro de metileno y 100 mL de DMF, y se agitó durante treinta minutos con un agitador superior. Se añadió 71 gramos (238 mmoles) de Fmoc-glicina, 10 seguidos por 60 g (476 mmoles) de diisopropilcarbodiimida y 2.4 gramos (19.7 mmoles) de 4-dimetilaminopiridina. Se agitó la reacción durante 3.5 horas a la temperatura ambiente, se filtró la resina, se lavó con metanol y cloruro metileno, en forma alternada, y se secó en un horno de vacío.

**15 Preparación de la dihidrotriazinona**

Se acondicionó 1.3 g de Fmoc-Gly-resina de Wang con 2 x 6 mL de DMF y luego se trató con 5 mL de piperidina al 20 por ciento en DMF, durante 20 minutos. Se filtró la resina y se lavó dos veces con DMF, dos veces con cloruro de metileno y dos veces con 20 metanol. A continuación se añadió 874 mg (3 mmoles) de clorhidrato de 4-feniloxibencimidato de etilo, como un sólido, seguidos por 5 mL de cloruro de metileno y 1.7 mL de una solución de trietilamina en metanol (a 82 mg de trietilamina/mL). Se sacudió la resina durante cuatro horas a la temperatura ambiente y a continuación se filtró y 25 se lavó alternadamente con cloruro de metileno y metanol. Se

acondicionó la resina con cloruro de metileno y se añadió 532 mg (3 moles) de oxalato de butilhidrazina, seguidos por 581 mg de trietilamina y 1.5 mL de etanol. Se sacudió la reacción a la temperatura ambiente durante 48 horas, y se filtró la resina y se la lavó tres veces con cloruro de metileno. Se evaporó los filtrados recogidos hasta sequedad y se purificó el material crudo mediante cromatografía a baja presión, sobre sílice. La evaporación del solvente dio 159 mg de un sólido amarillo.

10

**MÉTODO D****PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(4-CLOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 4)**

A una suspensión de 4.54 g (20 mmoles) de 4-clorobenzoil-metilglicina en 60 mL de tolueno, bajo atmósfera de nitrógeno, se añadió 0.89 g (20 mmoles) de pentasulfuro de fósforo. Se calentó la reacción hasta 90°C durante tres horas. Se añadió otros 0.18 g de pentasulfuro de fósforo y se calentó la reacción durante una hora más; luego se enfrió a la temperatura ambiente. Se filtró el producto, se lavó la suspensión con acetato de etilo y se trató los filtrados combinados a través de gel de sílice sobre Celite, luego se separó. Se cromatografió el producto en una columna de gel de sílice para dar 3.3 g (rendimiento de 68 por ciento) de 4-clorotiobenzoil-metilglicina, que tiene un punto de fusión de 72-73°C.

25

Se enfrió una solución de 2.9 g (11.9 mmoles) de 4-

clorotiobenzoil-metilglicina en 20 mL de metanol, bajo atmósfera de nitrógeno, en un baño de hielo y se trató con 0.67 g (12.4 mmoles) de metóxido de sodio. Se añadió un exceso de 5 g (35 mmoles) de yoduro de metilo y se agitó la reacción. Se añadió en dos porciones  
5 otros 1.15 g de metóxido de sodio, y se dejó calentar la reacción hasta la temperatura ambiente. Se añadió agua y se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo. Se lavó con salmuera la fase orgánica, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se separó para dar 2.87 g del éter 4-clorofenil(metilitio)imínico del éster  
10 metílico del ácido N-2-acético.

Se agitó durante la noche a la temperatura ambiente, una mezcla de 1.63 g (6.3 mmoles) de éter 4-clorofenil(metilitio)imínico del éster metílico del ácido N-2-acético y 2.26 g (13.8 mmoles) de 2,2,2-trifluoroetilhidrazina en etanol; luego se calentó al reflujo. Se  
15 enfrió la reacción y se separó el etanol. Se extrajo el residuo con acetato de etilo. La cromatografía en columna dio 0.33 g de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(4-clorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, con punto de fusión de 178-180°C.

20 **PREPARACIÓN DE 3-(4-CLOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 5)**

Se combinó 4.87 g (20 mmoles) de 4-clorotiobenzoilmetilglicina, 2.2 g (44 mmoles) de hidrato de hidracina  
25 y 20 mL de metanol, y se agitó a la temperatura ambiente durante la

noche, luego se calentó al reflujo. Se enfrió la mezcla de reacción y se filtró. Se lavó los sólidos, luego se secó, lo que dio 3-(4-clorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

5     **PREPARACIÓN DE 1-TERBUTIL-3-(4-CLOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 6)**

Se enfrió en un baño de hielo una solución de 7.2 gramos (28 mmoles) de éter 4-clorofenil(metilito)imínico del éster etílico del  
10     ácido N-2-acético en 40 mL de etanol seco, y se trató con 5.3 gramos (74 mmoles) de hidrato de terbutilhidrazina. Se dejó agitando la reacción durante la noche a la temperatura ambiente, luego se puso al reflujo durante 7.5 horas y se dejó enfriar. Se concentró la mitad de la mezcla de reacción a presión reducida, luego se disolvió en 20  
15     mL de xilenos. Se calentó la reacción a 120°C-130°C durante seis horas. Se diluyó la reacción con 100 mL de acetato de etilo y se lavó con 60 mL de agua, se secó y se concentró a presión reducida. Después de cromatografiar se obtuvo 50 mg de 1-terbutil-3-(4-clorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

20

**MÉTODO E**

**PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-FENIL-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 7)**

25

Se agitó a la temperatura ambiente durante la noche una

mezcla de 0.51 g (2.0 mmoles) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-fenil-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona y 0.48 g (2.1 mmoles) de DDQ en 20 mL de acetato de etilo; luego se calentó a 70°C durante dos horas. Se enfrió la mezcla de reacción y se lavó con carbonato de potasio acuoso, dos veces con agua, y luego con salmuera; se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se separó. Se disolvió el producto en acetato de etilo/cloruro de metileno y se trató con gel de sílice, luego se filtró a través de gel de sílice sobre Celite, para dar 0.40 g de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-fenil-1,2,4-triazin-6-ona, con punto de fusión de 129-131°C.

### MÉTODO F

#### PREPARACIÓN DE 1-(2-PENTINIL)-3-(4-CLOROFENIL)-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 8)

15

Se agitó a la temperatura ambiente, durante la noche, una mezcla de 2.00 g (9.6 mmoles) de 3-(4-clorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona y 2.28 g de DDQ en 120 mL de acetato de etilo; luego se calentó al reflujo durante tres horas. Se enfrió la mezcla de reacción y se filtró para dar 0.4 g de un sólido color canela, que fue secado en un horno al vacío y usado sin purificación ulterior.

20

Se colocó los 0.4 g (1.9 mmol) de 3-(4-clorofenil)-1,2,4-triazin-6-ona en 10 mL de DMF y se enfrió en un baño de hielo. Se añadió 0.8 g (2 mmoles) de una dispersión al 60 por ciento de hidruro de sodio (NaH), y se mantuvo la mezcla de reacción durante

25

15 minutos. Se añadió un exceso de 1-cloro-2-pentina y se retiró el baño; luego se dejó calentar la mezcla de reacción hasta la temperatura ambiente. Se añadió agua y acetato de etilo. Se lavó con agua y con salmuera la fase orgánica, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se separó. Se cromatografió el producto crudo sobre gel de sílice para dar 0.05 g de 1-(2-pentinil)-3-(4-clorofenil)-1,2,4-triazin-6-ona.

**PREPARACIÓN DE 1-CICLOPROPILMETIL-3-(3,4-DICLOROFENIL)-**

10      **4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 9)**

A una solución de 0.82 gramos (2.9 mmoles) de 3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, preparada mediante el método A, en 10 mL de N,N-dimetilformamida (DMF), se añadió 0.14  
15 gramos (3.5 mmoles) de NaH al 60 por ciento, revestido con aceite mineral. Después de agitar durante 30 minutos, se añadió 0.46 gramos (3.4 mmoles) de bromometilciclopropano y se dejó agitando la reacción durante la noche a la temperatura ambiente.

Se diluyó la reacción con 60 mL de agua y 150 mL de  
20 acetato de etilo. Se lavó la fase orgánica con 60 mL de agua, se secó y se concentró a presión reducida. Se cromatografió el producto crudo sobre gel de sílice con acetato de etilo/hexano, para producir 0.23 gramos de 1-ciclopropilmetil-3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

MÉT DO G

**PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4-ALILOXICARBONIL-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 10)**

5

A una solución de 110 mg (0.34 mmol) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona en 5 mL de tetrahidrofurano, se añadió 30 mg (0.67 mmol) de hidruro de sodio. Después de agitar durante cinco minutos la reacción, se  
10 añadió a gotas 0.07 mL (0.67 mmol) de cloroformiato de alilo. Después se calentó la reacción al reflujo durante seis horas, se enfrió con agua y se diluyó con acetato de etilo. Se separó las dos capas y se extrajo la fase acuosa con 3 x 5 mL de acetato de etilo. Se secó los extractos orgánicos combinados, sobre sulfato de  
15 magnesio, se filtró y se concentró al vacío. La cromatografía en columna rápida (100 por ciento de hexanos-10 por ciento de acetato de etilo/hexanos) produjo 130 mg (93 por ciento) del producto 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3,5-diclorofenil)-4-alloxycarbonil-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, como un aceite amarillo, con 100 por ciento de  
20 pureza mediante cromatografía de gas (GC).

**PREPARACIÓN DE 1,4-DI-(TERBUTOXICARBONIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto**

11)

25

00160

A una solución de 40 mg (0.16 mmol) de 3-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona en 3 mL de diclorometano/acetato de etilo, 1:1, a 0°C, se añadió 10 mg (0.02 mmol) de N,N-dimetilaminopiridina y 40 mg (0.18 mmol) de anhídrido de *tert*-butilcarbonilo. Después de agitar la reacción durante dos horas a la temperatura ambiente, se la enfrió con agua y se diluyó con acetato de etilo. Se separó las dos capas y se lavó con 1 x 5 mL de agua la fase orgánica, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Después de cromatografiar en columna rápida (10 por ciento de acetato de etilo/hexanos) se produjo 50 mg (71 por ciento) del producto acilado 1,4-di(*tert*butoxicarbonil)-3-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

**PREPARACIÓN DE 1-n-BUTIL-3-(3,4-DICLOROFENIL)-4-METILTIOIOTICARBONIL-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA**  
**(Compuesto 12)**

A una solución de 310 mg (1.03 mmol) de 1-n-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, disueltos en 5 mL de tetrahidrofurano (THF) se añadió 40 mg (1.03 mmol) de hidruro de sodio. Después de enfriar la mezcla a 0°C se añadió 0.09 mL (1.45 mmol) de disulfuro de carbono. Después se agitó la mezcla de reacción a 0°C durante 20 minutos y se añadió 0.19 mL (3.0 mmoles) de yodometano. Después de agitar la reacción a 0°C durante una hora, se la enfrió con agua y se diluyó con acetato de etilo. Se

extrajo la capa acuosa con 3 x 5 mL de acetato de etilo; se secó los extractos orgánicos combinados, sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Se sometió el material crudo a cromatografía en columna rápida (10 por ciento de acetato de etilo/hexanos) para dar 310 mg (78 por ciento) de 1-n-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4-metiltiotiocarbonil-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona como un sólido naranja, con pureza de 98 por ciento.

**PREPARACIÓN DE 1-n-BUTIL-3-(3,4-DICLOROFENIL)-4-(2-FENILSULFONILETENO)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA**  
**(Compuesto 13)**

A una solución de 400 mg (1.33 mmoles) de 1-n-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona en 10 mL de THF a 0°C, se añadió 250 mg (1.47 mmoles) de bis(trimetilsilil)amida de litio (LiHMDS) y 450 mg (1.47 mmoles) de trans-1,2-bis(fenilsulfonil)-etileno. Después que se agitó la reacción a 0°C durante treinta minutos, se dejó calentar a la temperatura ambiente y luego se agitó durante dos horas. Se enfrió con agua la reacción y se diluyó con acetato de etilo. Se extrajo la capa acuosa con 3 x 5 mL de acetato de etilo y se secó los extractos orgánicos combinados sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Se sometió la mayor parte del material crudo a cromatografía en columna rápida con gradiente 820 por ciento de acetato de etilo/1 por ciento de trietilamina/79 por ciento de hexanos a 50% de acetato de etilo/1 por

ciento de trietilamina/49 por ciento de hexanos) para dar 260 mg del producto, como un sólido pardo. Se filtró el producto crudo insoluble, restante, se lo lavó con acetato de etilo y secó para producir 100 mg del producto. Se combinó las dos porciones para dar 350 mg de 1-n-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4-(2-fenilsulfoniletano)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona en rendimiento de 56 por ciento.

**PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4-(METOXCARBONILTIO)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 14)**

10

A una solución de 110 mg (0.34 mmol) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, disueltos en 5 mL de tetrahidrofurano, se añadió 0.06 mL (0.40 mmol) de trietilamina y 0.04 mL (0.40 mmol) de cloruro de metoxycarbonilsulfenilo. Después de 30 minutos se enfrió con agua la reacción y se diluyó con acetato de etilo. Se extrajo la capa acuosa con 2 x 5 mL de acetato de etilo y se secó los extractos orgánicos combinados, sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Se sometió el material crudo a cromatografía en columna rápida (10 por ciento de acetato de etilo/hexanos) para dar 60 mg (43 por ciento) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3,5-diclorofenil)-4-(metoxycarboniltio)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona, con 80 por ciento de pureza mediante LC.

25

**PREPARACIÓN DE 1-(n-BUTIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4-**  
**(CLOROMETILOXICARBONIL)-4,5-DIHIRO-1,2,4-TRIAZIN-6- NA**  
**(Compuesto 15)**

5           Se aciló 1-(n-butil-3-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona con cloroformiato de clorometilo, de manera similar a la reacción descrita para formar el compuesto 14, excepto que se usó piridina como base. Se aisló el producto 1-(n-butil)-3-(3,5-diclorofenil)-4-(clorometiloxicarbonil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona  
10 en un rendimiento de 51 por ciento.

**PREPARACIÓN DE 1-(n-BUTIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-4-**  
**(YODOMETILOXICARBONIL)-4,5-DIHIRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA**  
**(Compuesto 16)**

15

Se trató 1-(n-butil)-3-(3,5-diclorofenil)-4-(clorometiloxicarbonil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona con yoduro de sodio en acetona, como fue descrito por Folkmann, M, Luna, F. J., *Synthesis* 1990, 1159, para dar 1-(n-butil)-3-(3,5-diclorofenil)-4-  
20 (yodometiloxicarbonil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

**MÉTODO H**

**PREPARACIÓN DE 1-BUTIL-3-(3,4-DICLOROFENIL)-4,5-DIHIRO-**  
**1,2,4-TRIAZIN-6-TIONA (Compuesto 17)**

25

A una solución de 1.31 gramos (4.4 mmoles) de 1-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona en 12 mL de tolueno, se añadió 0.37 gramos (8.3 mmoles) de pentasulfuro de fósforo. Se calentó la reacción a 95°C durante siete horas. Después de enfriar se añadió 1.4 gramos de gel de sílice de calidad rápida. Se filtró la reacción a través de Celite y se concentró a presión reducida. Se cromatografió el aceite con 22 por ciento de acetato de etilo/hexanos y se aisló 0.95 gramo de 1-butil-3-(3,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

10

### MÉTODO I

#### PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-5-METOXI-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 18)

15

A una solución de 70 mg (0.21 mmol) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(3,5-diclorofenil)-1,2,4-triazin-6-ona, disueltos en 3 mL de una mezcla 1:1 de acetato de etilo y metanol, se añadió una cucharadita de alúmina neutra. Después de agitar durante 20 minutos se filtró la mezcla a través de un pequeño tapón de lana de vidrio y se concentró. Se produjo 80 mg del producto con 96 por ciento de pureza, en un rendimiento de 100 por ciento.

20

**PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(4-CLOROFENIL)-5-  
PROPILTIO-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 19)**

Se trató una solución de 0.40 g (1.4 mmol) de 1-(2,2,2-  
5 trifluoroetil)-3-(4-clorofenil)-1,2,4-triazin-6-ona, preparada de manera  
similar a la del compuesto 7, en mL de acetato de etilo, con exceso  
de propanotiol, a la temperatura ambiente. Se agitó durante una  
hora la mezcla de reacción, luego se añadió más acetato de etilo.  
Se lavó la mezcla de reacción dos veces con carbonato de potasio  
10 acuoso, luego con agua y con salmuera, se secó sobre sulfato de  
magnesio, se filtró y se separó. Se recrystalizó el sólido resultante  
en cloruro de metileno/hexano para dar 0.28 g de cristales de color  
amarillo pálido (rendimiento de 55 por ciento), p. f. 99-100°C.

15 **PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(4-CLOROFENIL)-5-  
(2-PROPANONA)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto  
20) 20**

Se agitó durante ocho días a la temperatura ambiente,  
20 una solución de 0.63 gramo (1.9 mmol) de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(4-  
clorofenil)-1,2,4-triazin-6-ona en 20 mL de acetona y 1.5 mL de  
regulador fosfato a pH 10. Se diluyó la reacción con 50 mL de agua  
y 125 mL de acetato de etilo. Se separó la fase orgánica, se secó y  
se concentró a presión reducida. Se trituró el crudo con 50 mL de  
25 acetato de etilo y se desechó los insolubles. Se cromatografió el

material con 50-100 por ciento de acetato de etilo/hexanos, para dar 0.17 g de 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-(4-clorofenil)-5-(2-propanona)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

5

**MÉTODO J****PREPARACIÓN DE 1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-3-(3,5-DICLOROFENIL)-1,2,4-TRIAZIN-5,6-DIONA (Compuesto 21)**

A una solución enfriada con hielo, de 2.46 g (9.65  
10 mmoles) de clorhidrato de 3,5-diclorobenzimidato de etilo, disueltos en 100 mL de etanol, se añadió 9.65 mmoles de una solución acuosa al 70 por ciento en peso de trifluoroetilhidrazina. Se agitó la reacción durante cuatro horas a la temperatura ambiente, y luego se inactivó con solución saturada de bicarbonato de sodio y se diluyó  
15 con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío, para dar 2.7 g de amidrazona, como un aceite pardo claro, que tiene 58 por ciento de pureza. A una solución de la amidrazona en 10 mL de tolueno se añadió 2.9 mL (20.8 mmoles) de trietilamina. Se enfrió la reacción a  
20 0°C y se añadió 0.9 mL (10.4 mmoles) de cloruro de oxalilo durante 10 minutos. Después de agitar la reacción durante treinta minutos a 0°C, se enfrió con agua y se diluyó con acetato de etilo. Se lavó con salmuera la capa orgánica, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Se sometió la mezcla de reacción  
25 cruda a cromatografía en columna rápida (10 por ciento de acetato

de etilo/hexanos-100 por ciento de acetato de etilo) para dar 250 mg (rendimiento de 8 por ciento) de la dicetona, con pureza de 74 por ciento.

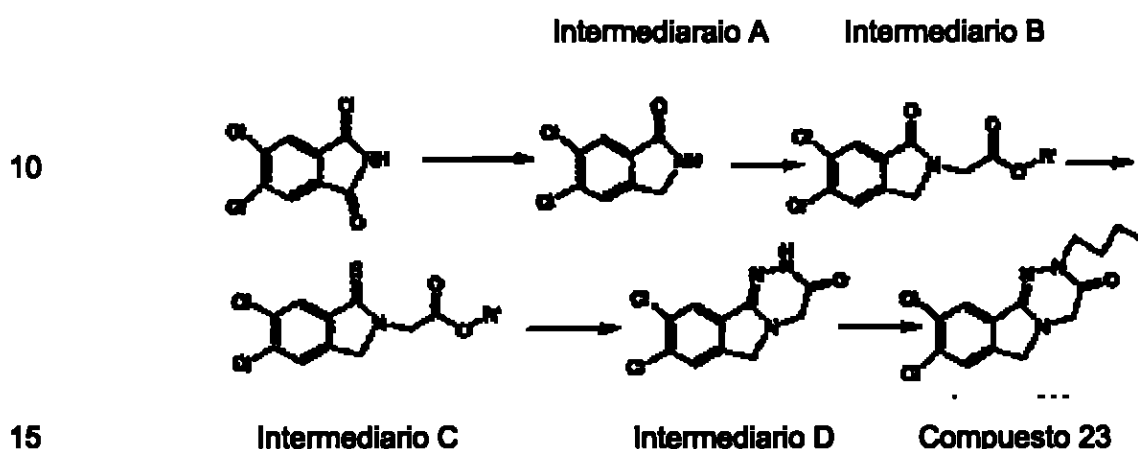
5

**MÉTODO K****PREPARACIÓN DE 1-BUTIL-3-METIL-5-(4-METILFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONA (Compuesto 22)**

Se añadió 1.64 mL (1.0 M en éter) de bromuro de 4-  
10 metilfenilmagnesio, de una sola vez, por medio de una jeringa, a una solución bien agitada de 178 mg (1.06 mmol) de 1-n-butil-3-metil-1,2,4-triazin-6-ona en 9.85 mL) de éter, bajo N<sub>2</sub> y a la temperatura ambiente. Después de agitar durante la noche la mezcla resultante, se añadió 10 mL de cloruro de amonio acuoso, saturado y 10 mL de  
15 acetato de etilo, se separó la fase orgánica y se extrajo la capa acuosa una vez más con acetato de etilo. Se secó las capas orgánicas combinadas sobre sulfato de sodio y se evaporó hasta sequedad. Se purificó el producto crudo mediante cromatografía rápida sobre gel de sílice (5 g, 4:1 de hexanos:acetato de etilo) para  
20 dar 236 mg (rendimiento de 86%) del compuesto 22, como un sólido color canela.

**MISCELÁNEA****9,10-DICLORO-2-BUTIL-1,2,4-TRIAZINO[3,4-a]ISOINDOL-3(4H)-ONA****(Compuesto 23)**

5                    Se preparó el compuesto 23 en cinco pasos, a partir de 4,5-dicloroftalimida, tal como se muestra en el siguiente esquema:



Se dejó al reflujo, durante seis horas, una mezcla de 6 g de 4,5-dicloroftalimida y 13.8 g de polvo de zinc en 200 mL de ácido acético. Se enfrió a 70°C, luego se filtró a través de Celite y se separó. Se añadió cloruro de metileno y una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, y se agitó durante la noche la mezcla. Se filtró los sólidos y se los secó en un horno de vacío. Se usó este producto (intermediario A) sin purificación ulterior.

Se añadió a 1.03 g (5.1 mmoles) del intermediario A en 5 mL de DMF, 0.21 g (5.25 mmoles) de hidruro de sodio al 60 por ciento. Se agitó la mezcla de reacción durante 0.5 hora, luego se añadió 0.92 g (5.25 mmoles) de bromoacetato de etilo. Se agitó

durante la noche la mezcla de reacción, luego se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Se separó las fases, se lavó con agua la fase orgánica y luego con salmuera, y se secó sobre sulfato de magnesio; a continuación se separó. La cromatografía en  
5 columna dio 0.42 g del intermediario B.

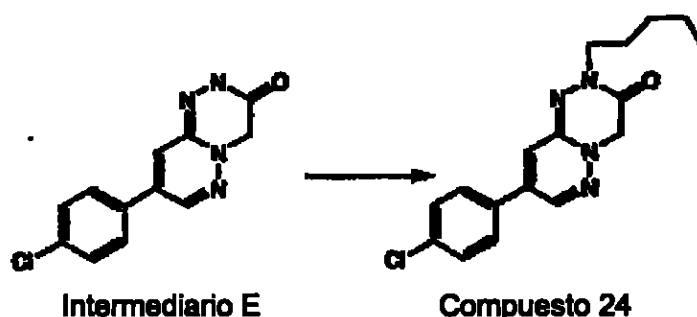
Se calentó a 90°C 0.69 g (2.4 mmoles) del intermediario B y 0.13 g (2.9 mmoles) de pentasulfuro de fósforo, en tolueno. Se enfrió el producto y se filtró a través de gel de sílice, para dar 0.6 g del producto, que fue una razón 5:1 de intermediario C a  
10 intermediario B. Se usó este material sin purificación adicional.

Se dejó al reflujo 0.6 g (2 mmoles) del intermediario C y 0.13 g (2.6 mmoles) de hidrato de hidracina en 5 mL de etanol, para dar el Intermediario D. Se pudo purificar este material mediante cromatografía.

15 Se desprotonó 0.07 g (0.3 mmol) del intermediario D con 0.02 g (0.5 mmol) de hidruro de sodio (al 60 por ciento) en DMF. Después de 15 minutos se añadió yoduro de n-butilo y se agitó durante la noche la reacción. Se diluyó con agua la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo. Se separó las fases, se  
20 lavó con agua la fase orgánica y con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio, luego se separó. La cromatografía dio 0.02 g del compuesto 23.

**2-PENTIL-7-(4-CLOR FENIL)-PIRIDAZINO[6,1-c]TRIAZIN-3(4H)ONA****(Compuesto 24)**

5



10

Se preparó 2-H-7-(4-clorofenil)piridazino[6,1-c][1,2,4]triazin-3(4H)ona (Intermediario E) a partir de 6-(4-clorofenil)piridazin-3-ona (para la síntesis, véase Steck y coautores, *J. AMER. Chem. Soc.*, (1953), 75, 1117; o Coates, W. J., McKillop, A., *Synthesis*, (1993), 334-342; o Tisler, M., Stanovnik, B. en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Katritsky y Rees, ed., tomo 3, parte 2B, Pergamon Press, 1984, PA), en tres pasos, mediante una secuencia similar a la usada para convertir el intermediario A al intermediario D en el ejemplo anterior.

20

A una solución de 130 mg (0.50 mmol) del intermediario E en 5 mL de DMF, se añadió 80 mg (0.60 mmol) de carbonato de potasio y 0.08 mL (0.60 mmol) de yodopentano. Se agitó la mezcla a la temperatura ambiente durante 45 minutos, y luego a 65°C durante 1.5 horas. Después de agitar a la temperatura ambiente durante la noche, se inactivó la reacción con agua y se diluyó con acetato de

25

etilo. Se extrajo la capa acuosa con 3 x 5 mL de acetato de etilo, y se secó los extractos orgánicos combinados sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Se sometió el material crudo a cromatografía en columna rápida dos veces (20 por ciento de acetato de etilo/hexanos), para dar 120 mg (75 por ciento) del producto, como un sólido naranja.

**1-n-BUTIL-3-(2-HIDROXIFENIL)-4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6- NA**  
**(Compuesto 83)**

10

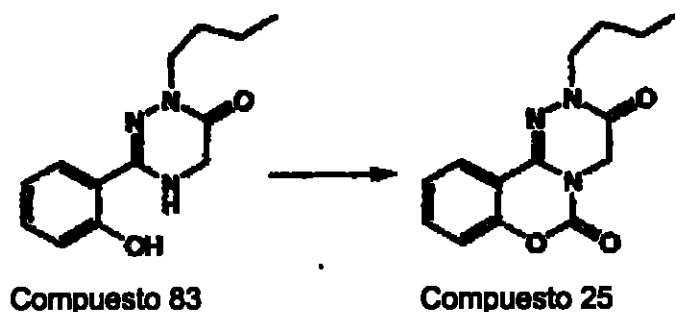
A una solución de 1.53 g (5.86 mmoles) del compuesto 195, preparado mediante las reacciones descritas para el método B, disueltos en 10 mL de DMF, se añadió 1.97 g (23.5 mmoles) de la sal de sodio de etanotiol, como un sólido que fluye libremente. Se calentó la mezcla resultante a 100°C durante 4.5 horas. Después se la dejó agitando durante la noche, después de lo cual se inactivó la reacción con agua y se diluyó con acetato de etilo. Se extrajo la capa acuosa con 3 x 5 mL de acetato de etilo. Se secó las capas orgánicas combinadas sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. Después de cromatografía en columna rápida (20-50 por ciento de acetato de etilo/hexanos) se produjo 0.79 g (rendimiento de 54 por ciento) del compuesto 83, como un sólido pardo.

25

**3-n-BUTIL-3H-9-OXA-3,10A-DIAZ-FENANTRENO-2,10-DIONA**

(Compuesto 25)

5



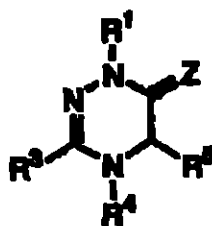
A una solución de 0.21 g (0.85 mmol) del compuesto 83, disueltos en 5 mL de diclorometano, se añadió 0.13 mL (0.94 mmol) de trietilamina. Se enfrió la solución a 0°C en un baño de hielo y se

10 añadió 0.28 g (0.94 mmol) de trifósgeno. Después de 15 minutos se retiró el baño de enfriamiento. Después que se agitó la reacción durante 45 minutos a la temperatura ambiente, se completó la reacción mediante TLC. Se inactivó la reacción con solución saturada de bicarbonato de sodio. Se lavó la capa orgánica con

15 salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró al vacío. La cromatografía en columna rápida (15-20 por ciento de acetato de etilo/hexanos) dio 90 mg (39 por ciento de rendimiento) del compuesto 25, como un aceite amarillo.

Mediante métodos similares se preparó los siguientes

20 compuestos que están mostrados en la Tabla 1.

**TABLA 1 - 4,5-DIHIDRO-1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS**

25

00173

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>            | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|---------------------------|----------------|----------------|---|
| 26  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | metoxi         | O |
| 27  | metilo               | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 28  | fenilo               | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 29  | fenilo               | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 30  | bencilo              | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 31  | metilo               | fenilo                    | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 32  | hidrógeno            | fenilo                    | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 33  | 2,2,2-trifluoroetilo | fenilo                    | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 34  | 2,2,2-trifluoroetilo | fenilo                    | metilo         | hidrógeno      | O |
| 35  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-metoxifenilo            | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 36  | n-butilo             | 4-metoxifenilo            | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 37  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-clorofenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 38  | n-butilo             | 4-metoxifenilo            | hidrógeno      | metilo         | O |
| 39  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-metoxifenilo            | hidrógeno      | metoxi         | O |
| 40  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-clorofenilo             | acetilo        | hidrógeno      | O |
| 41  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-metilfenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 42  | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-clorofenilo             | metansulfonilo | hidrógeno      | O |
| 43  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo         | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 44  | 2,2,2-trifluoroetilo | bencilo                   | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 45  | 2,2,2-trifluoroetilo | ciclohexilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 46  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-metoxifenilo            | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 47  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-dicloro-4-metilfenilo | hidrógeno      | hidrógeno      | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>              | R <sup>2</sup>                      | R <sup>3</sup>              | R <sup>4</sup>          | Z |
|-----|-----------------------------|-------------------------------------|-----------------------------|-------------------------|---|
| 48  | 2-butilo                    | ciclohexilo                         | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 49  | n-pentilo                   | 3,5-dicloro-4-metilfenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 50  | n-butilo                    | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 51  | 2,2,2-trifluoroetilo        | 4-trifluorometilfenilo              | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 52  | 2,2,2-trifluoroetilo        | 2-piridilo                          | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 53  | 2,2,2-trifluoroetilo        | 2-piridilo                          | hidrógeno                   | hidroxil <sup>(a)</sup> | O |
| 54  | n-pentilo                   | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 55  | n-hexilo                    | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 56  | n-octilo,                   | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 57  | n-decilo                    | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 58  | 3-metilfenilo               | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 59  | 2-piridilo                  | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 60  | cianometilo                 | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 61  | trimetilsililmetilo         | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 62  | 2-(5-clorotiofeno)-metilo   | 4-clorofenilo                       | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 63  | 2-(5-clorotiofeno)-metilo   | 4-clorofenilo                       | 2-(5-clorotiofeno)-metilo   | hidrógeno               | O |
| 64  | hidrógeno                   | 3,5-diclorofenilo                   | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 65  | 2-cloroalilo                | 3,5-diclorofenilo                   | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 66  | 3-cloroalilo <sup>(a)</sup> | 3,5-diclorofenilo                   | 3-cloroalilo <sup>(a)</sup> | hidrógeno               | O |
| 67  | 3-cloroalilo <sup>(a)</sup> | 3,5-diclorofenilo                   | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 68  | n-butilo                    | 5-(2-metil-4-trifluoro-metiltiazol) | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 69  | n-butilo                    | 3,4-difluorofenilo                  | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 70  | 2,2,2-trifluoroetilo        | 2,5-diclorofenilo                   | hidrógeno                   | hidrógeno               | O |
| 71  | 2,2,2-trifluoroetilo        | 3,5-diclorofenilo                   | metoxycarbonilo             | hidrógeno               | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>                | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>         | Z |
|-----|----------------------|-------------------------------|-------------------|------------------------|---|
| 72  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo             | acetilo           | hidrógeno              | O |
| 73  | 2,2,2-trifluoroetilo | 2,4-diclorofenilo             | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 74  | n-butilo             | 2,5-diclorofenilo             | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 75  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 4-metilfenilo          | O |
| 76  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 2-metilfenilo          | O |
| 77  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 3-metilfenilo          | O |
| 78  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 3-aminofenilo          | O |
| 79  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 4-metoxifenilo         | O |
| 80  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 3-metoxifenilo         |   |
| 81  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 4-clorofenilo          | O |
| 82  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 2,4,6-trimetilfenilo   | O |
| 83  | n-butilo             | 2-hidroxifenilo               | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 84  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-fluorofenilo                | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 85  | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo             | oxalato de metilo | hidrógeno              | O |
| 86  | ciclopropilmetilo    | 3-trifluorometilfenilo        | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 87  | propargilo           | 3-trifluorometilfenilo        | propargilo        | hidrógeno              | O |
| 88  | propargilo           | 3-trifluorometilfenilo        | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 89  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-trifluorometilfenilo        | propargilo        | hidrógeno              | O |
| 90  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-(bis)trifluorometilfenilo | hidrógeno         | hidrógeno              | O |
| 91  | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-trifluorometilfenilo        | alenilo           | hidrógeno              | O |
| 92  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | fenilo                 | O |
| 93  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 4-fluorofenilo         | O |
| 94  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 3-metil-4-fluorofenilo | O |
| 95  | n-butilo             | metilo                        | hidrógeno         | 4-terbutilfenilo       | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>           | R <sup>2</sup>              | R <sup>3</sup>              | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|--------------------------|-----------------------------|-----------------------------|----------------|---|
| 96  | 2,2,2-trifluoroetilo     | 2-fluorofenilo              | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 97  | 2,2,2-trifluoroetilo     | 2-clorofenilo               | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 98  | 2,2,2-trifluoroetilo     | 3,4-difluorofenilo          | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 99  | 2,2,2-trifluoroetilo     | 3,4-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 100 | etilo                    | 3,4-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 101 | n-butilo                 | 3,4-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 102 | etoxicarbonil-<br>metilo | 3,4-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 103 | bencilo                  | 3,4-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 104 | n-butilo                 | 3,5-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 105 | 2,2,2-trifluoroetilo     | 2-metilfenilo               | hidrógeno                   | hidroxi        | O |
| 106 | n-butilo                 | 3-cloro-4-<br>fluorofenilo  | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 107 | propilo                  | 3,5-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 108 | 2-etoxietilo             | 3,5-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 109 | ciclopropilmetilo        | 3,5-diclorofenilo           | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 110 | n-butilo                 | 3-clorofenilo               | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 111 | fenilo                   | 3-clorofenilo               | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 112 | 3-metilfenilo            | 3-clorofenilo               | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 113 | 2,2,2-trifluoroetilo     | 3,5-diclorofenilo           | viniloxycarbonilo           | hidrógeno      | O |
| 114 | n-butilo                 | 3-metoxifenilo              | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 115 | n-butilo                 | 3-trifluorometil-<br>fenilo | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 116 | n-butilo                 | 4-etoxifenilo               | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 117 | n-butilo                 | 4-trifluorometil-<br>fenilo | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |
| 118 | n-butilo                 | 3,5-diclorofenilo           | acetoximetoxi-<br>carbonilo | hidrógeno      | O |
| 119 | n-butilo                 | 2-naftilo                   | hidrógeno                   | hidrógeno      | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>             | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|----------------------------|------------------------|----------------|---|
| 120 | n-butilo             | 3,5-dibromo-4-metoxifenilo | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 121 | n-butilo             | 3,5-dicloro-4-piridilo     | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 122 | metilo               | 4-trifluorometil-fenilo    | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 123 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo          | oxalato de metilo      | hidrógeno      | O |
| 124 | hidrógeno            | 2-naftilo                  | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 125 | etoxicarbonil-metilo | 3,4-difluorofenilo         | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 126 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo          | 2-cloroetilo           | hidrógeno      | O |
| 127 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | viniloxycarbonilo      | hidrógeno      | O |
| 128 | alilo                | 3,5-diclorofenilo          | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 129 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | (metililo)carbonilo    | hidrógeno      | O |
| 130 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | metoxicarbonilo        | hidrógeno      | O |
| 131 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | propargilo             | hidrógeno      | O |
| 132 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | aliloxycarbonilo       | hidrógeno      | O |
| 133 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | propargiloxycarbonilo  | hidrógeno      | O |
| 134 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo          | 2-propeniloxycarbonilo | hidrógeno      | O |
| 135 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | 2-propeniloxycarbonilo | hidrógeno      | O |
| 136 | n-butilo             | 3,2-diclorofenilo          | viniloxycarbonilo      | hidrógeno      | O |
| 137 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo          | acrililo               | hidrógeno      | O |
| 138 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo          | acrililo               | hidrógeno      | O |
| 139 | bencilo              | 3,4-difluorofenilo         | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 140 | 2,2,2-trifluoroetilo | 2-furilo                   | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 141 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-quinolina                | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 142 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-(4-nitrofenil)-fenilo    | hidrógeno              | hidrógeno      | O |
| 143 | 2,2,2-trifluoroetilo | 2-naftilo                  | hidrógeno              | hidrógeno      | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>              | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|-----------------------------|----------------|----------------|---|
| 144 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-(1-1,2,3-tiadiazol)fenilo | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 145 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-(4-1,2,3-tiadiazol)fenilo | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 146 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-fenilfenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 147 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-metilfenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 148 | n-propilo            | 4-fluorofenilo              | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 149 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-fluorofenilo              | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 150 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-etilfenilo                | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 151 | n-propilo            | 4-propoxifenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 152 | hidrógeno            | 4-propoxifenilo             | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 153 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-trifluorometilfenilo      | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 154 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-metilfenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 155 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-butiloxifenilo            | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 156 | metilo               | 4-fenoxifenilo              | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 157 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-nitro-3-metilfenilo       | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 158 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-dibromo-4-metoxifenilo  | hidrógeno      | hidrógeno      |   |
| 159 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-dicloro-4-piridilo      | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 160 | 2-cianoetilo         | 4-butiloxifenilo            | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 161 | 4-clorofenilo        | 4-etoxifenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 162 | n-butilo             | 2-benzotiofeno              | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 163 | 2,2,2-trifluoroetilo | 2-benzotiofeno              | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 164 | n-propilo            | 3,5-diclorofenilo           | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 165 | etoxicarbonilmetilo  | 3-metilfenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 166 | 2-cianoetilo         | 4-(4-nitrofenil)fenilo      | hidrógeno      | hidrógeno      | O |
| 167 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-nitrofenilo               | hidrógeno      | hidrógeno      | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>                       | R <sup>3</sup>           | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|--------------------------------------|--------------------------|----------------|---|
| 168 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | propargilo               | hidrógeno      | O |
| 169 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo                    | propargilo               | hidrógeno      | O |
| 170 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | 2-propeniloxi-carbonilo  | hidrógeno      | O |
| 171 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | propargiloxi-carbonilo   | hidrógeno      | O |
| 172 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | aliloxycarbonilo         | hidrógeno      | O |
| 173 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | fenoxycarbonilo          | hidrógeno      | O |
| 174 | hidrógeno            | 3,4-diclorofenilo                    | hidrógeno                | hidrógeno      |   |
| 175 | n-butilo             | 3-cianofenilo                        | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 176 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-cianofenilo                        | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 177 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | 1-crotonilo              | hidrógeno      | O |
| 178 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | fenoxitiocarbonilo       | hidrógeno      | O |
| 179 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | 2-cloroetiloxi-carbonilo | hidrógeno      | O |
| 180 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | 2-pentinilo              | hidrógeno      | O |
| 181 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | ciclopropilcarbonilo     | hidrógeno      | O |
| 182 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | bencilo                  | hidrógeno      | O |
| 183 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | butinilo                 | hidrógeno      | O |
| 184 | bencilo              | 3-nitrofenilo                        | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 185 | bencilo              | 2-piridilo                           | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 186 | 3-metilfenilo        | 4-fenilfenilo                        | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 187 | 3-metilfenilo        | 4-metilfenilo                        | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 188 | 3-metilfenilo        | 6-(2,2,2-trifluoro-etoxi)-3-piridilo | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 189 | 2-fenililo           | 4-etilfenilo                         | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 190 | bencilo              | 4-(2,6-dicloro-piridina)             | hidrógeno                | hidrógeno      | O |
| 191 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                    | aliliotiocarbonilo       | hidrógeno      | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>                   | R <sup>3</sup>                 | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|----------------------------------|--------------------------------|----------------|---|
| 192 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | propargilitio-<br>tiocarbonilo | hidrógeno      | O |
| 193 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo                | fenoxycarbonilo                | hidrógeno      | O |
| 194 | n-butilo             | 3,5-diclorofenilo                | fenoxycarbonilo                | hidrógeno      | O |
| 195 | n-butilo             | 2-metoxifenilo                   | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 196 | 3-cloropropilo       | 3,4-diclorofenilo                | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 197 | n-pentilo            | 3,4-diclorofenilo                | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 198 | etoxycarbonilo       | 3-clorofenilo                    | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 199 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | 4-metoxibencilo                | hidrógeno      | O |
| 200 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | 3,4-dimetoxi-<br>bencilo       | hidrógeno      | O |
| 201 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | ciclobutilmetilo               | hidrógeno      | O |
| 202 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | hidrógeno                      | vinilo         | O |
| 203 | n-butilo             | 3,4-diclorofenilo                | hidrógeno                      | 1-metiletano   | O |
| 204 | 4-clorofenilo        | n-butilo                         | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 205 | 2,2,2-trifluoroetilo | fenetilo                         | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 206 | n-butilo             | 4-(4-carboetoxi-<br>fenil)fenilo | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 207 | n-butilo             | 3-bromo-4-<br>fluorofenilo       | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 208 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-bromo-4-fluoro-<br>fenilo      | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 209 | 2-pentínilo          | 3,4-diclorofenilo                | 2-pentínilo                    | hidrógeno      | O |
| 210 | 2-pentínilo          | 3,4-diclorofenilo                | 2-pentínilo                    | hidrógeno      | O |
| 211 | n-butilo             | 3-bromofenilo                    | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 212 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-bromofenilo                    | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 213 | n-butilo             | 2-benciloxifenilo                | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |
| 214 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo                | etoxycarbonilo                 | metoxi         | O |
| 215 | propargilo           | 3,4-diclorofenilo                | hidrógeno                      | hidrógeno      | O |

5

10

15

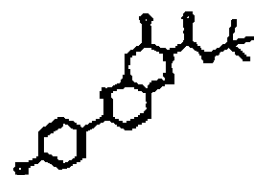
| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>         | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | Z |
|-----|----------------------|------------------------|-------------------|----------------|---|
| 216 | propargilo           | 3,4-diclorofenilo      | propargilo        | hidrógeno      | O |
| 217 | propargilo           | 3-bromo-4-fluorofenilo | propargilo        | hidrógeno      | O |
| 218 | propargilo           | 3-bromo-4-fluorofenilo | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 219 | ciclopropilmetilo    | 3-bromo-4-fluorofenilo | ciclopropilmetilo | hidrógeno      | O |
| 220 | ciclopropilmetilo    | 3-bromo-4-fluorofenilo | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 221 | n-butilo             | 3-fluorofenilo         | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 222 | ciclopropilmetilo    | 3-fluorofenilo         | ciclopropilmetilo | hidrógeno      | O |
| 223 | ciclopropilmetilo    | 3-fluorofenilo         | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 224 | ciclopropilmetilo    | 3-bromofenilo          | ciclopropilmetilo | hidrógeno      | O |
| 225 | propargilo           | 3-fluorofenilo         | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 226 | propargilo           | 3-bromofenilo          | propargilo        | hidrógeno      | O |
| 227 | propargilo           | 3-bromofenilo          | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 293 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-cloro-4-metilfenilo  | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 294 | n-butilo             | 3-cloro-4-metilfenilo  | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 295 | n-butilo             | 3,5-dimetilfenilo      | hidrógeno         | hidrógeno      | O |
| 296 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-dimetilfenilo      | hidrógeno         | hidrógeno      | O |

(a) isómeros cis/trans

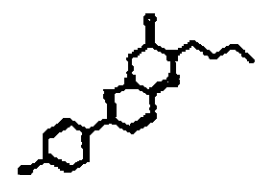
(b) También está presente etoxi

20

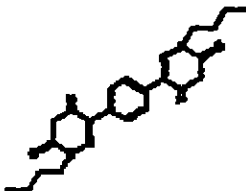
Compuesto 228



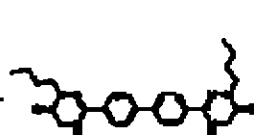
Compuesto 229



Compuesto 230



Compuesto 231



Compuesto 232

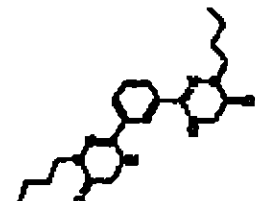
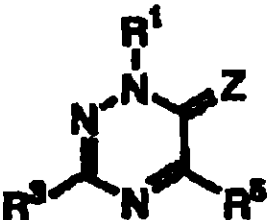


**TABLA 2**

**1,2,4-TRIAZIN-6-ONAS**



| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>3</sup> | R <sup>5</sup> | Z |
|-----|----------------------|----------------|----------------|---|
| 233 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-clorofenilo  | hidrógeno      | O |
| 234 | n-pentilo            | 4-clorofenilo  | hidrógeno      | O |
| 235 | etilo                | 4-clorofenilo  | hidrógeno      | O |
| 236 | alilo                | 4-clorofenilo  | hidrógeno      | O |
| 237 | 2-pentinilo          | 4-clorofenilo  | metilo         | O |

5

10

15

20

25

| No. | R <sup>1</sup>       | R <sup>2</sup>            | R <sup>3</sup> | Z |
|-----|----------------------|---------------------------|----------------|---|
| 238 | metilo               | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 239 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-clorofenilo             | metilo         | O |
| 240 | bencilo              | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 241 | terbutilo            | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 242 | metilo               | fenilo                    | hidrógeno      | O |
| 243 | hidrógeno            | fenilo                    | hidrógeno      | O |
| 244 | n-butilo             | 4-metoxifenilo            | hidrógeno      | O |
| 245 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 246 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-clorofenilo             | hidrógeno      | S |
| 247 | 2,2,2-trifluoroetilo | 4-metilfenilo             | hidrógeno      | O |
| 248 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-diclorofenilo         | hidrógeno      | O |
| 249 | 2,2,2-trifluoroetilo | bencilo                   | hidrógeno      | O |
| 250 | etoxycarbonilmetilo  | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 251 | 2,2,2-trifluoroetilo | ciclohexilo               | hidrógeno      | O |
| 252 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3-metoxifenilo            | hidrógeno      | O |
| 253 | 2,2,2-trifluoroetilo | 3,5-dicloro-4-metilfenilo | hidrógeno      | O |
| 254 | 2-pentilo            | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 255 | 2-butilo             | ciclohexilo               | hidrógeno      | O |
| 256 | ciclohexilo          | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 257 | n-pentilo            | 3,5-dicloro-4-metilfenilo | hidrógeno      | O |
| 258 | n-butilo             | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |
| 259 | n-octilo             | 4-clorofenilo             | hidrógeno      | O |

00185

5

10

15

20

25

| No.              | R <sup>1</sup>            | R <sup>2</sup>                     | R <sup>3</sup> | Z |
|------------------|---------------------------|------------------------------------|----------------|---|
| 260              | n-decilo                  | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 261              | 2-piridilo                | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 262              | n-hexilo                  | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 263              | 2,2,2-trifluoroetilo      | 2-fluorofenilo                     | hidrógeno      | O |
| 264              | cianometilo               | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 265              | trimetilsililmetilo       | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 266              | 2-(5-clorotiofeno)-metilo | 4-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 267              | 2,2,2-trifluoroetilo      | 2-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 268              | n-butilo                  | 5-(2-metil-4-trifluorometiltiazol) | hidrógeno      | O |
| 269              | n-butilo                  | 2,5-diclorofenilo                  | hidrógeno      | O |
| 270              | n-butilo                  | 3,4-diclorofenilo                  | hidrógeno      | O |
| 271              | n-butilo                  | 3,5-diclorofenilo                  | hidrógeno      | O |
| 272              | ciclopropilmetilo         | 3,5-diclorofenilo                  | hidrógeno      | O |
| 273 <sup>a</sup> | n-butilo                  | 4-metilfenilo                      | hidrógeno      | O |
| 274              | 4-clorofenilo             | 4-etoxifenilo                      | hidrógeno      | O |
| 275              | etoxicarbonilmetilo       | 3-metilfenilo                      | hidrógeno      | O |
| 276              | 2-cianoetilo              | 4-(4-nitrofenil)fenilo             | hidrógeno      | O |
| 277              | n-butilo                  | 3-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 278              | 3-metilfenilo             | 3-clorofenilo                      | hidrógeno      | O |
| 279              | 4-clorofenilo             | 4-(4-hexiloxifenoxi)-fenilo        | hidrógeno      | O |
| 280              | n-propilo                 | 4-butiloxifenilo                   | hidrógeno      | O |
| 281              | 2,2,2-trifluoroetilo      | 4-propoxifenilo                    | hidrógeno      | O |

5

10

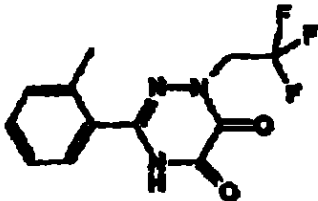
| No. | R <sup>1</sup>      | R <sup>2</sup>                   | R <sup>3</sup> | Z |
|-----|---------------------|----------------------------------|----------------|---|
| 282 | metilo              | 4-fenoxifenilo                   | hidrógeno      | O |
| 283 | n-butilo            | 2-metoxifenilo                   | hidrógeno      | O |
| 284 | n-butilo            | metilo                           | 4-metilfenilo  | O |
| 285 | n-butilo            | metilo                           | 3-metilfenilo  | O |
| 286 | n-butilo            | metilo                           | 4-metoxifenilo | O |
| 287 | n-butilo            | 2-hidroxifenilo                  | hidrógeno      | O |
| 288 | n-butilo            | 3,5-bistrifluoro-<br>metilfenilo | hidrógeno      | O |
| 289 | n-butilo            | 3-bromo-4-fluoro-<br>fenilo      | hidrógeno      | O |
| 290 | 2,2,2-trifluoroetil | 3-bromo-4-fluoro-<br>fenilo      | hidrógeno      | O |

\* Se preparó el compuesto 273 y se probó como una mezcla 1:1 con su forma no oxidada (dihidro).

15

Se obtuvo la dicetona, compuesto 291, como un producto lateral a partir de un intento de preparación de 6-(2-metilfenil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)-4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-ona.

20



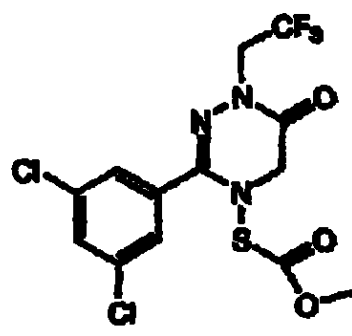
Compuesto 291

También se preparó el compuesto 292 mediante el método G que fue descrito previamente.

25

186  
60260

5



Compuesto 292

TABLA 3

CARACTERIZACIÓN ESPECTRAL PARA LOS COMPUESTOS 1-292

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS        | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                     |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1   |                | (DMSO-d6): 4.01 (s, 2H), 4.47 (c, 2H), 7.54 (t, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.84 (s amplia, 1H), 7.93 (d, 1H).                                                      |
| 2   |                | (CDCl3): 0.95 (t, 3H), 1.37 (sexteta, 2H), 1.69 (penteta, 2H), 3.73 (t, 2H), 4.04 (d, 2H), 5.09 (s amplia, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.50 (d, 1H). |
| 3   | 98%, 324 (M+H) |                                                                                                                                                            |
| 4   |                | (CDCl3): 4.15 (d, 2H), 4.39 (c, 2H), 5.0 (s amplia, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.60 (d, 2H)                                                                        |
| 5   |                | (DMSO-d6): 3.87 (s, 2H), 7.53 (d, 2H), 7.66 (d, 2H), 10.50 (s, 1H).                                                                                        |
| 6   |                | (CDCl3): 1.58 (s, 9H), 3.97 (d, 2H), 4.9 (s amplia, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.60 (d, 2H).                                                                       |
| 7   |                | (CDCl3): 4.77 (c, 2H), 7.48 (m, 3H), 8.14 (m, 2H), 8.56 (s, 1H).                                                                                           |
| 8   |                | (CDCl3): 1.14 (t, 3H), 2.22 (c doble, 2H), 4.89 (t, 2H), 7.45 (d, 2H), 8.13 (d, 2H), 8.13 (d, 2H), 8.48 (s, 1H)                                            |
| 9   |                | (CDCl3): 0.30 (m, 2H), 0.44 (m, 2H), 1.18 (m, 1H), 3.55 (d, 2H), 3.98 (d, 2H), 5.60 (s amplia, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.47 (dd, 1H), 7.73 (d, 1H).             |
| 10  |                | (CDCl3): 4.48 (s, 2H), 4.48 (c, 2H), 4.55 (d, 2H), 5.12 (d, 1H), 5.20 (d, 1H), 5.65 (m, 1H), 7.43 (m, 3H).                                                 |
| 11  |                | (CDCl3): 1.23 (s, 9H), 1.63 (s, 9H), 4.38 (s, 2H), 7.50 (m, 3H).                                                                                           |
| 12  |                | (CDCl3): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 3.86 (t, 2H), 4.94 (s, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.73 (d, 1H).                    |
| 13  |                | (CDCl3): 0.95 (t, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 3.78 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 5.63 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.56 (m, 6H), 7.82 (d, 2H).                    |
| 14  |                | (CDCl3): 3.88 (s, 3H), 4.35 (s, 2H), 4.45 (c amplia, 2H), 7.45 (m, 3H).                                                                                    |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHz)                                                                                                                                                                                    |
|-----|---------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 15  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.39 (s, 2H), 5.84 (s, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.47 (d, 2H).                                                                     |
| 16  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 3.83 (t, 2H), 4.37 (s, 2H), 5.84 (s, 2H), 7.44 (m, 3H).                                                                                   |
| 17  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.42 (m, 2H), 1.86 (m, 2H), 4.31 (t, 2H), 4.46 (d, 2H), 5.00 (s amplia, 1H), 7.52 (s, 2H), 7.80 (s, 1H).                                                              |
| 18  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.45 (s, 3H), 4.39 (m, 1H), 4.57 (m, 1H), 5.10 (d, 1H), 6.56 (amplia, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.61 (d, 2H).                                                                              |
| 19  |         | (acetona-d <sub>6</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.6 (sexteta, 2H), 2.75 (dt, 2H), 4.3-4.8 (m, 2H), 5.3 (s, 1H), 7.55 (d, 2H), 7.85 (2H).                                                                         |
| 20  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.27 (s, 3H), 2.85 (dd, 1H), 3.35 (dd, 1H), 4.2-4.6 (m, 3H), 5.95 (s amplia, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.57 (d, 2H), 8.48 (s, 1H).                                                         |
| 21  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.82 (c, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.97 (d, 2H), NH sin resolver                                                                                                                           |
| 23  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.88 (m, 3H), 1.32 (m, 4H), 1.68 (m, 2H), 3.72 (t amplia, 2H), 4.63 (s, 2H), 6.87 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.63 (d, 2H).                                                |
| 24  |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 4.03 (s, 2H), 4.44 (s, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 10.63 (s amplia, 1H).                                                                                                     |
| 25  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.82 (t, 3H), 1.21 (m, 2H), 1.39 (m, 2H), 4.04 (t, 2H), 4.31 (s, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.60 (dt, 1H), 7.95 (dd, 1H).                                                     |
| 26  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.47 (s, 3H), 4.45 (dc, 2H), 4.55 (dc, 1H), 5.05 (d, 1H), 6.10 (s amplia, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.64 (d, 2H).                                                                          |
| 27  |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 3.22 (s, 3H), 3.89 (s, 2H), 7.51 (d, 2H), 7.8 (s, 1H), 7.75 (d, 2H).                                                                                                              |
| 28  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.25 (d, 2H), 5.10 (s amplia, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.41 (m, 4H), 7.66 (m, 4H).                                                                                                        |
| 29  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 7.6 (m, 3H), 7.54 (t, 2H), 7.83 (d, 2H), 8.15 (d, 2H), 8.60 (s, 1H).                                                                                                                |
| 30  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.12 (d, 2H), 4.95 (s, 3H), 7.3-7.5 (m, 7H), 7.56 (d, 2H).                                                                                                                          |
| 31  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.40 (s, 3H), 4.11 (d, 2H), 5.05 (s amplia, 1H), 7.43 (m, 3H), 7.64 (m, 2H).                                                                                                        |
| 32  |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 3.84 (d, 2H), 7.43 (m, 3H), 7.71 (m, 2H), 10.41 (s amplia, 1H).                                                                                                                   |
| 33  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.15 (d, 2H), 4.41 (c, 2H), 5.1 (s amplia, 1H), 7.47 (m, 3H), 7.85 (m, 2H).                                                                                                         |
| 34  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.88 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 4.38 (c, 2H), 7.44 (s, 5H).                                                                                                                             |
| 35  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.85 (s, 3H), 4.12 (d, 2H), 4.41 (c, 2H), 5.0 (s amplia, 1H), 6.94 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).                                                                                           |
| 36  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 2H), 1.37 (sexteta, 2H), 1.70 (penteta, 2H), 3.76 (t, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.05 (d, 2H), 4.95 (s amplia, 1H), 6.93 (d, 2H), 7.59 (d, 2H).                                    |
| 37  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.15 (s, 2H), 4.42 (c, 2H), 5.12 (s amplia, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.66 (dd, 1H).                                                          |
| 38  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 2H), 1.35 (sexteta, 2H), 1.45 (d, 3H), 1.70 (penteta, 2H), 3.75 (t, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.05 (d, 2H), 4.10 (c amplia, 1H), 5.00 (s amplia, 1H), 6.93 (d, 2H), 7.60 (d, 2H). |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                          |
|-----|---------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 39  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.88 (s, 3H), 4.75 (c, 2H), 6.98 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.53 (s, 1H).                                                                                     |
| 40  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.84 (s, 3H), 4.48 (c, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.58 (d, 2H).                                                                                                   |
| 41  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.39 (s, 3H), 4.13 (d, 2H), 4.41 (c, 2H), 5.05 (s amplia, 1H), 7.22 (d, 2H), 7.54 (d, 2H).                                                                |
| 42  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.93 (s, 3H), 4.39 (d, 2H), 4.53 (c, 2H), 7.42 (d, 2H), 7.74 (d, 2H).                                                                                     |
| 43  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.15 (d, 2H), 4.40 (c, 2H), 5.05 (s amplia, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.54 (d, 2H).                                                                              |
| 44  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.54 (s, 2H), 3.89 (d, 2H), 4.32 (c, 2H), 4.40 (s amplia, 1H), 7.25-7.35 (m, 5H).                                                                         |
| 45  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.1-1.4 (m, 5H), 1.6-1.9 (m, 5H), 2.1 (m, 1H), 3.97 (d, 2H), 4.28 (c, 2H), 4.5 (s amplia, 1H).                                                            |
| 46  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.84 (s, 3H), 4.12 (d, 2H), 4.41 (c, 2H), 5.15 (s amplia, 1H), 7.01 (ddd, 1H), 7.18 (m, 2H), 7.35 (t, 1H).                                                |
| 47  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.50 (s, 3H), 4.14 (d, 2H), 4.40 (c, 2H), 5.0 (s amplia, 1H), 7.57 (s, 2H).                                                                               |
| 48  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 2H), 1.1-1.4 (m, 6H), 1.55-1.9 (m, 7H), 2.15 (m, 1H), 3.65 (t, 2H), 3.89 (s, 2H), 4.45 (s amplia, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.43 (s, 1H). |
| 49  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 2H), 1.35 (m, 4H), 1.72 (penteta, 2H), 2.49 (s, 3H), 3.76 (t, 2H), 4.06 (d, 2H), 5.05 (s amplia, 1H), 7.58 (s, 1H).                              |
| 50  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (sexteta, 2H), 1.72 (penteta, 2H), 3.78 (t, 2H), 4.07 (d, 2H), 4.95 (s amplia, 1H), 7.41 (d, 2H), 4.59 (d, 2H).                        |
| 51  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.19 (d, 2H), 4.42, c, 2H), 5.10 (s amplia, 1H), 7.70 (d, 2H), 7.9 (d, 2H).                                                                               |
| 52  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.18 (d, 2H), 4.43 (c, 2H), 6.80 (s amplia, 1H), 7.36 (m, 1H), 7.76 (dt, 1H), 8.08 (d, 1H), 8.53 (m, 1H).                                                 |
| 53  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.3-4.7 (m, 2H), 5.20 (d, 1H), 5.6 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.8 (s amplia, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.55 (d, 1H).                                   |
| 54  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 3H), 1.35 (m, 4H), 1.73 (m, 2H), 3.76 (t, 2H), 4.07 (s, 2H), 5.00 (s amplia, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.56 (d, 2H).                                    |
| 55  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.89 (t, 2H), 1.32 (m, 4H), 1.73 (penteta, 2H), 1.86 (m, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 5.15 (s amplia, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.60 (d, 2H).                |
| 56  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.87 (t, 2H), 1.2-1.45 (m, 8H), 1.5-1.9 (m, 4H), 3.76 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 4.95 (s amplia, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.60 (d, 2H).                             |
| 57  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.87 (t, 2H), 1.2-1.45 (m, 12H), 1.6-1.9 (m, 4H), 3.76 (t, 2H), 4.06 (s, 2H), 5.15 (s amplia, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.61 (d, 2H).                            |
| 58  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.39 (s, 3H), 4.23 (d, 2H), 5.10 (s amplia, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.41 (m, 4H), 7.65 (d, 2H).                                                  |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                                                                                 |
|-----|---------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 59  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.23 (d, 2H), 5.45 (s amplia, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.36 (d, 2H), 7.57 (d, 1H), 7.65 (d, 2H), 7.79 (m, 1H), 8.58 (m, 1H).                                                                                           |
| 60  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.16 (d, 2H), 4.70 (s, 2H), 5.10 (s amplia, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.62 (d, 2H).                                                                                                                                     |
| 61  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.14 (s, 9H), 3.39 (s, 2H), 4.08 (s, 2H), 5.16 (s amplia, 1H), 7.39 (dt, 2H), 7.60 (dt, 2H).                                                                                                                     |
| 62  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.09 (d, 2H), 4.98 (s, 2H + NH), 6.76 (d, 1H), 6.89 (d, 1H), 7.41 (dt, 2H), 7.61 (dt, 2H).                                                                                                                       |
| 63  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.93 (s, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 6.61 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.45 (d, 2H), 7.50 (d, 2H).                                                                                    |
| 64  |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 3.89 (s, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.75 (s, 2H), 10.58 (s, 1H).                                                                                                                                         |
| 65  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.15 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 5.01 (s amplia, 1H), 5.40 (s, 2H), 7.44 (m, 1H), 7.65 (m, 2H).                                                                                                                       |
| 66  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.66-3.95 (m, 4H), 4.32 (d, 1H), 4.57 (dd, 1H), 5.69-6.31 (m, 4H), 7.41 (s, 4H).                                                                                                                                 |
| 67  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.09 (s, 2H), 4.36 (d, 1H), 4.61 (d, 1H), 5.12 (s amplia, 1H), 5.98 (dt, 1H, isómero cis), 6.09 (dt, 1H, isómero trans), 6.23 (dd, 1H, isómero cis), 6.31 (dd, 1H, isómero trans), 7.39 (dd, 2H), 7.60 (dd, 2H). |
| 68  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.35 (sexteta, 2H), 1.65 (penteta, 2H), 2.72 (s, 3H), 3.72 (t, 2H), 4.05 (d, 2H), 4.95 (bs, 1H).                                                                                                   |
| 69  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.39 (sexteta, 2H), 1.71 (penteta, 2H), 3.76 (t, 2H), 4.07 (d, 2H), 5.17 (s amplia, 1H), 7.21 (c, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.58 (dt, 1H).                                                                |
| 70  |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 4.01 (s, 2H), 4.41 (c, 2H), 7.59 (s, 2H), 7.76 (s, 1H), NH sin resolver.                                                                                                                                       |
| 71  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.78 (s, 3H), 3.85 (s, 2H), 4.07 (s, 2H), 4.38 (c, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.46 (t, 2H).                                                                                                                              |
| 72  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.92 (s, 3H), 4.48 (c, 2H), 4.50 (s, 2H), 7.51 (m, 3H).                                                                                                                                                          |
| 73  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.12 (s, 2H), 4.38 (c, 2H), 5.07 (s amplia, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.51 (d, 1H).                                                                                                                      |
| 74  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (sexteta, 2H), 1.69 (penteta, 2H), 3.74 (t, 2H), 4.04 (s, 2H), 5.09 (s amplia, 1H), 7.36 (s, 2H), 7.55 (s, 1H).                                                                               |
| 75  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 3H), 1.32 (m, 2H), 1.67 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 4.85 (s amplia, 0.5 H), 4.94 (s, 1H), 7.17 (d, 2H), 7.23 (d, 2H).                                                            |
| 76  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.92 (t, 3H), 1.35 (dt, 2H), 1.69 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 4.76 (s amplia, 0.7 H), 5.26 (s, 1H), 7.21 (m, 4H).                                                                                       |
| 77  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 3H), 1.35 (dt, 2H), 1.66 (m, 2H), 2.02 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 3.66 (t, 2H), 4.87 (s amplia, 0.6 H), 4.91 (s, 1H), 7.14 (m, 1H), 7.15 (s, 2H), 7.27 (m, 1H).                                             |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                                  |
|-----|---------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 95  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.89 (t, 3H), 1.38 (s, 9H), 1.41 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.98 (s, 3H), 3.66 (t, 2H), 4.85 (s amplia, 0.5 H), 4.94 (s, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.38 (d, 2H).             |
| 96  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.14 (s, 2H), 4.41 (c, 2H), 5.56 (d amplia, 1H), 7.13 (dd, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.44 (dddd, 1H), 7.86 (td, 1H).                                                     |
| 97  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.14 (s, 2H), 4.40 (c, 2H), 5.04 (s amplia, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.57 (d, 1H).                                                                                      |
| 98  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.15 (d, 2H), 4.40 (c, 2H), 5.02 (bs, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.56 (m, 1H).                                                                              |
| 99  |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.16 (d, 2H), 4.40 (c, 2H), 5.03 (s amplia, 1H), 7.50 (s, 2H), 7.76 (m, 1H).                                                                                      |
| 100 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.29 (t, 3H), 3.83 (c, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.94 (s amplia, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.78 (s, 1H).                                                                        |
| 101 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.37 (sexteta, 2H), 1.71 (penteta, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.07 (s, 2H), 5.24 (s amplia, 1H), 7.50 (s, 2H), 7.79 (d, 1H).                                |
| 102 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.31 (t, 3H), 4.15 (d, 2H), 4.25 (c, 2H), 4.52 (s, 2H), 5.17 (s amplia, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.74 (m, 1H).                                                          |
| 103 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.11 (d, 2H), 4.94 (s, 2H), 4.96 (s amplia, 1H), 7.33 (m, 3H), 7.45 (m, 4H), 7.72 (d, 1H).                                                                        |
| 104 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (sexteta, 2H), 1.71 (penteta, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 5.00 (s amplia, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.55 (d, 2H).                                |
| 105 |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 2.40 (s, 3H), 4.40 (m, 1H), 4.71 (m, 1H), 5.54 (s amplia, 1H), 7.28 (m, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.48 (d, 1H), 8.88 (s amplia, 1H), 12.10 (s, 1H).                    |
| 106 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.40 (sexteta, 2H), 1.71 (penteta, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 4.99 (s amplia, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.75 (dd, 1H).                 |
| 107 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.75 (sexteta, 2H), 3.73 (t, 2H), 4.07 (d, 2H), 5.45 (s amplia, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.58 (d, 2H).                                                    |
| 108 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.20 (t, 3H), 3.56 (c, 2H), 3.75 (t, 2H), 3.99 (t, 2H), 4.10 (s, 2H), 5.01 (s amplia, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.54 (d, 2H).                                            |
| 109 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.37 (m, 2H), 0.52 (m, 2H), 1.26 (m, 1H), 3.63 (d, 2H), 4.08 (d, 2H), 5.59 (s amplia, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.59 (d, 2H).                                            |
| 110 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (sexteta, 2H), 1.72 (penteta, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.07 (d, 2H), 5.14 (s amplia, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.42 (dt, 1H), 7.53 (dt, 1H), 7.68 (t, 1H). |
| 111 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.21 (d, 2H), 5.25 (s amplia, 1H), 7.37 (m, 5H), 7.57 (dd, 1H), 7.64 (dd, 2H), 7.72 (t, 1H).                                                                      |
| 112 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.40 (s, 3H), 4.23 (d, 2H), 5.18 (s amplia, 1H), 7.11 (d, 1H), 7.36 (m, 5H), 7.58 (dt, 1H), 7.71 (t, 1H).                                                         |
| 113 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.48 (c, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.56 (d amplia, 2H), 7.02 (dd, 1H), 7.45 (m, 3H).                                                                                     |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS           | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                           |
|-----|-------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 114 | 91%, 262 (M+H)    |                                                                                                                                                                                  |
| 115 | 86%, 300 (M+H)    |                                                                                                                                                                                  |
| 116 | 71%, 298 (M+H)    |                                                                                                                                                                                  |
| 117 | 91%, 322 (M + Na) |                                                                                                                                                                                  |
| 118 |                   |                                                                                                                                                                                  |
| 119 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.42 (m, 2H), 1.77 (m, 2H), 3.83 (t, 2H), 4.11 (s, 2H), 5.20 (bs, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.85 (m, 4H), 8.04 (s, 1H).                             |
| 120 | 80%, 440 (M+Na)   |                                                                                                                                                                                  |
| 121 | 79%, 323 (M+Na)   |                                                                                                                                                                                  |
| 122 | 89%, 257 (GC/MS)  |                                                                                                                                                                                  |
| 123 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.48 (s amplia, 3H), 4.51 (c, 2H), 4.55 (s, 2H), 7.45 (d, 2H), 7.49 (t, 1H).                                                                               |
| 124 | 93%, 248 (M+Na)   |                                                                                                                                                                                  |
| 125 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.31 (t, 3H), 4.11 (s, 2H), 4.24 (c, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.50 (bs, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.45 (m, 1H).                                           |
| 126 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.51 (t, 2H), 3.55 (t, 2H), 4.06 (s, 2H), 4.39 (c, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.48 (s, 1H).                                                                        |
| 127 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.55 (d amplia, 2H), 7.04 (dd, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.46 (d, 2H).                      |
| 128 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.11 (d, 2H), 4.39 (d, 2H), 5.06 (s amplia, 1H), 5.23 (dd, 1H), 5.29 (dd, 1H), 5.95 (m, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.55 (d, 2H).                                   |
| 129 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 3.84 (t, 2H), 4.42 (s, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.48 (d, 2H).                                            |
| 130 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.83 (t, 2H), 4.35 (s, 2H), 7.41 (t, 1H), 7.44 (d, 2H).                                            |
| 131 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 2.45 (t, 1H), 3.74 (t, 2H), 3.82 (d, 2H), 4.02 (s, 2H), 7.47 (m, 3H).                                            |
| 132 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.89 (t, 3H), 1.29 (m, 2H), 1.63 (m, 2H), 3.75 (t, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.47 (d, 2H), 5.05 (d, 1H), 5.12 (dd, 1H), 5.59 (m, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.37 (d, 2H). |
| 133 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 2.53 (t, 1H), 3.83 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.65 (d, 2H), 7.41 (t, 1H), 7.46 (d, 2H).                              |
| 134 |                   | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.78 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.49 (c, 2H), 4.63 (d, 1H), 4.65 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.48 (d, 2H).                                                          |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS         | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                     |
|-----|-----------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 135 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.78 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.49 (c, 2H), 4.63 (d, 1H), 4.65 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.48 (d, 2H).                                                    |
| 136 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.54 (d amplia, 2H), 7.03 (dd, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.71 (d, 1H). |
| 137 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.50 (c, 2H), 4.54 (s, 2H), 5.65 (dd, 1H), 5.85 (dd, 1H), 6.38 (dd, 1H), 7.47 (m, 3H).                                                               |
| 138 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.46 (s, 2H), 5.63 (dd, 1H), 5.87 (dd, 1H), 6.38 (dd, 1H), 7.44 (m, 1H), 7.48 (m, 2H).       |
| 139 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.04 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 5.30 (bs, 1H), 7.10-7.60 (m, 8H).                                                                                        |
| 140 |                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.29 (t, 3H), 4.09 (s, 2H), 4.22 (c, 2H), 4.50 (s, 2H), 5.50 (bs, 1H), 6.47 (bs, 1H), 6.80 (bs, 1H), 7.45 (s, 1H).                                   |
| 141 | 93%, 309 (M+H)  |                                                                                                                                                                            |
| 142 | 100%, 379 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 143 | 100%, 308 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 144 | 100%, 342 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 145 | 100%, 316 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 146 | 100%, 334 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 147 | 100%, 304 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 148 | 100%, 236 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 149 | 100%, 276 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 150 | 100%, 286 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 151 | 89%, 290 (M+H)  |                                                                                                                                                                            |
| 152 | 100%, 248 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 153 | 100%, 326 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 154 | 100%, 272 (M+H) |                                                                                                                                                                            |
| 155 | 100%, 330 (M+H) |                                                                                                                                                                            |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS            | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                                         |
|-----|--------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 156 | 98%, 282<br>(M+H)  |                                                                                                                                                                                                |
| 157 | 100%, 317<br>(M+H) |                                                                                                                                                                                                |
| 158 | 86%, 444<br>(M+H)  |                                                                                                                                                                                                |
| 159 | 100%, 327<br>(M+H) |                                                                                                                                                                                                |
| 160 | 93%, 301<br>(M+H)  |                                                                                                                                                                                                |
| 161 | 100%, 330<br>(M+H) |                                                                                                                                                                                                |
| 162 |                    | (DMSO-d6): 0.97 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 3.70 (t, 2H), 3.99 (s, 2H), 7.45 (m, 1H y NH), 7.97 (m, 4H).                                                                              |
| 163 |                    | (DMSO-d6): 4.10 (s, 2H), 4.52 (c, 2H), 7.46 (m, 1H y NH), 7.98 (m, 4H).                                                                                                                        |
| 164 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.76 (m, 2H), 3.74 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.92 (s amplia, 1H), 7.49 (s, 2H), 7.77 (s, 1H).                                                                 |
| 165 | 83%, 276<br>(M+H)  |                                                                                                                                                                                                |
| 166 | 85%, 350<br>(M+H)  |                                                                                                                                                                                                |
| 167 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.22 (s, 2H), 4.43 (c, 2H), 5.25 (bs, 1H), 7.64 (dxd, 1H), 8.06 (d, 1H), 8.32 (d, 1H), 8.49 (s, 1H).                                                                     |
| 168 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 2.44 (t, 1H), 3.74 (t, 2H), 3.83 (d, 2H), 4.02 (s, 2H), 7.43 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.68 (d, 1H).                             |
| 169 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.49 (t, 1H), 3.86 (d, 2H), 4.09 (s, 2H), 4.37 (q, 2H), 7.49 (m, 3H).                                                                                                    |
| 170 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.38 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 1.78 (s, 3H), 3.84 (t, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.63 (d, 2H), 7.44 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.70 (d, 1H).                             |
| 171 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 2.48 (t, 1H), 3.83 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.64 (d, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.67 (d, 1H).                             |
| 172 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 3.83 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 4.54 (d, 2H), 5.11 (d, 1H), 5.18 (d, 1H), 5.67 (m, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.66 (d, 1H). |
| 173 |                    | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.98 (t, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 3.88 (t, 2H), 4.46 (s, 2H), 6.90 (d, 2H), 7.19 (dd, 1H), 7.31 (dd, 2H), 7.50 (s, 2H), 7.79 (s, 1H).                            |
| 174 |                    | (DMSO-d6): 3.85 (d, 2H), 7.50 (s amplia, 1H), 7.70 (d, 2H), 7.94 (t, 1H), 10.51 (s amplia)                                                                                                     |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS        | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                             |
|-----|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 175 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 3.79 (t, 2H), 4.11 (d, 2H), 5.02 (s amplia, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.74 (dt, 1H), 7.89 (dt, 1H), 8.00 (t, 1H).         |
| 176 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.83 (s, 2H), 4.27 (d, 2H), 6.72 (s amplia, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.12 (t, 1H).                                                     |
| 177 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.70 (dd, 3H), 1.71 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 4.42 (s, 2H), 5.60 (d, 1H), 6.94 (dq, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.73 (d, 1H). |
| 178 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.98 (t, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.76 (m, 2H), 3.90 (t, 2H), 4.89 (s, 2H), 6.77 (d, 2H), 7.23 (d, 1H), 7.32 (t, 2H), 7.52 (s, 2H), 7.79 (s, 1H).                  |
| 179 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 3.47 (t amplia, 2H), 3.83 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 4.37 (s, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.69 (d, 1H).          |
| 180 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.17 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 2.24 (qt, 2H), 3.73 (t, 2H), 3.78 (t, 2H), 4.00 (s, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.72 (d, 1H).  |
| 181 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.69 (m, 2H), 0.96 (m, 1H), 0.97 (t, 3H), 1.06 (m, 2H), 1.39 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 3.86 (t, 2H), 4.42 (s, 2H), 7.51 (m, 2H), 7.79 (d, 1H).                  |
| 182 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.67 (m, 2H), 3.73 (t, 2H), 3.88 (s, 2H), 4.28 (s, 2H), 7.12 (d, 2H), 7.35 (m, 4H), 7.49 (d, 1H), 7.65 (d, 1H).                  |
| 183 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.94 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 1.87 (t, 3H), 3.73 (t, 2H), 3.76 (q, 2H), 4.01 (s, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.70 (d, 1H).                 |
| 184 | 91%, 311 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 185 | 85%, 267 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 186 | 90%, 342 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 187 | 90%, 312 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 188 | 90%, 365 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 189 | 92%, 308 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 190 | 90%, 335 (M+H) |                                                                                                                                                                                    |
| 191 |                | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 3.86 (t, 2H), 4.92 (s, 2H), 5.16 (d, 1H), 5.23 (dd, 1H), 5.72 (m, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.70 (d, 1H).  |

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                                                                              |
|-----|---------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 192 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 2.21 (t, 1H), 3.87 (t, 2H), 3.94 (d, 2H), 4.93 (s, 2H), 7.40 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.71 (d, 1H).                                                  |
| 193 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.45 (s, 3H), 4.39 (m, 1H), 4.57 (m, 1H), 5.10 (d, 1H), 6.56 (amplia, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.61 (d, 2H).                                                                                        |
| 194 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 3.88 (t, 2H), 4.47 (s, 2H), 6.90 (d, 2H), 7.22 (dd, 1H), 7.33 (dd, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.56 (d, 2H).                                                 |
| 195 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 3.77 (t, 2H), 3.91 (s, 3H), 4.02 (d, 2H), 6.21 (s amplia, 1H), 6.96 (d, 1H), 7.03 (dt, 1H), 7.39 (ddd, 1H), 7.89 (dd, 1H).                          |
| 196 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.22 (quinteta, 2H), 3.62 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 4.09 (d, 2H), 5.03 (s amplia, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.77 (t, 1H).                                                                               |
| 197 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 3H), 1.36 (m, 4H), 1.73 (m, 2H), 3.75 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.94 (s amplia, 1H), 7.49 (s, 2H), 7.77 (s, 1H)..                                                                       |
| 198 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.31 (t, 3H), 4.16 (s, 2H), 4.24 (q, 2H), 6.90 (1H, s amplia), 7.29-7.49 (m, 4H).                                                                                                             |
| 199 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.94 (t, 3H), 1.34 (m, 2H), 1.65 (m, 2H), 3.71 (t, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.85 (s, 2H).                                                                                                           |
| 200 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.67 (m, 2H), 3.76 (m, 2H), 3.77 (s, 6H), 3.89 (s, 2H), 4.20 (s, 2H), 6.25 (d, 2H), 6.38 (t, 1H), 7.37 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.63 (d, 1H).                      |
| 201 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 3H), 1.36 (m, 2H), 1.54 (m, 2H), 1.67 (m, 3H), 1.86 (m, 1H), 1.97 (m, 2H), 2.53 (m, 1H), 3.09 (d, 2H), 3.73 (t, 2H), 3.89 (s, 2H), 7.31 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.57 (d, 1H).        |
| 202 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 3H), 1.34 (dt, 2H), 1.67 (quinteta, 2H), 3.74 (t, 1H), 4.58 (m, 1H), 5.29 (d, 1H), 5.34 (m, 1H), 5.86 (s, 1H), 5.97 (m, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.86 (d, 1H).              |
| 203 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.92 (t, 3H), 1.34 (m, 2H), 1.70 (quinteta, 2H), 1.79 (s, 3H), 3.70 (m, 1H), 3.77 (m, 1H), 4.50 (d, 1H), 4.97 (s, 2H), 5.74 (s, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.82 (d, 1H). |
| 204 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 3H), 1.37 (dt, 2H), 1.58 (quinteta, 2H), 2.21 (t, 2H), 4.00 (s, 2H), 4.95 (s amplia, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.56 (d, 2H).                                                                |
| 205 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.49 (t, 2H), 2.92 (t, 2H), 3.85 (s, 2H), 4.24 (m, 3H), 7.26 (m, 5H).                                                                                                                         |
| 206 |         | (Metanol-d <sub>4</sub> ): 1.00 (t, 2H), 1.43 (t, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.75 (quinteta, 2H), 3.79 (t, 2H), 4.03 (s, 2H), 4.41 (q, 2H), 7.183 (m, 6H), 8.13 (d, 2H).                                                    |
| 207 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.38 (dt, 2H), 1.68 (quinteta, 2H), 3.77 (t, 2H), 4.06 (s, 2H), 5.12 (s, amplia, 1H), 7.16 (t, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.89 (dd, 1H).                                                |
| 208 |         | (Metanol-d <sub>4</sub> ): 4.22 (s, 2H), 4.59 (q, 2H), 7.45 (t, 1H), 7.90 (m, 1H), 8.16 (dd, 1H).                                                                                                                   |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ) <sup>1</sup>                                                                                                                                                               |
|-----|---------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 209 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.13 (t, 3H), 1.18 (t, 3H), 2.22 (m, 4H), 3.80 (t, 2H), 4.04 (s, 2H), 4.50 (t, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.75 (d, 1H).                                              |
| 210 |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 1.04 (t, 3H), 2.18 (q, 2H), 3.94 (s amplia, 2H), 4.40 (s, 2H), 7.74 (s, 2H), 7.98 (s, 1H), NH sin resolver.                                                               |
| 211 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 3H), 1.34 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 3.73 (t, 2H), 4.01 (d, 2H), 6.02 (s amplia, 1H), 7.26 (t, 1H), 7.53 (dt, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.85 (t, 1H).                         |
| 212 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.08 (d, 2H), 4.38 (q, 2H), 5.62 (s amplia, 1H), 7.28 (t, 1H), 7.58 (dd, 2H), 7.80 (t, 1H).                                                                                 |
| 213 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.94 (t, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.70 (m, 2H), 3.75 (t, 2H), 3.82 (d, 2H), 5.12 (s, 2H), 6.17 (s amplia, 1H), 7.03 (dt, 2H), 7.36 (m, 6H), 7.87 (dd, 1H).                        |
| 214 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.06 (t, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.2 (m, 3H), 4.77 (dq, 1H), 5.74 (s, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.45 (t, 1H).                                                                           |
| 215 |         | (Acetona-d <sub>6</sub> ): 2.76 (t, 1H), 3.10 (t, 1H), 4.11 (d, 2H), 4.11 (s, 2H), 4.52 (d, 2H), 7.68 (dd, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.86 (d, 1H).                                                       |
| 216 |         | (Acetona-d <sub>6</sub> ): 2.79 (t, 1H), 4.10 (s, 2H), 5.68 (d, 2H), 7.09 (s amplia, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.84 (dd, 1H), 8.06 (d, 1H).                                                              |
| 217 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.28 (t, 1H), 2.48 (t, 1H), 3.85 (d, 2H), 4.07 (s, 2H), 4.53 (d, 2H), 7.24 (t, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.84 (dd, 1H).                                                            |
| 218 |         | (Acetona-d <sub>6</sub> ): 3.15 (t, 1H), 4.21 (s, 2H), 4.68 (d, 2H), 7.16 (s, amplia, 1H), 7.55 (t, 1H), 8.04 (m, 1H), 8.26 (dd, 1H).                                                             |
| 219 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): -0.01 (m, 2H), 0.27 (m, 2H), 0.41 (m, 2H), 0.45 (m, 2H), 0.79 (m, 1H), 1.17 (m, 1H), 2.85 (d, 2H), 3.53 (d, 2H), 3.98 (s, 2H), 7.09 (t, 1H), 7.35 (m, 1H), 7.62 (dd, 1H).   |
| 220 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.35 (m, 2H), 0.50 (m, 2H), 1.23 (m, 1H), 3.57 (d, 2H), 4.00 (s, 2H), 6.19 (s, 1H), 7.10 (t, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.93 (m, 1H).                                               |
| 221 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 3H), 1.33 (m, 2H), 1.68 (m, 2H), 3.72 (t, 2H), 3.98 (s, 2H), 6.48 (s, 1H), 7.11 (dt, 1H), 7.35 (dd, 1H), 7.49 (t, 2H).                                             |
| 222 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.08 (m, 2H), 0.38 (m, 2H), 0.52 (m, 4H), 0.88 (m, 1H), 1.26 (m, 1H), 2.95 (d, 2H), 3.63 (d, 2H), 4.08 (s, 2H), 7.20 (m, 3H), 7.40 (m, 1H).                                 |
| 223 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.37 (m, 2H), 0.51 (m, 2H), 1.26 (m, 1H), 3.63 (d, 2H), 4.05 (d, 2H), 5.68 (s amplia, 1H), 7.13 (ddt, 1H), 7.38 (dd, 1H), 7.45 (m, 2H).                                     |
| 224 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.08 (m, 2H), 0.37 (m, 2H), 0.53 (m, 4H), 0.87 (m, 1H), 1.26 (m, 1H), 2.93 (d, 2H), 3.62 (d, 2H), 4.08 (d, 2H), 7.31 (dd, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H). |
| 225 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.28 (t, 1H), 4.12 (s, 2H), 4.57 (d, 2H), 5.20 (s amplia, 1H), 7.16 (ddt, 1H), 7.42 (m, 3H).                                                                                |

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                                          |
|-----|---------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 226 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.27 (t, 1H), 2.47 (t, 1H), 3.84 (d, 2H), 4.08 (s, 2H), 4.53 (d, 2H), 7.31 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H).           |
| 227 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.28 (t, 1H), 4.12 (s, 2H), 4.57 (d, 2H), 5.14 (s amplia, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.59 (ddd, 2H), 7.85 (d, 1H).                                |
| 228 |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 1.50 (s, 9H), 4.75 (s, 2H), 7.09 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.87 (d, 2H).                                                     |
| 229 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t amplia, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.69 (m, 2H), 3.76 (amplia, 2H), 4.65 (s, 2H), 6.90 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.66 (d, 2H). |
| 230 |         | (Acetona-d <sub>6</sub> ): 1.03 (t, 6H), 1.40 (m, 4H), 1.70 (m, 4H), 3.74 (t, 4H), 3.95 (s, 4H), 7.88 (s, 4H).                                                  |
| 231 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 6H), 1.40 (m, 4H), 1.74 (quinteta, 4H), 3.80 (t, 4H), 4.09 (s, 4H), 5.27 (s, 2H), 7.64 (d, 4H), 7.75 (d, 4H).                    |
| 232 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.95 (t, 6H), 1.37 (dq, 4H), 1.71 (quinteta, 4H), 3.76 (t, 4H), 4.05 (s, 4H), 5.52 (s, 2H), 7.48 (t, 2H), 7.76 (dd, 4H), 7.96 (s, 2H).    |
| 233 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.76 (q, 2H), 7.45 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.55 (s, 1H).                                                                                   |
| 234 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.92 (t, 3H), 1.38 (m, 4H), 1.9 (penteta, 2H), 4.15 (t, 3H), 7.43 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.45 (s, 1H).                                    |
| 235 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.46 (t, 3H), 4.22 (q, 2H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.45 (s, 1H).                                                                     |
| 236 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.77 (d, 2H), 5.34, 5.38 (2ds, 2H), 6.0 (m, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.48 (s, 1H).                                                |
| 237 |         | (metanol-d <sub>4</sub> ): 1.02 (t, 3H), 2.1 (qt, 2H), 2.46 (s, 3H), 4.7 (pico debajo del solvente), 7.37 (d, 2H), 8.05 (d, 2H).                                |
| 238 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.83 (s, 3H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.46 (s, 1H).                                                                                   |
| 239 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.65 (s, 3H), 4.75 (q, 2H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H).                                                                                   |
| 240 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 5.30 (s, 2H), 7.34-7.52 (m, 7H), 8.08 (d, 2H), 8.46 (s, 1H).                                                                              |
| 241 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.72 (s, 9H), 7.40 (d, 2H), 8.05 (d, 2H), 8.32 (s, 1H).                                                                                   |
| 242 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.83 (s, 3H), 7.47 (m, 3H), 8.15 (m, 2H), 8.48 (s, 1H).                                                                                   |
| 243 |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 7.5 (m, 3H), 8.05 (m, 2H), 8.55 (s, 1H).                                                                                                |
| 244 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.91 (t, 2H), 1.32 (sexteta, 2H), 1.75 (penteta, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.05 (t, 2H), 6.90 (d, 2H), 8.02 (d, 2H), 8.35 (s, 1H).               |
| 245 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.77 (q, 2H), 7.35-7.5 (m, 2H), 8.04 (d, 1H), 8.14 (t, 1H), 8.57 (s, 1H).                                                                 |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ)                                                                                                                              |
|-----|---------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 246 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 5.28 (q, 2H), 7.48 (t, 1H), 7.49 (dt, 1H), 8.09 (dt, 1H), 8.18 (t, 1H), 8.86 (s, 1H).                                         |
| 247 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.42 (s, 3H), 4.75 (q, 2H), 7.27 (d, 2H), 8.02 (d, 2H), 8.54 (s, 1H).                                                         |
| 248 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.77 (q, 2H), 7.47 (t, 1H), 8.03 (d, 2H), 8.56 (s, 1H).                                                                       |
| 249 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.04 (s, 2H), 4.66 (q, 2H), 7.25-7.37 (m, 5H), 8.39 (s, 1H).                                                                  |
| 250 |         | (metanol-d <sub>4</sub> ): 1.27 (t, 3H), 4.22 (q, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.76 (d, 2H).                                                                  |
| 251 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.1-1.55 (m, 5H), 1.65-2.0 (m, 5H), 2.69 (tt, 1H), 4.64 (q, 2H), 8.42 (s, 1H).                                                |
| 252 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.88 (s, 3H), 4.77 (q, 2H), 7.03 (ddd, 1H), 7.39 (t, 1H), 7.68 (t, 1H), 7.74 (d, 1H).                                         |
| 253 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.53 (s, 3H), 4.77 (t, 2H), 8.05 (s, 2H), 8.54 (s, 1H).                                                                       |
| 254 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.92 (t, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.42 (d, 3H), 1.65 (m, 1H), 1.90 (m, 1H), 5.10 (m, 1H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.43 (s, 1H). |
| 255 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.96 (t, 3H), 1.15-1.6 (m, 6H), 1.65-2.0 (m, 8H), 4.04 (t, 2H), 8.32 (s, 1H).                                                 |
| 256 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.30 (m, 1H), 1.45 (m, 2H), 1.7-2.0 (m, 7H), 4.8 (tt, 2H), 7.43 (d, 2H), 8.10 (d, 2H), 8.43 (s, 1H).                          |
| 257 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.93 (t, 2H), 1.39 (m, 4H), 1.85 (penteta, 2H), 2.52 (s, 3H), 4.13 (t, 2H), 8.08 (s, 2H), 8.43 (s, 1H).                       |
| 258 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.4 (m, 2H), 1.85 (penteta, 2H), 4.15 (t, 2H), 7.45 (d, 2H), 8.08 (d, 2H), 8.44 (s, 1H).                        |
| 259 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.88 (t, 3H), 1.23-1.4 (m, 10H), 1.85 (penteta, 2H), 4.15 (t, 2H), 7.43 (d, 2H), 8.08 (d, 2H), 8.44 (s, 1H).                  |
| 260 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.88 (t, 3H), 1.23-1.4 (m, 14H), 1.85 (penteta, 2H), 4.15 (t, 2H), 7.43 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.44 (s, 1H).                  |
| 261 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 7.45 (m, 3H), 7.77 (d, 1H), 7.95 (m, 1H), 8.15 (d, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.73 (m, 1H).                                           |
| 262 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.89 (t, 3H), 1.35 (m, 6H), 1.85 (penteta, 2H), 4.15 (t, 2H), 7.44 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.44 (s, 1H).                       |
| 263 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.78 (q, 2H), 7.23 (m, 2H), 7.48 (dddd, 1H), 7.90 (td, 1H), 8.57 (s, 1H).                                                     |
| 264 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.97 (s, 2H), 7.39 (d, 2H), 8.03 (d, 2H), 8.49 (s, 1H).                                                                       |
| 265 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.18 (s, 9H), 3.85 (s, 2H), 7.44 (d, 2H), 8.07 (d, 2H), 8.42 (s, 1H).                                                         |
| 266 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 5.34 (s, 2H), 6.79 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.44 (d, 2H), 8.09 (d, 2H), 8.47 (s, 1H).                                           |

5

10

15

20

25

| No. | HPLC/MS                                         | DATOS DE RMN (300 MHZ) <sup>†</sup>                                                                                                                                                   |
|-----|-------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 267 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.77 (q, 2H), 7.40 (td, 1H), 7.41 (td, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 8.56 (s, 1H).                                                                         |
| 268 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.37 (sexteta, 2H), 1.80 (penteta, 2H), 2.76 (s, 3H), 4.14 (t, 2H), 8.38 (s, 1H).                                                                 |
| 269 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.98 (t, 3H), 1.42 (sexteta, 2H), 1.87 (penteta, 2H), 4.17 (t, 2H), 7.36 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 8.46 (s, 1H).                                    |
| 270 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.43 (sexteta, 2H), 1.86 (penteta, 2H), 4.17 (t, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.99 (dd, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).                                    |
| 271 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.00 (t, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.86 (m, 2H), 4.17 (t, 2H), 7.42 (t, 1H), 8.03 (d, 2H), 8.44 (s, 1H).                                                               |
| 272 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.50 (m, 2H), 0.62 (m, 2H), 1.43 (m, 1H), 4.02 (d, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.99 (dd, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.46 (s, 1H).                                                |
| 273 | 37%, 266 (M+Na) <sup>a</sup><br>40%, 268 (M+Na) |                                                                                                                                                                                       |
| 274 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.45 (t, 3H), 4.11 (q, 2H), 6.98 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 7.86 (d, 2H), 8.12 (d, 2H), 8.57 (s, 1H).                                                               |
| 275 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.31 (t, 3H), 2.42 (s, 3H), 4.28 (q, 2H), 4.89 (s, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.9 (m, 2H), 8.53 (s, 1H).                                                                 |
| 276 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.01 (t, 2H), 4.49 (t, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.80 (d, 2H), 8.29 (d, 2H), 8.34 (d, 2H), 8.56 (s, 1H).                                                               |
| 277 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.44 (sexteta, 2H), 1.87 (penteta, 2H), 4.17 (t, 2H), 7.4 (m, 2H), 8.05 (d, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).                                      |
| 278 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 2.47 (s, 3H), 7.29 (m, 1H), 7.41 (m, 3H), 7.55 (m, 2H), 8.10 (m, 1H), 8.20 (bs, 1H), 8.60 (1H).                                                                 |
| 279 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.92 (t, 3H), 1.25 (m, 2H), 1.36 (m, 4H), 1.83 (penteta, 2H), 7.01 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.89 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.62 (s, 1H). |
| 280 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99, 1.01 (2t, 6H), 1.53 (m, 2H), 1.80 (penteta, 2H), 1.91 (sexteta, 2H), 4.03 (t, 2H), 4.11 (t, 2H), 6.97 (d, 2H), 8.07 (d, 2H), 8.43 (s, 1H).                |
| 281 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.06 (t, 3H), 1.84 (sexteta, 2H), 3.99 (t, 2H), 4.74 (q, 2H), 6.98 (d, 2H), 8.06, d, 2H), 8.53 (s, 1H).                                                         |
| 282 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.82 (s, 3H), 7.08 (m, 4H), 7.13 (t, 3H), 7.37 (t, 1H), 8.2 (d, 1H), 8.46 (s, 1H).                                                                              |
| 283 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.15 (t, 2H), 7.03 (m, 2H), 7.43 (dt, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.44 (s, 1H).                                 |
| 284 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.43 (dt, 2H), 1.86 (quinteta, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 4.14 (t, 2H), 7.27 (d, 2H), 8.46 (d, 2H).                                         |
| 285 |                                                 | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.43 (dt, 2H), 1.83 (quinteta, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.53 (s, 3H), 4.13 (t, 2H), 7.36 (m, 2H), 8.30 (m, 2H).                                         |

5

10

| No. | HPLC/MS | DATOS DE RMN (300 MHZ):                                                                                                                                |
|-----|---------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 286 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.97 (t, 3H), 1.43 (dt, 2H), 1.80 (quinteta, 2H), 2.50 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 4.13 (t, 2H), 6.97 (d, 2H), 8.63 (d, 2H).          |
| 287 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 0.99 (t, 3H), 1.43 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 4.15 (t, 2H), 6.97 (m, 2H), 7.36 (dt, 1H), 8.14 (dd, 1H), 8.45 (s, 1H), 10.37 (s, 1H). |
| 288 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.00 (t, 3H), 1.43 (dq, 2H), 1.88 (quinteta, 2H), 4.21 (t, 2H), 7.94 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.54 (s, 2H).                        |
| 289 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 1.00 (t, 3H), 1.44 (dt, 2H), 1.86 (quinteta, 2H), 4.16 (t, 2H), 7.18 (t, 1H), 8.07 (m, 1H), 8.34 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H).         |
| 290 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 4.77 (q, 2H), 7.21 (t, 1H), 8.10 (m, 1H), 8.35 (dd, 1H), 8.55 (s, 1H).                                                           |
| 291 |         | (DMSO-d <sub>6</sub> ): 2.32 (s, 3H), 4.68 (q, 2H), 7.27 (d, 2H), 7.36 (d, 2H), NH sin resolver                                                        |
| 292 |         | (CDCl <sub>3</sub> ): 3.88 (s, 3H), 4.35 (s, 2H), 4.45 (q amplia, 2H), 7.45 (s, 3H).                                                                   |

El compuesto 273 fue preparado y probado como una mezcla 1:1, con su forma no oxidada (dihidro).

Los compuestos de la presente invención tienen actividad fungitóxica, particularmente contra hongos fitopatógenos. Son activos contra hongos de numerosas clases, incluyendo los deuteromicetos (hongos imperfectos), los basidiomicetos, los ficomycetos y los ascomicetos. Más en particular, el método de la presente invención provee actividad contra organismos que incluyen, pero sin limitación a ellos: *Pyricularia oryzae*, *Erysiphe graminis*, *Puccinia recondita*, *Colletotrichum lagenarium*, *Helminthosporium spp.*, *Alternaria solana*, *Septoria nodorum*, *Sclerotinia spp.*, *Sphaerotheca fulginea*, *Plasmopara viticola*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Cercospora spp.*, *Uncinula necator* y *Podosphaera leucotricha*. Más en particular, se controla las enfermedades del arroz mediante el método de la presente invención. Los ejemplos de

esas enfermedades del arroz son las enfermedades de la semilla, las enfermedades del suelo y las enfermedades de la sementera y del plantío, como las provocadas por *Pyricularia oryzae* y *Rhizoctonia spp.* Otras enfermedades incluyen el añublo pulverulento, incitado por *Sphaerotheca fuliginea* (por ejemplo, el añublo pulverulento de las cucurbitáceas), *Uncinula necator* (por ejemplo, el añublo pulverulento de la uva) y *Podosphaera leucotricha* (por ejemplo, el añublo pulverulento del manzano). Las enfermedades de los cereales son controladas, por ejemplo, las provocadas por *Erysiphe graminis*, *Puccinia recondita*, *Septoria nodurum* y *Helminthosporium spp.* Se controla las enfermedades del jitomate y de la papa, como las provocadas por *Alternaria solana*. Se puede aplicar los compuestos de la presente invención como rocíos fungicidas, mediante métodos empleados comúnmente, tales como rocíos hidráulicos de cantidades elevadas de litros, convencionales; rocíos de bajas cantidades de litros, chorros de aire, rocíos aéreos y espolvoreo. Dicho uso permite convenientemente el tratamiento de infestaciones fungales en plantíos, tales como en verduras, frutas, plantas ornamentales, semillas, pasto, cereales y viñas, entre otros plantíos. La dilución y el régimen de aplicación dependerán del tipo de equipo empleado, del método y la frecuencia de aplicación deseados, y de las enfermedades que van a ser controladas; pero habitualmente las cantidades efectivas son aproximadamente de 0.01 kilogramo (kg) a 20 kg de ingrediente activo (i.a.) por hectárea (ha). Como fungicida foliar, usualmente se aplica un compuesto de la

presente invención a plantas en crecimiento, a razón aproximada de 0.1 a 5, y de preferencia, aproximadamente de 0.125 a 0.5 kg por hectárea.

5 Como protector de semillas, la cantidad de tóxico aplicado sobre la semilla habitualmente está a un régimen de dosis aproximado de 10 a 250 gramos (g) y, de preferencia, aproximadamente de 20 a 60 g por 50 kilogramos de semilla. Como fungicida para el suelo, se puede incorporar la sustancia química en la tierra, o se la puede aplicar a la superficie, usualmente a razón de  
10 0.5 a 20 kg, aproximadamente, y de preferencia, aproximadamente de 1 a 5 kg por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son útiles para controlar hongos y pueden ser utilizados en diversos sitios, tales como la semilla, la superficie del agua, la tierra o el follaje. Para  
15 dichos propósitos, se puede usar estos compuestos en forma técnica o pura, como se los prepara, como soluciones o como formulaciones. Habitualmente se recoge los compuestos en un portador, o se los formula de manera que se vuelvan adecuados para uso subsiguiente como fungicidas. Por ejemplo, se puede formular estos agentes  
20 químicos como polvos humectables, polvos secos, concentrados emulsificables, polvos de espolvorear, formulaciones granuladas, aerosoles o concentrados en emulsión que puedan fluir. En tales formulaciones se extiende los compuestos con un portador líquido o sólido y, cuando se desee, se incorpora agentes tensioactivos  
25 adecuados.

Habitualmente es conveniente, en particular en caso de las formulaciones para rocío foliar, incluir adyuvantes, tales como agentes humectantes, agentes esparcidores, agentes dispersantes, adherentes, adhesivos y similares, de acuerdo con las prácticas agrícolas. Tales adyuvantes usados comúnmente en la técnica pueden ser encontrados en *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents* y en *McCutcheon's Functional Materials*, todos ellos publicados anualmente por McCutcheon Division de MC Publishing Company (Nueva Jersey, E. U. A.)

En general, los compuestos utilizados en esta invención pueden ser disueltos en solventes apropiados, tales como acetona, metanol, etanol, dimetilformamida o sulfóxido de dimetilo; y esas soluciones pueden ser extendidas con agua. Las concentraciones de la solución pueden variar de 1 por ciento a 90 por ciento, siendo una escala preferida de 5 a 50 por ciento.

Para la preparación de concentrados emulsificables se puede disolver los compuestos de la presente invención en solventes orgánicos adecuados, o en una mezcla de solventes, junto con un agente emulsificante que permita la dispersión del fungicida en agua. La concentración del ingrediente activo en los concentrados emulsificables habitualmente es de 10 por ciento a 90 por ciento, y en los concentrados en emulsión que pueden fluir puede llegar hasta a 75 por ciento.

Se puede preparar los polvos humectables para rociar

mezclando el compuesto con un sólido finamente dividido, tal como los silicatos y carbonatos inorgánicos, y las sílices, e incorporando agentes humectantes, agentes adherentes y/o agentes dispersantes en dichas mezclas. La concentración de ingredientes activos en esas formulaciones habitualmente está en la escala de 20 por ciento a 98 por ciento, de preferencia de 40 por ciento a 75 por ciento. Se forma un polvo humectable típico mezclando 50 partes de un compuesto de la presente invención, 45 partes de un dióxido de silicio hidratado, precipitado, sintético, vendido bajo la marca Hi-Sil® y 5 partes de lignosulfonato de sodio (Marasperse® N-22). En otra preparación de un tipo caolín (Barden), se usa arcilla en lugar del Hi-Sil, en el polvo humectable anterior, y en otra preparación similar, se reemplaza el 25 por ciento del Hi-Sil con un silicoaluminato de sodio sintético, vendido bajo la marca Zeolex® 7.

Se prepara los polvos para espolvorear mezclando los compuestos de la presente invención con sólidos inertes finamente divididos, que pueden ser de naturaleza orgánica o inorgánica. Los materiales útiles para este propósito incluyen las harinas botánicas, las sílices, los silicatos y los carbonatos. Un método conveniente para preparar un polvo para espolvorear es diluir un polvo humectable con un portador finamente dividido. Los concentrados de polvo para espolvorear que contienen de 20 por ciento a 80 por ciento del ingrediente activo, son preparados comúnmente y, posteriormente, son diluidos a la concentración de uso de 1 por ciento a 10 por ciento.

Se puede utilizar los compuestos de la presente invención en combinación con otros fungicidas, tales como ferbam, ziram, maneb, mancozeb, zineb, propineb, metham, thiram, el complejo de zineb y disulfuro de polietilen-tiuramo, dazomet y mezclas de éstos con sales de cobre, dinocap, binapacryl, carbonato de 2-secbutil-4,6-dinitrofenilisopropilo, captán, folpet, glyodin, anilazina, ditalimfos, 5-amino-1-[bis(dimetilamino)fosfinil]-3-fenil-1,2,4-triazol, etradiazol, dithianón, thioquinox, benomyl, thiabendazol, 4-(2-clorofenilhidrazono)-3-metil-5-isoxazolona, vinclozolin, iprodiona, procymidona, triadimenol, triadimefón, bitertanol, prochloraz, fenarimol, bis-(p-clorofenil)-3-piridinometanol, bis-(p-clorofenil)-5-pirimidinometanol, triarimol, flutriafol, flusilazol, propiconazol, eclanconazol, myclobutanil, fenbuconazol, hexaconazol, cyproconazol, tebuconazol, epoxiconazol, diniconazol, fluoroimida, 1-óxido de piridino-2-tiol, sulfato de 8-hidroxiquinolina y sus sales metálicas, 4,4-dióxido de 2,3-dihidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatilna, 2,3-dihidro-5-carboxanilido-6-metil-1,4-oxatilna, cis-N-[(1,1,2,2-tetracloroetil)tiol]-4-ciclohexeno-1,2-dicarboximida, cicloheximida, ácido deshidroacético, captafol, ethirimol, quinomethionate, éster metílico de D,L-metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(2'-metoxiacetil)alanina, D,L-metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-cloroacetil-D,L-2-amino-butirolactona, éster metílico de D,L-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(fenilacetil)alanina, 5-metil-5-vinil-3-(3,5-diclorofenil)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidina, 3-(3,5-diclorofenil)-5-metil-5-(metoximetil)-1,3-oxazolidino-2,4-diona, 3-(3,5-diclorofenil)-1-isopropilcarbamoil-

hidantoina, 2-ciano-[N-(etilaminocarbonil)-2-metoxiimino]acetamida, dodemorph, fenpropidina, 2,6-dimetil-N-tridecilmorfolina, dodemorph, triforina, chlorothalonil, dichlone, chloroneb, tricamba, TCPN, dichlorán, 2-cloro-1-nitropropano, policloronitrobencenos, como  
5 pentacloronitrobenceno (PCNB), tetrafluorodícloroacetona, griseofulvina, kasugamicina, polioxina, validamicina, estreptomicina, hidróxido de cobre, óxido cuproso, cloruro cúprico básico, carbonato de cobre básico, tereftalato de cobre, naftenato de cobre, mezcla de Burdeos, domina, sulfonato de p-dimetilaminobenceno-sodio,  
10 isotiocianato de metilo, 1-tiociano-2,4-dinitrobenceno, 1-feniltio-semicarbazida, cianamida de calcio, azufre de cal, thiophanato-ethyl, flutolanil, edifenphos, isoprotiolano, probenazol, iprobenfos, tricloclazol, piroquilon, dimetomorph, cymoxanil, thifluzamida, furalaxyl, ofurace, benalaxyl, oxadixyl, propamocarb, cyprofuram,  
15 fenpiclonil, fludioxonil, pirimetanil, ciprodinil, triticonazol, fluquinconazol, metconazol, esproxamina, carpropamid, azoxystrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, trifloxystrobin y zoxamida.

20 **PROTOCOLOS DE PRUEBA PARA FUNGICIDAS, Y DATOS DE**  
**PRUEBA**

Los ejemplos de las enfermedades contra las que son  
útiles los compuestos de la presente invención incluyen las  
25 enfermedades del arroz, tales como el tizón del arroz, la roya de la

cáscara del arroz y la mancha en la hoja de *helmenthospodium*, las enfermedades de cereales, como el añublo pulverulento del trigo, el moho de la hoja del trigo y la septoria, la roya temprana del jitomate y de la papa, la mancha de hoja temprana del cacahuete, el añublo 5 pulverulento de la uva y del pepino, el escabro de la manzana, el añublo pulverulento de la manzana, la podre café de las frutas, la antracnosa del pepino y el añublo pulverulento del frijol.

10      **SELECCIÓN DEL FUNGICIDA PARA CONTROLAR EL TIZÓN DEL**  
**ARROZ Y EL AÑUBLO PULVERULENTO DEL PEPINO**

**Propagación de la planta:**

Las plantas usadas en el programa de prueba del fungicida fueron desarrolladas en macetas cuadradas de 5.7 cm que 15 contenían el sustrato de propagación RediEarth. Se crió las plantas bajo condiciones de invernadero. Las plantas de arroz tenían 12 días de edad y los pepinos tenían 13 días de edad en el momento de rociarlas con los tratamientos químicos.

**Preparación de la muestra:**

20      Se pesó la muestra de la sustancia química experimental, y se disolvió en una solución de acetona-metanol-agua (A/M/W, a razón de 1:1:2 en volumen).

**Procedimiento de Rociado:**

Después de calibrar el rociador se vertió las soluciones 25 de prueba en el rociador de fungicida. El rociador de fungicida

contiene tres boquillas de aspersión, localizadas aproximadamente 10 cm por arriba y a los lados de las plantas. El rocío producido por las boquillas da por resultado una cobertura uniforme tanto de las partes superiores como de las partes inferiores de las hojas de la planta. Después de rociar, se colocó las plantas tratadas en una cámara de secado durante cuatro horas, antes de clasificarlas.

Añublo pulverulento del pepino:

Se mantuvo añublo pulverulento del pepino (APP), provocado por el hongo *Sphaerotheca fuliginea* en plantas grandes de pepino. Para preparar el inóculo se recolectó cinco a ocho hojas, dependiendo del tamaño, cubiertas completamente con esporas de añublo pulverulento. Se colocó las hojas en un matraz de vidrio y se las cubrió con 500 mL de agua que contenían cinco gotas de Tween-80. Se filtró el material a través de dos capas de tela de arpillera para eliminar los fragmentos de hoja. Se ajustó la cuenta de esporas a  $2 \times 10^5$  esporas por mililitro.

Se usó para esta prueba plantas de pepino de la variedad comercial "Bush Champion". Se adelgazó las plantas a una por maceta, después que los cotiledones estaban plenamente desarrollados. Dos días antes de la prueba se quitó las hojas y la región del meristema, dejando solamente los cotiledones y una hoja verdadera grande.

Las pruebas de protección requirieron que se inoculara las plantas de pepino un día después de rociar con el tratamiento químico. Se inoculó las plantas con una botella rociadora manual

que contenía la suspensión de esporas fungales. Se humedeció ligeramente las hojas en la superficie superior, desde dos diferentes direcciones de rocío. El desarrollo de la enfermedad ocurrió en el invernadero.

- 5                    Después de siete días se evaluó las plantas en cuanto al porcentaje de control de la enfermedad. Los resultados están informados como el porcentaje de control; 100 es control total de la enfermedad; cero es ningún control de la enfermedad.

Tizón del arroz:

- 10                   Se mantuvo el tizón del arroz (TA), provocado por el hongo *Pyricularia oryzae*, sobre placas de agar de dextrosa de papa (PDA), bajo lámparas fluorescentes, a la temperatura ambiente. Se usó seis diferentes aislados del hongo para preparar el inóculo. Se usó aproximadamente cinco placas de cada aislado para preparar
- 15    250 mL de inóculo. Se inundó con agua las placas y se las raspó suavemente con una espátula de hule. Se filtró la suspensión de esporas a través de una capa de tela de arpillera para eliminar los fragmentos miceliales y los trozos de agar. Se ajustó la cuenta de esporas para obtener una concentración de  $5 \times 10^6$  esporas por
- 20    mililitro.

- Se usó plantas de arroz de la variedad comercial "M-201" para esta prueba. Las pruebas de protección requirieron que se inoculara las plantas de arroz un día después de rociar con el tratamiento químico. Las pruebas de curación en la depuración
- 25    primaria exigieron que se inoculara las plantas un día después de

rociar con el tratamiento. Se inoculó las plantas con esporas  
fungales usando un atomizador DeVilbiss, a una presión de rocío de  
200 kPa. Se colocó rápidamente las plantas inoculadas en una  
cámara de rocío, con una humedad relativa (HR) de 100 por ciento, a  
5 20°C durante un día y dos noches, aproximadamente cuarenta horas.  
Se llevó las plantas al invernadero para el desarrollo de la  
enfermedad.

Seis días después de la inoculación se efectuó las  
comparaciones del tratamiento. Los resultados están informados  
10 como porcentaje de control; 100 es el control total de la enfermedad;  
cero es ningún control de la enfermedad.

**TABLA 4**  
**Datos de fungicida protector a 300 g/ha para tizón del arroz (TA)**  
15 **y añublo pulverulento del pepino (APP) en invernadero, dados en**  
**porcentaje de control. NP significa no probado**

20

25

| No. | TA | APP | No  | TA  | APP | No. | TA | APP |
|-----|----|-----|-----|-----|-----|-----|----|-----|
| 1   | 99 | 80  | 100 | 99  | 80  | 192 | 99 | 75  |
| 2   | 95 | 85  | 101 | 100 | 80  | 193 | 80 | 0   |
| 3   | 80 | 0   | 102 | 85  | 50  | 194 | 80 | 0   |
| 4   | 99 | 50  | 103 | 90  | 0   | 195 | 99 | 50  |
| 5   | 75 | 50  | 104 | 99  | 80  | 196 | 99 | 0   |
| 6   | 90 | 50  | 105 | 85  | 75  | 197 | 99 | 75  |

5

10

15

20

25

| No. | TA  | APP | No. | TA  | APP | No. | TA  | APP |
|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|
| 7   | 95  | 75  | 106 | 100 | 95  | 198 | 80  | 0   |
| 8   | 99  | 90  | 107 | 99  | 95  | 199 | 90  | 0   |
| 9   | 100 | 80  | 108 | 90  | 85  | 200 | 85  | 0   |
| 10  | 90  | 0   | 109 | 100 | 95  | 201 | 85  | 0   |
| 11  | 75  | 0   | 110 | 99  | 90  | 202 | 90  | 0   |
| 12  | 95  | 0   | 111 | 85  | 90  | 203 | 85  | 0   |
| 13  | 95  | 0   | 112 | 85  | 80  | 204 | 75  | 85  |
| 14  | 100 | 85  | 113 | 99  | 75  | 206 | 85  | 80  |
| 15  | 75  | 50  | 114 | 75  | 0   | 207 | 100 | 85  |
| 16  | 90  | 75  | 115 | 100 | 50  | 208 | 95  | 50  |
| 17  | 99  | 80  | 116 | 85  | 0   | 209 | 75  | 0   |
| 18  | 95  | 75  | 117 | 90  | 0   | 210 | 100 | 25  |
| 19  | 100 | 75  | 118 | 90  | 0   | 211 | 100 | 85  |
| 20  | 50  | 75  | 119 | 99  | 0   | 212 | 98  | 85  |
| 21  | 0   | 50  | 120 | 80  | 0   | 213 | 85  | 50  |
| 23  | 0   | 50  | 121 | 80  | 0   | 214 | 50  | 85  |
| 24  | 0   | 50  | 122 | 75  | 75  | 215 | 85  | 0   |
| 25  | 75  | 0   | 123 | 95  | 50  | 216 | 98  | 80  |
| 26  | 100 | 95  | 124 | 75  | 0   | 217 | 85  | 0   |
| 27  | 80  | 99  | 125 | 50  | 50  | 218 | 98  | 80  |
| 28  | 85  | 85  | 126 | 50  | 0   | 219 | 50  | 75  |
| 29  | 90  | 90  | 127 | 95  | 50  | 220 | 100 | 80  |

5

10

15

20

25

| No. | TA  | APP | No. | TA  | APP | No. | TA  | APP |
|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|
| 30  | 85  | 75  | 128 | 90  | 0   | 221 | 85  | 80  |
| 31  | 50  | 0   | 129 | 50  | 75  | 222 | 0   | 50  |
| 32  | 75  | 50  | 130 | 50  | 0   | 223 | 95  | 80  |
| 33  | 80  | 75  | 131 | 80  | 75  | 224 | 75  | 50  |
| 35  | 50  | 50  | 132 | 85  | 50  | 225 | 80  | 0   |
| 36  | 99  | 50  | 133 | 80  | 0   | 226 | 50  | 0   |
| 37  | 95  | 75  | 134 | 80  | 50  | 227 | 90  | 75  |
| 38  | 0   | 50  | 135 | 90  | 50  | 229 | 0   | 50  |
| 39  | 99  | 85  | 136 | 100 | 80  | 230 | 75  | 0   |
| 40  | 90  | 0   | 137 | 85  | 0   | 231 | 85  | 0   |
| 41  | 100 | 50  | 138 | 99  | 0   | 232 | 100 | 99  |
| 42  | 99  | 50  | 139 | 99  | 50  | 233 | 100 | 80  |
| 43  | 99  | 80  | 140 | 0   | 50  | 234 | 100 | 80  |
| 44  | 85  | 0   | 141 | 85  | 50  | 235 | 90  | 80  |
| 45  | 75  | 0   | 142 | 80  | 0   | 236 | 99  | 90  |
| 46  | 80  | 0   | 143 | 98  | 50  | 237 | 0   | 95  |
| 47  | 100 | 80  | 144 | 85  | 0   | 238 | 50  | 90  |
| 48  | 50  | 0   | 145 | 90  | 0   | 240 | 95  | 75  |
| 49  | 95  | 75  | 146 | 95  | 85  | 241 | 50  | 0   |
| 50  | 100 | 80  | 147 | 98  | 0   | 243 | 75  | 0   |
| 51  | 90  | 0   | 148 | 80  | 80  | 244 | 100 | 50  |
| 52  | 50  | 0   | 149 | 95  | 75  | 245 | 99  | 0   |

5

10

15

20

25

| No. | TA | APP | No. | TA  | APP | No. | TA  | APP |
|-----|----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|
| 53  | 75 | 0   | 150 | 100 | 50  | 246 | 100 | 0   |
| 54  | 99 | 85  | 151 | 90  | 0   | 247 | 100 | 80  |
| 55  | 90 | 50  | 152 | 85  | 0   | 248 | 100 | 80  |
| 56  | 80 | 80  | 153 | 100 | 0   | 249 | 85  | 0   |
| 57  | 50 | 0   | 154 | 0   | 75  | 250 | 90  | 50  |
| 58  | 85 | 50  | 155 | 90  | 85  | 251 | 75  | 0   |
| 59  | 50 | 0   | 156 | 85  | 0   | 252 | 85  | 0   |
| 60  | 75 | 0   | 157 | 98  | 0   | 253 | 100 | 50  |
| 61  | 85 | 50  | 158 | 85  | 0   | 254 | 95  | 0   |
| 62  | 85 | 0   | 159 | 85  | 0   | 255 | 50  | 0   |
| 64  | 50 | 0   | 160 | 75  | 0   | 256 | 95  | NP  |
| 65  | 95 | 50  | 161 | 80  | 0   | 257 | 95  | 50  |
| 66  | 50 | 0   | 162 | 95  | 50  | 258 | 100 | 75  |
| 67  | 99 | 80  | 163 | 90  | 0   | 259 | 90  | 75  |
| 68  | 0  | 50  | 164 | 100 | 95  | 260 | 75  | 0   |
| 69  | 95 | 80  | 165 | 80  | 0   | 261 | 50  | 0   |
| 70  | 80 | 80  | 166 | 75  | 0   | 262 | 85  | 80  |
| 71  | 75 | 50  | 167 | 85  | 0   | 23  | 80  | 85  |
| 72  | 75 | 50  | 168 | 95  | 50  | 264 | 50  | 0   |
| 73  | 85 | 75  | 169 | 95  | 50  | 265 | 85  | 90  |
| 74  | 99 | 0   | 170 | 90  | 75  | 266 | 90  | 50  |
| 75  | 0  | 85  | 171 | 80  | 50  | 267 | 80  | 85  |

| No. | TA  | APP | No  | TA | APP | No.  | TA  | APP |
|-----|-----|-----|-----|----|-----|------|-----|-----|
| 76  | 0   | 25  | 172 | 98 | 0   | 268  | 0   | 75  |
| 77  | 0   | 50  | 173 | 50 | 0   | 269  | 99  | 0   |
| 78  | 0   | 25  | 174 | 75 | 0   | 270  | 100 | 95  |
| 79  | 75  | 50  | 175 | 95 | 0   | 271  | 99  | 50  |
| 80  | 0   | 50  | 176 | 50 | 50  | 272  | 100 | 80  |
| 82  | 0   | 25  | 177 | 95 | 50  | 273* | 100 | 0   |
| 83  | 80  | 0   | 178 | 75 | 0   | 274  | 85  | 0   |
| 84  | 80  | 85  | 179 | 75 | 0   | 275  | 85  | 0   |
| 85  | 100 | 50  | 180 | 95 | 90  | 276  | 85  | 0   |
| 86  | 99  | 80  | 181 | 50 | 0   | 277  | 95  | 0   |
| 87  | 90  | 0   | 182 | 85 | 0   | 278  | 85  | 0   |
| 88  | 100 | 50  | 183 | 95 | 0   | 280  | 50  | 0   |
| 89  | 75  | 0   | 184 | 85 | 75  | 281  | 85  | 95  |
| 92  | 0   | 50  | 185 | 80 | 75  | 282  | 75  | 75  |
| 93  | 0   | 75  | 186 | 85 | 0   | 283  | 90  | 50  |
| 94  | 0   | 75  | 187 | 80 | 0   | 287  | 80  | 0   |
| 95  | 25  | 75  | 188 | 80 | 0   | 288  | 0   | 75  |
| 96  | 50  | 75  | 189 | 80 | 75  | 289  | 100 | 50  |
| 97  | 0   | 85  | 190 | 80 | 0   | 290  | 100 | 50  |
| 98  | 85  | 75  | 191 | 95 | 50  | 291  | 80  | 0   |
| 99  | 100 | 80  |     |    |     | 292  | 99  | 75  |
|     |     |     |     |    |     | 293  | 100 | 50  |

5

| No.                                                                                             | TA | APP | No. | TA | APP | No. | TA  | APP |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------|----|-----|-----|----|-----|-----|-----|-----|
|                                                                                                 |    |     |     |    |     | 294 | 100 | 80  |
|                                                                                                 |    |     |     |    |     | 295 | 99  | 50  |
|                                                                                                 |    |     |     |    |     | 298 | 98  | 75  |
| * Se preparó y se probó el compuesto 273 como una mezcla 1:1 con su forma no oxidada (dihidro). |    |     |     |    |     |     |     |     |

Para uso Insecticida se puede aplicar directamente las composiciones y los compuestos de la presente invención al sitio que se va a proteger, como, por ejemplo, el área alrededor de, o sobre plantas económicas, infectadas con insectos; o a plantas en las que se va a prevenir la infestación. Los ejemplos de insectos dañinos son los de los órdenes lepidópteros, coleópteros, dípteros, tisanópteros, himenópteros, heterópteros, homópteros, ortópteros y acáridos. Se puede usar los compuestos y las composiciones ya sea como plaguicidas de contacto o sistémicos. Se aplica los compuestos de la presente invención al hábitat de los insectos, a razón de 0.0005 a 10 kilogramos por hectárea, de preferencia de 0.05 a 5 y, muy preferible, de 0.1 a 1 kilogramo por hectárea.

En la práctica del método de la invención se puede aplicar el compuesto activo al suelo o al follaje, donde es absorbido por la planta, trasladado a otras partes de la planta y, finalmente, ingerido por la plaga o por los insectos, al ingerir parte(s) de la planta. Este medio de aplicación es denominado aplicación "sistémica". Alternativamente, se puede aplicar el compuesto activo

al suelo y se puede poner en contacto éste con los insectos y otras plagas que van a ser controladas. Este medio de aplicación se denomina aplicación "al suelo". En otra alternativa, se puede aplicar foliarmente el compuesto activo a las plantas para liberarlas de  
5 insectos y otras plagas que se alimentan del follaje.

Se puede emplear los compuestos activos de la presente invención solos o en forma de mezclas con otros y/o con dichos vehículos portadores dispersables en sólidos y/o líquidos, y/o con otros agentes activos compatibles, especialmente agentes para  
10 protección de las plantas, tales como otros insecticidas, artropodocidas, nematocidas, fungicidas, bactericidas, rodenticidas, herbicidas, fertilizantes, agentes reguladores del crecimiento y sinérgicos.

En las composiciones de la presente invención se  
15 encuentra presente el compuesto activo en una cantidad sustancialmente entre alrededor de 0.0001 y 99 por ciento en peso. Para composiciones adecuadas para almacenamiento o transporte, la cantidad de ingrediente activo de preferencia está aproximadamente entre 0.5 y 90 por ciento en peso; más preferible, aproximadamente  
20 entre 1 y 75 por ciento en peso de la mezcla. Las composiciones adecuadas para aplicación directa o aplicación al campo generalmente contienen el compuesto activo en una cantidad sustancialmente entre alrededor de 0.0001-95 por ciento, de preferencia aproximadamente entre 0.0005 y 90 por ciento en peso; y  
25 más preferible, aproximadamente entre 0.0005 y 90 por ciento en

peso; y todavía más preferible, aproximadamente entre 0.001 y 75 por ciento en peso de la mezcla. También se puede establecer la composición como una razón del compuesto al portador. En la presente invención la razón en peso de estos materiales (compuesto activo/portador) puede variar desde 99:1 a 1:4 y, más preferible, de 10:1 a 1:3.

En general se puede disolver los compuestos de la presente invención en ciertos solventes, tales como acetona, metanol, etanol, dimetilformamida, piridina o sulfóxido de dimetilo, y se puede diluir con agua dichas soluciones. Las concentraciones de la solución pueden variar aproximadamente de 1 por ciento a 90 por ciento, siendo una escala preferida aproximadamente de 5 por ciento a 50 por ciento.

Para la preparación de concentrados emulsificables se puede disolver el compuesto en solventes orgánicos adecuados, o en una mezcla de solventes, junto con un agente emulsificante, para acrecentar la dispersión del compuesto en agua. La concentración del ingrediente activo en los concentrados emulsificable habitualmente es alrededor de 10 por ciento a alrededor de 90 por ciento, y en los concentrados en emulsión que pueden fluir, puede llegar hasta aproximadamente 75 por ciento.

Se puede aplicar los compuestos activos como rocíos de insecticida, mediante métodos empleados comúnmente, tales como rocíos hidráulicos convencionales, en elevada cantidad de litros, rocíos en baja cantidad de litros, rocíos de volumen ultra-bajo,

rocíos con chorro de aire, rocíos aéreos y espolvoreado.

La presente invención contempla también métodos para matar, combatir o controlar plagas que comprenden poner en contacto las plagas con una cantidad combativa o tóxica (es decir, una cantidad plaguicidamente efectiva) de por lo menos un compuesto activo de la presente invención, solo o junto con un vehículo portador (composición o formulación), como se hizo notar más atrás. El término "contacto", tal como se emplea en la memoria descriptiva y en las reivindicaciones, significa aplicar a por lo menos uno de: (a) las plagas y (b) su correspondiente hábitat (es decir, el sitio que se va a proteger, por ejemplo, a un cultivo o a un área en la que se va a desarrollar un cultivo), el compuesto activo de la presente invención, solo o como constituyente de una composición o de una formulación.

Además de los ingredientes mencionados más arriba, las preparaciones de acuerdo con la presente invención también pueden contener otras sustancias usadas comúnmente en las preparaciones de esta clase. Por ejemplo, se puede añadir un lubricante, tal como estearato de calcio o estearato de magnesio, a un polvo humectable o a una mezcla que se va a granular. Adicionalmente, por ejemplo, se puede añadir "adhesivos", tales como derivados de alcohol polivinílico-celulosa u otros materiales coloidales, tales como caseína, para mejorar la adherencia del plaguicida a la superficie que va a ser protegida.

**PROT COLO DE PRUEBA DE INSECTICIDA Y DATOS DE PRUEBA**

Se probó numerosos compuestos de la presente invención en cuanto a su actividad insecticida. Se llevó a cabo esta prueba  
5 usando dos protocolos diferentes.

**Protocolo 1:****Preparación de la solución de prueba:**

Se preparó una solución de prueba que contenía 1250  
10 partes por millón (ppm), disolviendo el compuesto de prueba en 15  
mililitros de solvente (acetona:metanol, 1:1), y añadiendo luego 65  
mililitros de un segundo solvente (acetona:agua, 1:1), para dar un  
sistema de acetona:agua:metanol, de 50:40:10.

**Rociador:**

15 La cámara de rociado cerrada consistió de una sola  
boquilla rociadora, montada en una pluma que se mueve a una  
velocidad y una distancia fijas sobre blancos estacionarios. La  
distancia vertical de la punta de la boquilla a los blancos se ajustó  
para dar regímenes que varían desde 150 g/hectárea hasta 600  
20 g/hectárea.

**3.- Especies de prueba**

Se llevó a cabo pruebas con las siguientes plagas:

**Especies foliares**

| <b><u>SÍMBOLO</u></b> | <b><u>NOMBRE COMÚN</u></b>        | <b><u>NOMBRE LATINO</u></b> |
|-----------------------|-----------------------------------|-----------------------------|
| AW                    | Gusano de esclara sureño          | Spodoptera edidania         |
| BB                    | Gorgojo del frijol mexicano       | Epilachna verivestis        |
| 5 MTA                 | Ácaro arácnido de doble<br>mancha | Tetranychus urticae         |

**Gusano de esclara sureño:**

Se colocó hojas individuales de haba (Phaseolus limensis) primarias, totalmente expandidas, con el lado inferior hacia arriba, sobre trozos humedecidos de papel filtro, en platos Petri. Se roció las hojas con las soluciones de prueba y se dejó secar. Se infestó los platos con cinco larvas de tercera etapa, del gusano de esclara sureño, se cubrió con las tapas y se mantuvo a 27°C. Se clasificó el control del gusano de esclara mediante inspección visual, después de 48 horas. Una clasificación de 100 indicó que todas las larvas estaban muertas. Una clasificación de cero indicó ninguna larva muerta, y que se alimentaban normalmente. El control intermedio fue indicado por las clasificaciones intermedias.

**Gorgojo de frijol mexicano:**

Se colocó hojas individuales de haba (Phaseolus limensis) primarias, totalmente expandidas, con el lado inferior hacia arriba, sobre trozos humedecidos de papel de filtro, en platos Petri. Se roció las hojas con las soluciones de prueba y se dejó secar. Se infestó los platos con cinco larvas en tercer etapa del gorgojo de frijol mexicano, se cubrió con las tapas y se mantuvo a 27°C. Se

clasificó el control del gorgojo del frijol mediante inspección visual, después de 48 horas. Una clasificación de 100 indicó que todas las larvas estaban muertas. Una clasificación de cero indicó que ninguna larva murió y que se alimentaban normalmente. Se indicó el control intermedio por las clasificaciones intermedias.

**C.- Ácaro arácnido de doble mancha:**

Se colocó una almohadilla de algodón humedecido en un plato Petri. Se colocó una sección de 6.45 cm<sup>2</sup>, cortada de una hoja primaria, totalmente expandida, de haba (*Phaseolus limensis*) con el lado inferior hacia arriba, sobre este algodón húmedo. Se infestó el cuadro de hoja con aproximadamente 50 ácaros hembras adultas. Se roció los platos con las soluciones de prueba y se mantuvo a 27°C para la determinación de mortandad un día después del tratamiento. Se clasificó el porcentaje de muertes desde 100 por ciento (todas muertas) hasta 0 por ciento (todas vivas).

**Protocolo 2:**

Se solubilizó los compuestos candidatos en una mezcla de solventes (ya sea acetona/metanol/agua o DMSO/agua). Se clasificó los compuestos contra *Aedes aegypti* (mosquito de la fiebre amarilla, YFM) o contra el nematodo *Caenorhabditis elegans* (CE).

Para clasificar *A. aegypti* se llenó concavidades con 1 mL de dieta (500 ppm de un polvo de hígado/levadura, 1:1, en agua desionizada). Se añade el volumen apropiado de material de prueba a las concavidades, para dar una concentración final de 3 partes por

millón. Se usó aproximadamente de diez a quince larvas de mosquito, de tres (3) días de edad, para infestar las concavidades de prueba. Se guardó las bandejas con larvas de mosquito en una sala a 27°C, y se tomó las lecturas de mortandad tres días después de la infestación. Se declaró que un compuesto era activo si todos los organismos que se encontraban dentro de la concavidad de prueba estaban muertos en el momento de la lectura.

Para seleccionar *C. elegans* se llenó las concavidades con un mililitro de dieta para *E. coli* (densidad de células = 4 por ciento de la transmitancia a 535 nanómetros). Se añade el volumen apropiado del material de prueba a las concavidades, para dar una concentración final de 15 o 20 partes por millón. Se usó aproximadamente diez a quince nemátodos de cuatro (4) días de edad para infestar las concavidades de prueba. Se guarda las placas de prueba a 21°C y se toma lecturas de mortandad seis días después de la infestación. Se declara que un compuesto es activo si todos los organismos que se encuentran dentro de la concavidad de prueba están muertos en el momento de la lectura.

20

**TABLA 5****DATOS DE INSECTICIDA PARA LOS COMPUESTOS DE LA INVENCION**

25

5

10

15

20

25

| Protocolo 1         |       |     |     |     | Protocolo 2           |                       |
|---------------------|-------|-----|-----|-----|-----------------------|-----------------------|
|                     |       |     |     |     | CE                    | YFM                   |
| Compuesto<br>Número | Dosis | AW  | BB  | MTA | Insecti-<br>da activo | Insecti-<br>da activo |
| 4                   | 300   | 75  | 0   | 0   | NP                    | NP                    |
| 5                   | 300   | NP  | 75  | 0   | NP                    | NP                    |
| 5                   | 600   | 50  | NP  | NP  | NP                    | NP                    |
| 6                   | 300   | 0   | 100 | 0   | NP                    | NP                    |
| 7                   | 300   | 0   | 100 | 100 | NP                    | NP                    |
| 8                   | 300   | 0   | 0   | 100 | NP                    | NP                    |
| 9                   | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                    | sí                    |
| 16                  | 150   | NP  | NP  | 69  | sí                    | sí                    |
| 18                  | 150   | NP  | NP  | 100 | sí                    | no                    |
| 19                  | 150   | 0   | 100 | 90  | NP                    | NP                    |
| 26                  | 300   | 0   | 50  | 0   | NP                    | NP                    |
| 27                  | 300   | 0   | 75  | 0   | NP                    | NP                    |
| 29                  | 300   | 0   | 0   | 90  | NP                    | NP                    |
| 33                  | 300   | 0   | 100 | 75  | NP                    | NP                    |
| 34                  | 300   | 0   | 75  | 0   | NP                    | NP                    |
| 37                  | 300   | 100 | 75  | 75  | NP                    | NP                    |
| 40                  | 300   | 0   | 50  | 90  | NP                    | NP                    |
| 41                  | 300   | 0   | 50  | 0   | NP                    | NP                    |
| 43                  | 150   | 50  | 0   | 0   | NP                    | NP                    |
| 44                  | 150   | 75  | 0   | 0   | NP                    | NP                    |
| 48                  | 150   | 0   | 0   | 75  | NP                    | NP                    |
| 50                  | 150   | 0   | 0   | 75  | no                    | no                    |
| 52                  | 150   | 0   | 0   | 100 | NP                    | sí                    |
| 60                  | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                    | no                    |
| 61                  | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                    | no                    |
| 63                  | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                    | sí                    |
| 65                  | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                    | no                    |
| 67                  | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                    | no                    |
| 69                  | 150   | NP  | NP  | 68  | sí                    | no                    |

5

10

15

20

25

| Protocolo 1         |       |    |    |     | Protocolo 2             |                         |
|---------------------|-------|----|----|-----|-------------------------|-------------------------|
|                     |       |    |    |     | CE                      | YFM                     |
| Compuesto<br>Número | Dosis | AW | BB | MTA | Insectici-<br>da activo | Insectici-<br>da activo |
| 70                  | 150   | NP | NP | 71  | no                      | no                      |
| 81                  | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 86                  | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 91                  | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 99                  | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 100                 | 150   | NP | NP | 25  | sí                      | no                      |
| 101                 | 150   | NP | NP | 0   | sí                      | no                      |
| 103                 | 150   | NP | NP | 23  | sí                      | sí                      |
| 109                 | 150   | NP | NP | 90  | sí                      | no                      |
| 110                 | 150   | NP | NP | 100 | sí                      | sí                      |
| 112                 | 150   | NP | NP | 0   | sí                      | no                      |
| 123                 | 150   | NP | NP | 0   | sí                      | no                      |
| 127                 | 150   | NP | NP | 95  | no                      | no                      |
| 128                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 133                 | 150   | NP | NP | 0   | no                      | sí                      |
| 134                 | 300   | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 135                 | 150   | NP | NP | 3   | no                      | no                      |
| 137                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | sí                      |
| 162                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 163                 | 150   | NP | NP | 100 | no                      | no                      |
| 164                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | sí                      |
| 171                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 175                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 178                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 179                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 180                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 183                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 203                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 205                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |

5

10

15

20

25

| Protocolo 1         |       |     |     |     | Protocolo 2             |                         |
|---------------------|-------|-----|-----|-----|-------------------------|-------------------------|
|                     |       |     |     |     | CE                      | YFM                     |
| Compuesto<br>Número | Dosis | AW  | BB  | MTA | Insectici-<br>da activo | Insectici-<br>da activo |
| 209                 | NP    | NP  | NP  | NP  | no                      | sí                      |
| 210                 | NP    | NP  | NP  | NP  | no                      | sí                      |
| 223                 | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                      | NP                      |
| 233                 | 300   | 50  | 75  | 0   | NP                      | NP                      |
| 234                 | 300   | 0   | 0   | 100 | NP                      | NP                      |
| 235                 | 300   | 0   | 100 | 100 | NP                      | NP                      |
| 236                 | 300   | 0   | 100 | 100 | NP                      | NP                      |
| 238                 | 300   | 0   | 75  | 100 | NP                      | NP                      |
| 239                 | 300   | 0   | 75  | 0   | NP                      | NP                      |
| 240                 | 300   | 50  | 75  | 100 | NP                      | NP                      |
| 241                 | 300   | 0   | 0   | 100 | NP                      | NP                      |
| 242                 | 300   | 0   | 90  | 100 | NP                      | NP                      |
| 245                 | 300   | 100 | 100 | 100 | NP                      | NP                      |
| 247                 | 300   | 0   | 90  | 0   | NP                      | NP                      |
| 248                 | 150   | 0   | 0   | 100 | NP                      | NP                      |
| 249                 | 150   | 100 | 0   | 90  | NP                      | NP                      |
| 251                 | 150   | 0   | 50  | 75  | NP                      | NP                      |
| 252                 | 150   | 0   | 100 | 50  | NP                      | NP                      |
| 253                 | 150   | 0   | 0   | 100 | NP                      | NP                      |
| 254                 | 150   | 0   | 100 | 100 | sí                      | no                      |
| 255                 | 150   | 0   | 90  | 100 | no                      | no                      |
| 256                 | 150   | 0   | 0   | 90  | no                      | no                      |
| 258                 | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                      | no                      |
| 259                 | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                      | no                      |
| 260                 | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                      | no                      |
| 262                 | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                      | sí                      |
| 264                 | NP    | NP  | NP  | NP  | sí                      | no                      |
| 265                 | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                      | sí                      |
| 266                 | 150   | NP  | NP  | 0   | sí                      | sí                      |

5

10

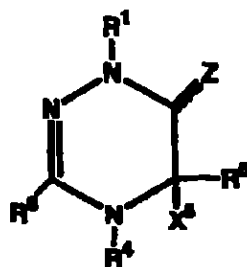
| Protocolo 1         |       |    |    |     | Protocolo 2             |                         |
|---------------------|-------|----|----|-----|-------------------------|-------------------------|
|                     |       |    |    |     | CE                      | YFM                     |
| Compuesto<br>Número | Dosis | AW | BB | MTA | Insectici-<br>da activo | Insectici-<br>da activo |
| 270                 | 150   | NP | NP | 0   | sí                      | no                      |
| 271                 | 150   | NP | NP | 93  | sí                      | sí                      |
| 277                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | sí                      |
| 278                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | no                      |
| 284                 | NP    | NP | NP | NP  | sí                      | sí                      |
| 285                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 286                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |
| 288                 | NP    | NP | NP | NP  | no                      | sí                      |

sí = activo; no = inactivo; NP = no probado.

**REIVINDICACIONES**

1.- Un compuesto de la fórmula:

5



10 en la que:

15 **R¹** es alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, trialquilsililalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcóxicarbonilo, alquilcarbonilo, alcóxicarbonilalquilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, nitro, alcoxi, alquiltio, haloalquilo, haloalquiltio y haloalcoxi; fenilalquilo o fenilalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, piridilo o piridilo sustituido con uno o dos sustituyentes, independientemente seleccionados del grupo que consiste de alquilo y halógeno, furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo

20

25

sustituidos con halógeno o alquilo en el anillo de furilo o de tienilo; benzotienilo, benzofuranilo o benzotienilo o benzofuranilo sustituidos con halógeno, alquilo o haloalquilo;

5  $R^3$  es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, arilo seleccionado de fenilo, naftilo y fenilo y naftilo sustituidos

10 con uno a cinco sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico

15 de 5 o 6 miembros, o fenilo y naftilo sustituido con un grupo heteroarilo seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, y furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo,

20 pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, sustituidos con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano;

25 fenilo, fenoxi, y fenilo y fenoxi sustituidos con uno o dos

- sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, alquiltio, nitro y ciano; heteroarilo, seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, 5 piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, pirazolilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, tiazolilo, triazolilo, triazinilo, isoxazolilo y oxazolilo, y furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo y oxazolilo, sustituidos con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de 10 halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, haloalquiltio, nitro y ciano;
- R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquiltio, amino, 15 alquilamino, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros; ciano, alquenilo, alquenilsulfonilo, haloalquenilo, alquenilcarbonilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alcoxicarboniltio, (alquiltio)carbonilo, alquil(tiocarbonilo), alquiltiotiocarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alqueniltiotlocarbonilo, alquiniloxi- 20 carbonilo, alquiniltiotlocarbonilo, alcoxioxalilo, alquil-carboniloxialcoxicarbonilo, aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, arilsulfonilalquenilo, ariloxicarbonilo, ariloxitlocarbonilo, 25

- ariltiotiocarbonilo sustituido en un anillo aromático con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y alquilo; o tenilo o tenilo sustituido en el anillo de tienilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;
- 5  $R^5$  es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, formilo, alcoxi, alcóxicarbonilo, alcóxicarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcóxicarboniltio, alquilcarboniltio, alquiltio, hidroxi, mercapto, alquenilo, alquínilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino; donde los
- 10 grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros; arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniltio o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniltio sustituido en el
- 15 anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi haloalquilo, haloalcoxi, amino, alquilamino y dialquilamino; donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman
- 20 un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros; o
- $R^4$  puede formar un anillo fundido al sustituyente  $R^3$ , cuando el sustituyente  $R^3$  es arilo o heteroarilo, donde  $R^4$  está seleccionado de  $-\text{CH}(\text{R})-$ ,  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{N}(\text{R})-$ ,  $-\text{C}(=\text{O})-$ ,  $-\text{O}(\text{C}=\text{O})-$ ,  $-(=\text{O})\text{O}-$ ,  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ,  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $-\text{N}(\text{R})\text{CH}_2-$ ,  $-\text{C}(\text{R})=\text{N}-$ ,  $-\text{N}=\text{C}(\text{R})-$ ,  $-\text{CH}(\text{R})\text{O}-$ ,  $-\text{OCH}(\text{R})-$ ,  $-\text{CH}(\text{R})\text{S}-$  y  $-\text{SCH}(\text{R})-$ ; o
- 25

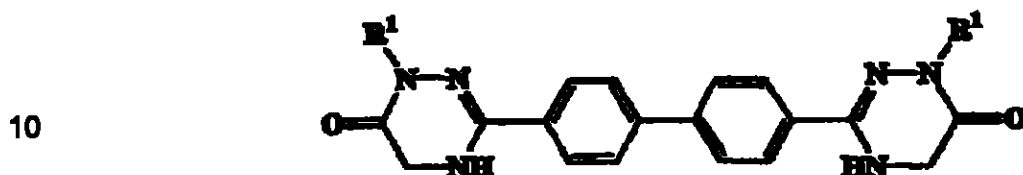
$R^3$  y  $R^4$ , tomados juntos, pueden formar un anillo de piridazinilo sustituido;

$R^5$  y  $X^5$ , tomados juntos, pueden formar un carbonilo; o

$X^5$  es un átomo de hidrógeno, o tomado junto con  $R^4$  forma una  
5       ligadura de nitrógeno a carbono;

Z es un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NR;

R es H o alquilo, o un compuesto de la fórmula:



o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente aceptables y sus mezclas; a condición de que:

cuando  $R^1$  es un aralquilo o un heteroaralquilo,  $R^4$  no sea ciano,  
15       alquilsulfonilo, arilsulfonilo o polihaloalquilo;

cuando  $R^1$  es acetilo y  $R^3$  es 2-piridilo,  $R^5$  y  $X^5$  tomados juntos no puedan formar un carbonilo; y

cuando  $R^3$  es fenilo, metilo o ciclohexilo,  $R^1$  no sea fenilo, metilo, nitrofenilo, etoxycarbonilo, bencilo o benciloximetilo.

20               2.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque:

$R^1$  es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8  
25       átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono,

- cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcóxicarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxicarbonil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o benzofuranilo;
- R<sup>3</sup>** es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno,

234 00384

- alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo, naftilo, o fenilo o naftilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de
- 5 halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, dialquil
- 10 de 1 a 4 átomos de carbono-amino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo o quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo o benzotienilo
- 15 sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;
- 20  $R^4$  es un átomo de hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 8 átomos de carbono-
- 25 alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilcarbonilo de 3 a

8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 8 átomos de carbono, fenilsulfonil-

5 alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilcarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonil de 1 a 4 átomos de carbono-

10 alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquil de 1 a 4 átomos de carbono-carboniloximetoxicarbonilo, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-carboniltio, (alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono)-carbonilo, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono-tiocarbonilo, alqueniloxicarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, alquiniloxicarbonilo de 2

15 a 8 átomos de carbono, alquiniltio de 2 a 8 átomos de carbono-tiocarbonilo, alcoxióxalilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alcoxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzolilo, fenoxicarbonilo, fenoxitiocarbonilo,

20 feniltiotiocarbonilo o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzolilo, fenoxicarbonilo, fenoxitiocarbonilo, feniltio-tiocarbonilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a dos sustituyentes, independientemente seleccionados de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o tenilo o tenilo sustituido

25 en el anillo de tienilo con uno a dos sustituyentes,

seleccionados independientemente de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

- 5 **R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxí, mercapto, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;
- 10 **Z** es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y
- X<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno o, tomado junto con **R<sup>4</sup>**, forma una ligadura de nitrógeno a carbono.

3.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 2, caracterizado además porque:

- 15 **R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, alquino de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos
- 20 de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;
- R<sup>3</sup>** es fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,
- 25 haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 2

átomos de carbono;

- R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarboniltio de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquiniloxicarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono o alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-oxalilo; y
- R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

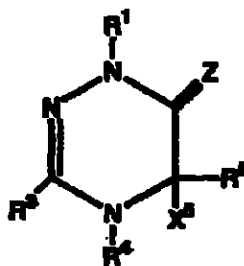
4.- El compuesto de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado además porque:

- R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;
- R<sup>3</sup>** es fenilo disustituido con halógeno, fenilo disustituido con alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo disustituido con haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo monosustituido con halomonoalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo monosustituido con monohaloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono;
- R<sup>4</sup>** y **R<sup>5</sup>** son hidrógeno.

5.- Una composición fungicida, caracterizada porque

comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de la fórmula:

5



en la que:

- 10 R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, trialquilsililalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcoxycarbonilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilalquilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, nitro, alcoxi, alquiltio, haloalquilo, haloalquiltio y haloalcoxi, fenilalquilo o fenilalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, piridilo o piridilo sustituido con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo y halógeno, furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo
- 15
- 20
- 25

sustituidos con halógeno o alquilo en el anillo de furilo o de tienilo, benzotienilo, benzofuranilo o benzotienil o benzofuranilo sustituidos con halógeno, alquilo o halogenoalquilo;

- 5  $R^3$  es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi; arilo  
10 seleccionado de fenilo, naftilo y fenilo y naftilo sustituido con uno a cinco sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, halogenoalquilo, halogenoalcoxi, alquiltio, halogenoalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno  
15 al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, o fenilo o naftilo sustituidos con un grupo heteroarilo seleccionado de furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-  
20 1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo; y furilo, tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, 3-(4,5-dihidro-1,2,4-triazin-6-on)ilo y oxazol-5-ilo, sustituidos con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno,  
25 alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano,

- fenilo, fenoxi, y fenilo y fenoxi sustituidos con uno o dos  
sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que  
consiste de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi,  
alquiltio, nitro y ciano, heteroarilo, seleccionado de furilo,  
5 tienilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo,  
piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, pirazolilo, 1,2,3-  
tiadiazol-4-ilo, tiazolilo, triazolilo, triazinilo, isoxazolilo y  
oxazolilo, y furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo,  
pirazinilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo y oxazolilo, sustituidos con uno  
10 o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de  
halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio,  
haloalquiltio, nitro y ciano;
- R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, haloalquilo, alquilcarbonilo,  
alquilcarbonilalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo,  
15 cicloalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alcoxi, alquiltio, amino,  
alquilamino, dialquillamino, donde los grupos alquilo pueden ser  
iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están  
fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis  
miembros, ciano, alquenilo, alquenilsulfonilo, haloalquenilo,  
20 alquenilcarbonilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxicarbonilo,  
haloalcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alcoxicarboniltio  
(alquiltio)carbonilo, alquil(tiocarbonilo), alquiltiotiocarbonilo,  
alqueniloxicarbonilo, alqueniltiotiocarbonilo, alquiniloxi-  
carbonilo, alquiniltiotiocarbonilo, alcoxioxalilo, alquil-  
25 carboniloxialcoxicarbonilo, aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo,

arilsulfonilalquenilo, ariloxicarbonilo, ariloxitiocarbonilo, ariltiotiocarbonilo o aralquilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, arilsulfonilalquenilo, ariloxicarbonilo, ariloxitiocarbonilo, ariltiotiocarbonilo, sustituido en un anillo aromático con uno a  
5 dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;

R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilo, formilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alcoxicarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcoxicarboniltio, alquilcarboniltio, alquiltio, hidroxilo, mercapto, alquenilo, alquinilo, ciano, amino, alquilamino, dialquilamino, donde los  
10 grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros, arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, sustituidos en el anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo, haloalcoxi, amino, alquilamino y  
15 dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; o

R<sup>4</sup> puede formar un anillo fundido al sustituyente R<sup>3</sup> cuando el sustituyente R<sup>3</sup> es arilo o heteroarilo, donde R<sup>4</sup> está  
25 seleccionado de -CH(R)-, -O-, -S-, -N(R)-, -C(=O)-, -O(C=O)-,

-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-, N(R)CH<sub>2</sub>-, -C(R)=N-, -N=C(R)-, -CH(R)O-,  
-OCH(R)-, -CH(R)S- y -SCH(R)-; o

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tomados juntos pueden formar un anillo de piridazinilo sustituido;

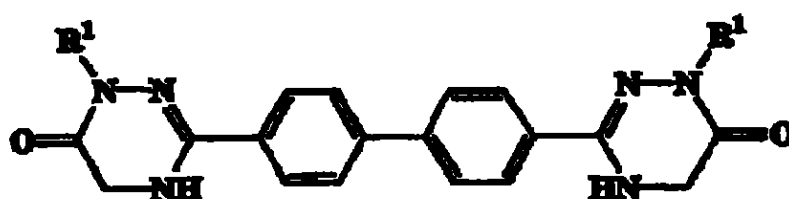
5 R<sup>5</sup> y X<sup>5</sup> tomados juntos pueden formar un carbonilo; o

X<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno, o tomado junto con R<sup>4</sup> forma una  
ligadura de nitrógeno a carbono;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, o NR;

R es H o alquilo, o un compuesto de la fórmula:

10



15 o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente  
aceptables, y sus mezclas; y un portador agronómicamente  
aceptable.

6.- La composición fungicida de conformidad con la  
reivindicación 5, caracterizada además porque:

20 R<sup>1</sup> es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4  
átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono,  
haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8  
átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono,  
cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquinilo de 2 a 8  
25 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo

- de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, donde los tres grupos
- 5       alquilo pueden ser iguales o diferentes; alcóxicarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alquilarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, alcóxicarbonil de 1 a 8 átomos de carbono-alquilo, fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de
- 10       alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes,
- 15       seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o benzofuranilo;
- 20       R<sup>3</sup> es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos
- 25       de carbono y haloalcóxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo,

- naftilo, o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres  
sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que  
consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,  
haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4  
5 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono,  
haloalquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a  
4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de  
carbono, nitro, ciano, dialquilamino de 1 a 4 átomos de  
carbono, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o  
10 diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman  
un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; quinolinilo,  
isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo o quinollnilo,  
isoquinolinilo, benzofuranilo o benzotienilo, sustituido con uno  
o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de  
15 halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4  
átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono,  
haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4  
átomos de carbono, nitro y ciano;
- R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, haloalquilo de 1 a 4 átomos de  
20 carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono,  
alquilcarbonil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4  
átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono,  
cicloalquil de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos  
de carbono, cicloalquilcarbonilo de 3 a 8 átomos de carbono,  
25 alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8

átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 8 átomos de carbono, fenilsulfonil-alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquenilcarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbono-metoxycarbonilo, alcoxycarboniltio de 1 a 4 átomos de carbono, (alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbonio-tiocarbonilo, alqueniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 8 átomos de carbonio-tiocarbonilo, alquiniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquiniltio de 2 a 8 átomos de carbonio-tiocarbonilo, alcoxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloxi de 1 a 4 átomos de carbonio-alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzilo, fenoxycarbonilo, fenoxitiocarbonilo, feniltiotiocarbonilo o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, benzilo, fenoxycarbonilo, fenoxitio-carbonilo, feniltiotiocarbonilo, sustituido en el anillo de fenilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

$R^5$  es un átomo de hidrógeno, alcoxide de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxide, mercapto, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres

sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

5 Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y

X<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno o tomado junto con R<sup>4</sup> forma una ligadura de nitrógeno a carbono.

7.- La composición fungicida de conformidad con la reivindicación 6, caracterizada además porque:

10 R<sup>1</sup> es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkylslll de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos  
15 de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;

R<sup>3</sup> es fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1  
20 a 2 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, alkylsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono-carboniltilio, alkeniloxycarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2  
25 a 6 átomos de carbono, alkiniloxycarbonilo de 2 a 4 átomos de

carbono o alcóxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y  
R<sup>6</sup> es un átomo de hidrógeno, alcoxí de 1 a 4 átomos de carbono o  
alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

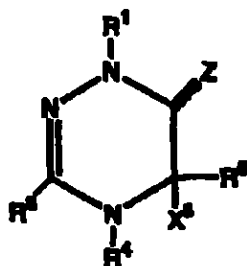
8.- La composición fungicida de conformidad con la  
relvindicación 7, caracterizada además porque:

R<sup>1</sup> es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10  
átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono,  
haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8  
átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-  
alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialkilslil de 1 a 4  
átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, donde  
los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;

R<sup>3</sup> es fenilo disustituido con halógeno, fenilo disustituido con  
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo disustituido con  
haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo sustituido con  
monohalomonoalquilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenilo  
sustituido con monohalomono(haloalquilo de 1 a 4 átomos de  
carbono);

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son hidrógeno.

9.- Una composición insecticida, caracterizada porque  
comprende una cantidad insecticidamente efectiva de un compuesto  
de la fórmula:



83200

5

en la que:

- R¹** es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, cicloalquilalquinilo, alquiltioalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, trialquilsililalquilo, donde los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, alquilcarbonilo, fenilo, naftilo o fenilo o naftilo sustituidos con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi; furilo, tienilo, tenilo o furilo, tienilo o tenilo sustituidos con halógeno en el anillo de furilo o de tienilo; benzotienilo o benzofuranilo;
- R³** es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenalquilo o fenalquilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi, arilo seleccionado de fenilo y fenilo sustituido con uno a cinco

25

sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo, haloalquilo, haloalcoxi, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, nitro, ciano, dialquilamino, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; heteroarilo seleccionado de furilo, quinolinilo, isoquinolinilo, benzofuranilo, benzotienilo y piridilo, y benzofuranilo, benzotienilo y piridilo sustituidos con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, haloalquilo, alquiltio, nitro y ciano;

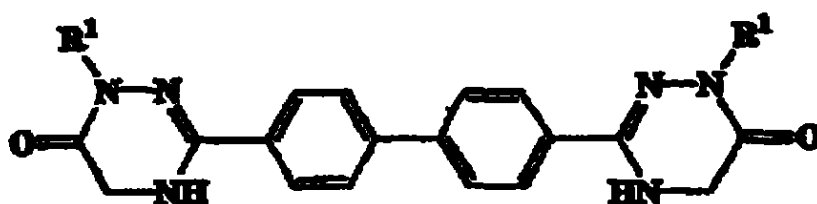
$R^4$  es un átomo de hidrógeno, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, ciano, alquenilo, alquinilo, haloalquinilo, haloalcoxycarbonilo, alcoxycarboniltio, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, alcoxloxalilo, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxialcoxycarbonilo, arilcarbonilo, arilsulfonilo, ariloxitiocarbonilo, o arilcarbonilo, arilsulfonilo, ariloxitiocarbonilo sustituidos en el anillo de arilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo; o tenilo o tenido sustituido en el anillo de tienilo con uno a dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno y alquilo;

$R^5$  es un átomo de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquilcarbonilo, formilo, alcoxi, alcoxycarbonilo, alcoxycarboniloxi, alquilcarboniloxi, alcoxycarboniltio, alquilcarboniltio, alquiltio,

mercapto, alquenilo, alquinilo, ciano, dialquilamino, arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi, arilcarboniltio, o arilo, aralquilo, ariloxi, ariltio, arilcarboniloxi o arilcarboniltio sustituidos en el anillo de arilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados del grupo que consiste de alquilo, halógeno, alcoxi, haloalquilo y haloalcoxi;

$X^5$  es un átomo de hidrógeno o, tomado junto con  $R^4$ , forma una llgadura de nitrógeno a carbono;

$Z$  es un átomo de oxígeno o un compuesto de la fórmula:



o sus sales, isómeros, tautómeros, enantiómeros agronómicamente activos y sus mezclas, y un portador agronómicamente aceptable; a condición de que, cuando  $R^1$  es un aralquilo o un heteroaralquilo,  $R^4$  no sea ciano, alquilsulfonilo, arilsulfonilo ni polihaloalquilo.

10.- La composición insecticida de conformidad con la reivindicación 9, caracterizada además porque:

$R^1$  es un átomo de hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8

- átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-  
alquilnlo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 7  
átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 7 átomos de carbono-  
alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 6  
5 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, donde  
los tres grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes;  
alquilcarbonilo de 1 a 8 átomos de carbono, fenilo o fenilo  
sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados  
independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4  
10 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de  
carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi  
de 1 a 4 átomos de carbono, fenalquilo de 1 a 4 átomos de  
carbono o fenalquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido en  
el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes seleccionados  
15 independientemente del grupo que consiste de alquilo de 1 a 4  
átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de  
carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi  
de 1 a 4 átomos de carbono, furilo, tienilo, benzotienilo o  
benzofuranilo;
- 20  $R^3$  es alquilo de 1 a 12 átomos de carbono, bencilo, fenetilo o  
bencilo o fenetilo sustituidos en el anillo de fenilo con uno a  
tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo  
que consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno,  
alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos  
25 de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o

- fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, nitro, ciano, dialquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, donde los grupos alquilo pueden ser iguales o diferentes, o junto con el nitrógeno al que están fijados, forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros; benzofuranilo, benzotienilo benzofuranilo o benzotienilo sustituidos con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;
- $R^4$  es un átomo de hidrógeno, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, haloalcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarboniloximetoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarboniltio de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquiniloxycarbonilo de 2 a 8 átomos de carbono o alcoxioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

- R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, ciano, fenilo o fenilo sustituido en el anillo de fenilo con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que
- 5 consiste de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono y haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono.

11.- La composición insecticida de conformidad con la reivindicación 10, caracterizada además porque:

- 10 **R<sup>1</sup>** es alquilo de 1 a 10 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 10 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquil de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, trialquilsilil de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, donde los tres grupos alquilo pueden
- 15 ser iguales o diferentes;
- R<sup>3</sup>** es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes, seleccionados independientemente del grupo que consiste de
- 20 halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, benzotienilo sustituido con uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente de halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono,
- 25 haloalcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono, nitro y ciano;

- R<sup>4</sup>** es un átomo de hidrógeno, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilto de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxycarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquiniloxycarbonilo de 2 a 4 átomos de carbono o alcioxalilo de 1 a 4 átomos de carbono; y
- R<sup>5</sup>** es un átomo de hidrógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono o alquiltio de 1 a 4 átomos de carbono.

12.- Un método para controlar un hongo, caracterizado porque comprende aplicar al hongo, al sitio del hongo o al medio de desarrollo de dicho hongo, una cantidad fungicidamente efectiva de una composición de acuerdo con la reivindicación 5, 6, 7 u 8.

13.- Un método para controlar un insecto, caracterizado porque comprende aplicar al insecto, al sitio del insecto o al medio de desarrollo de dicho insecto, una cantidad insecticidamente efectiva de una composición de acuerdo con la reivindicación 9, 10 u 11.

RESUMEN

00255

255

La presente invención se refiere a dihidrotriazinonas, triazinonas y compuestos relacionados, a composiciones que  
5 comprenden dichos compuestos y un portador agronómicamente aceptable, y a su uso como fungicidas e insecticidas de amplio espectro. La presente invención enseña también métodos para preparar esos compuestos, así como métodos de uso de los compuestos como fungicidas e insecticidas.



Folio 256

2020  
Bogotá DC

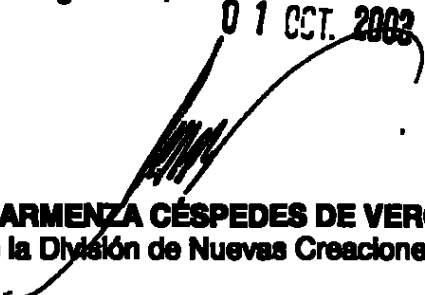
Doctor(a)  
EMILIO FERRERO  
Apoderado(a)  
DOW AGROSCIENCES LLC

|                    |                                   |                         |
|--------------------|-----------------------------------|-------------------------|
| <b>REFERENCIA:</b> | <b>Radicación No.</b>             | <b>03-35868</b>         |
|                    | <b>Solicitud Internacional</b>    | <b>PCT/US2001/50363</b> |
|                    | <b>Fecha inicio fase nacional</b> | <b>27/05/2003</b>       |
|                    | <b>Trámite</b>                    | <b>011</b>              |
|                    | <b>Evento</b>                     | <b>379</b>              |
|                    | <b>Actuación</b>                  | <b>416</b>              |
|                    | <b>Oficio No.</b>                 | <b>1174</b>             |
|                    | <b>Folios</b>                     | <b>001</b>              |

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Unica de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

**Cúmplase**  
Dado en Bogotá DC,

01 OCT. 2003

  
**ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL**  
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

202058