SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** _____

54. **TÍTULO** PIRAZOLES FUNGICIDAS

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** _____

71. **SOLICITANTE** E.I. Du Pont, de Nemours Company

DOMICILIO Wilmington, Delaware, Estados Unidos

74. **APODERADO** Alvaro Correa Ordoñez

22. **BOGOTÁ, D.C.,** Agosto 31, 2011

(FORMA P-10)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-112622- -00000-0000

Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

PETIT

ión

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

(1) SOLICITUD DE :

[X] Patente de Invención [ ] Patente de Modelo de Utilidad

[X] Capítulo I. [ ] Capítulo II.

(2) SOLICITANTE (71)

Nombre: **E. I. du Pont de Nemours and Company**

Dirección: 1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898, Estados Unidos de América

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América

Lugar de Constitución: Estados Unidos de América

Teléfono: Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C. [ ] NIT [ ]

C.E. [ ] Otro [ ]

Cual

Número

(3) REPRESENTANTE O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No. 10-62 Piso 6

Teléfono: 6341500 Fax: 3762211

E-Mail: office.bogota@bakermckenzie.com

IDENTIFICACION

C.C. [X] NIT [ ]

C.E. [ ] Otro [ ]

Cual

Número 79.143.366 Usaquén TP 20281

(4) INVENTOR (ES) (72)

Nombre: LONG, Jeffrey, Keith; HONG, Wonpyo; TAGGI, Andrew, Edmund

Dirección: 1210 Bruce Road Wilmington, Delaware 19803 (US); 8506 Marburg Manor Drive Lutherville, Maryland 21093 (US); 21 Tremont Court Newark, Delaware 19711 (US)

Nacionalidad o Domicilio: Estados Unidos de América

(5) PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/US2010/026003 Fecha 03-03-2010

Publicación Internacional No. WO2010/101973 Fecha 10-09-2010

(6) Título (54) PIRAZOLES FUNGICIDAS

(7) Clasificación Internacional (51) C07D 231/12; C07D 231/20; C07D 231/38; C07D 401/04; C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 403/12; C07D 407/12; C07D 409/04; C07D 417/12; A61K 31/4155

(8) Prioridad

SI [X] NO [ ]

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
US	03-03-2009	61/157,046
US	12-02-2010	61/304,053

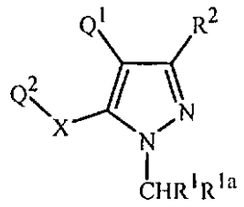
(9) Comprobante de pago No. 11-0064251 – 11-0064252 -11-0082437 – 11-0079812 – 11-0079742 – 11-0082404 – 11-0079855 – 11-0082436 **Fecha** 01-06-2011 – 18-08-2011 – 25-08-11

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

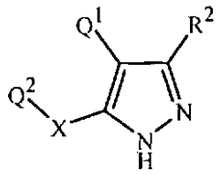
(10) **ANEXOS**

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- [X] Poderes, si fuere el caso
- [X] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- [ ] Declaraciones
- [X] Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- [X] Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- [ ] Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- [ ] Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- [ ] De ser el caso, copia del contrato de acceso
- [ ] De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- [ ] De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- [ ] Arte final 12 x 12
- [ ] De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- [ ] De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- [X] Otros: Extractos

(11) **FIGURA CARATERISTICA**



1



2

(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

FIRMA:

C.C. 79.143.366 de Usaquén T.P. 20.281

Instrucciones para la presentación de los anexos, ver reverso de esta página

RECIBO DE PAGO

20111011 3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0064251

Bogotá D.C., Julio 01 de 2011 - 14:27:42

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325065742	01/07/2011	95.266.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS	3.000.00	3.000.00
				$3.000.00

SON: **TRES MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

2011/011 4

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
-/-

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0064252

Bogotá D.C., Julio 01 de 2011 - 14:27:42

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	325065742	01/07/2011	95.266.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr UNDITARIO	Vr CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS	3.000.00	3.000.00
				$3.000.00

SON: **TRES MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

2011/013

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0082437

Bogotá D.C., Agosto 25 de 2011 - 06:44:36

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	412132932	23/08/2011	5.000.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-08 PRORROGA DE TERMINOS	1608 N.CREACION PRORROGA DE TERMINOS O PLAZO ADICIONAL	86.000.00	86.000.00
				$86.000.00

SON: **OCHENTA Y SEIS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

'20 11 / 0 13 6

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0079812

Bogotá D.C., Agosto 18 de 2011 - 16:59:22

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411692035	17/08/2011	82.279.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr UNDITARIO	Vr CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACION EN N CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODOFICA	118.000.00	118.000.00
				$118.000.00

SON: **CIENTO DIECIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

20111013 7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0079742

Bogotá D.C., Agosto 18 de 2011 - 16:59:22

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411692035	17/08/2011	82.279.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1642 S.DISTINTIVO CAMBIOO TITULARIDAT-TRANSFERENCIA INSCRIPC	361.000.00	361.000.00
				$361.000.00

SON: **TRESCIENTOS SESENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE*

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -08000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0082404

Bogotá D.C., Agosto 25 de 2011 - 06:44:36

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	412132932	23/08/2011	5.000.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS	8.000.00	8.000.00
				$8.000.00

SON: **OCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
- ******** -

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

2011/013 9

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0079855

Bogotá D.C., Agosto 18 de 2011 - 16:59:22

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411692035	17/08/2011	82.279.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	21 CERTIFICACIONES	14.000.00	14.000.00
				$14.000.00

SON: **CATORCE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
***

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

2011/013 10

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0082436

Bogotá D.C., Agosto 25 de 2011 - 06:44:36

RECIBIDO DE : BAKER & MCKENZIE NI 900.034.906

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	412132932	23/08/2011	5.000.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-08 PRORROGA DE TERMINOS	1608 N.CREACION PRORROGA DE TERMINOS O PLAZO ADICIONAL	86.000.00	86.000.00
				$86.000.00

SON: **OCHENTA Y SEIS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
-***-

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-112622- -00000-0000
Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

EXTRACTOS

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

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

PATENTE DE INVENCION ____ PCT X MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ___

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

(51) Clasificación Internacional: C07D 231/12; C07D 231/20; C07D 231/38; C07D 401/04; C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 403/12; C07D 407/12; C07D 409/04; C07D 417/12; A61K 31/4155

(71)Solicitante(s): **E. I. du Pont de Nemours and Company**

(72) Inventor(es): LONG, Jeffrey, Keith; HONG, Wonpyo; TAGGI, Andrew, Edmund

(30) Prioridad	(31) *No. Prioridad*	32) *Fecha*	(33) *País*
	61/157,046	03-03-2009	US
	61/304,053	12-02-2010	US

(85) Fecha inicio fase nacional: 03-10-2011

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 03-03-2010
No. de solicitud: PCT/US2010/026003

(87) Publicación internacional
Fecha: 10-09-2010
N° publicación: WO2010/101973

(54) Titulo: PIRAZOLES FUNGICIDAS

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

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

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION ___ PCT _X_ MODELO DE UTILIDAD ___ DISEÑO INDUSTRIAL ___

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

(51) Clasificación Internacional: C07D 231/12; C07D 231/20; C07D 231/38; C07D 401/04; C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 403/12; C07D 407/12; C07D 409/04; C07D 417/12; A61K 31/4155

(71)Solicitante(s) **E. I. du Pont de Nemours and Company**

(72) Inventor(es): LONG, Jeffrey, Keith; HONG, Wonpyo; TAGGI, Andrew, Edmund

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad	(31) *No. Prioridad*	32) *Fecha*	(33) *País*
	61/157,046	03-03-2009	US
	61/304,053	12-02-2010	US

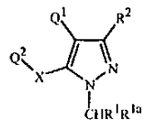
(85) Fecha límite inicio fase nacional: 03-10-2011

(86) Datos relativos a la presentación de la solic. PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 03-03-2010
No. de solicitud: PCT/US2010/026003

(87) Publicación internacional:
Fecha: 10-09-2010
No. Publicación: WO2010/101973

(54) Titulo: PIRAZOLES FUNGICIDAS

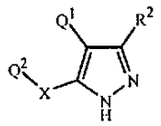
(57) Resumen: La presente invención describe compuestos de la Fórmula (1) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, JV-óxidos y sales de estos,



1

CONTINUA AL RESPALDO ...

en donde Q^1 es un anillo de fenilo, sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular biciclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;
Q^2 es un anillo de fenilo, un sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular biciclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;
X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S);
y R^1, R^{1a}, R^2, R^4, R^{15}, R^{16} y m son como los definidos en la descripción.
Además, la presente invención describe composiciones que contienen los compuestos de la Fórmula (1) y métodos para controlar enfermedades de las plantas causadas por un patógeno fúngico; el método comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto o una composición de la invención. Además, la presente invención describe compuestos de la Fórmula (2) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros y sales de estos,



2

en donde
X es NH; y
Q^1, Q^2 y R^2 son como los definidos para la Fórmula (1);
que son útiles como intermedios para preparar compuestos de la Fórmula (1).

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN PCT

(21) N° de solicitud:

22) Fecha de solicitud:

(30) Prioridad

(31) *No.*	32) *Fecha*	(33) *País*
61/157,046	03-03-2009	US
61/304,053	12-02-2010	US

(51) Int Cl: C07D 231/12; C07D 231/20; C07D 231/38; C07D 401/04; C07D 401/12; C07D 401/14; C07D 403/12; C07D 407/12; C07D 409/04; C07D 417/12; A61K 31/4155

(71)Solicitante(s) **E. I. du Pont de Nemours and Company**

(72) Inventor(es) LONG, Jeffrey, Keith; HONG, Wonpyo; TAGGI, Andrew, Edmund

(74) Apoderado: **ALVARO CORREA ORDOÑEZ**

(85) Fecha limite inicio fase nacional: 03-10-2011

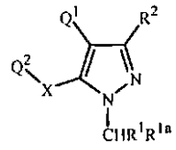
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 03-03-2010
No. de solicitud PCT/US2010/026003

(87) Publicación internacional
Fecha: 10-09-2010
N° publicación: WO2010/101973

(54) Titulo: PIRAZOLES FUNGICIDAS

RESUMEN:

La presente invención describe compuestos de la Fórmula (1) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, JV-óxidos y sales de estos,



1

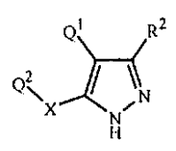
en donde Q^1 es un anillo de fenilo, sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;

Q^2 es un anillo de fenilo, un sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;

X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S);

y R^1, R^{1a}, R^2, R^4, R^{15}, R^{16} y m son como los definidos en la descripción.

Además, la presente invención describe composiciones que contienen los compuestos de la Fórmula (1) y métodos para controlar enfermedades de las plantas causadas por un patógeno fúngico; el método comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto o una composición de la invención. Además, la presente invención describe compuestos de la Fórmula (2) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros y sales de estos,



2

en donde

X es NH; y

Q^1, Q^2 y R^2 son como los definidos para la Fórmula (1);

que son útiles como intermedios para preparar compuestos de la Fórmula (1).

COPIA SOLICITUD
INTERNACIONAL

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

(43) International Publication Date
10 September 2010 (10.09.2010)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2010/101973 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 231/12 (2006.01) *C07D 403/12* (2006.01)
C07D 231/20 (2006.01) *C07D 407/12* (2006.01)
C07D 231/38 (2006.01) *C07D 409/04* (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01) *C07D 417/12* (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) *A61K 31/4155* (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/US2010/026003

(22) International Filing Date:
3 March 2010 (03.03.2010)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
61/157,046 3 March 2009 (03.03.2009) US
61/304,053 12 February 2010 (12.02.2010) US

(71) Applicant *(for all designated States except US)*: **E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY** [US/US]; 1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898 (US).

(72) Inventors; and
(75) Inventors/Applicants *(for US only)*: **LONG, Jeffrey, Keith** [US/US]; 1210 Bruce Road, Wilmington, Delaware 19803 (US). **HONG, Wonpyo** [KR/US]; 8506 Marburg Manor Drive, Lutherville, Maryland 21093 (US). **TAGGI, Andrew, Edmund** [US/US]; 21 Tremont Court, Newark, Delaware 19711 (US).

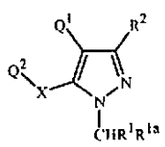
(74) Agent: **HEISER, David, E.**; E. I. du Pont de Nemours and Company, Legal Patent Records Center, 4417 Lancaster Pike, Wilmington, Delaware 19805 (US).

(81) Designated States *(unless otherwise indicated, for every kind of national protection available)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

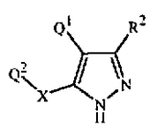
(84) Designated States *(unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:
— *with international search report (Art. 21(3))*

(54) Title: FUNGICIDAL PYRAZOLES



(1)



(2)

(57) Abstract: Disclosed are compounds of Formula (1), including all geometric and stereoisomers, JV-oxides, and salts thereof, wherein Q1 is a phenyl ring, naphthalenyl ring system, a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each as described with optional substituents as defined in the disclosure; Q2 is a phenyl ring, a naphthalenyl ring system, a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or fully unsaturated heterocyclic ring, or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each as described with optional substituents as defined in the disclosure; X is O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(O) or C(=S); and R^1, R^{1a}, R^2, R^4, R^{15}, R^{16} and m are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula (1) and methods for controlling plant disease caused by a fungal pathogen comprising applying an effective amount of a compound or a composition of the invention. Also disclosed are compounds of Formula (2), including all geometric and stereoisomers, and salts thereof, wherein X is NH; and Q^1, Q^2 and R^2 are as defined for Formula (1); which are useful as intermediates for preparing compounds of Formula (1).

WO 2010/101973 A1

TITLE

FUNGICIDAL PYRAZOLES

FIELD OF THE INVENTION

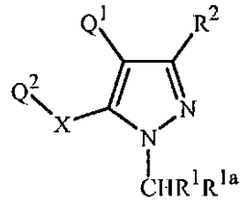
This invention relates to certain pyrazoles, their *N*-oxides, salts and compositions, and methods of their use as fungicides.

BACKGROUND OF THE INVENTION

The control of plant diseases caused by fungal plant pathogens is extremely important in achieving high crop efficiency. Plant disease damage to ornamental, vegetable, field, cereal, and fruit crops can cause significant reduction in productivity and thereby result in increased costs to the consumer. Many products are commercially available for these purposes, but the need continues for new compounds which are more effective, less costly, less toxic, environmentally safer or have different sites of action. JP09208620 discloses *N*–phenylpyrazolylamine and *N*-pyridylpyrazolylamine derivatives as insecticides, herbicides and fungicides; however the fungicides of the present invention are not disclosed in this publication.

SUMMARY OF THE INVENTION

This invention is directed to compounds of Formula **1** (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides, and salts thereof, agricultural compositions containing them and their use as fungicides:



1

wherein

Q^1 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6

alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members;

Q^2 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members; or C_1–C_{12} alkyl, C_2–C_{12} alkenyl, C_2–C_{12} alkynyl, C_3–C_{12} cycloalkyl or C_3–C_{12} cycloalkenyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3;

X is O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) or C(=S);

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl; or

R^1 is phenyl optionally substituted with up to 3 R^8; or a five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members;

R^{1a} is H; or

R^{1a} and R^1 are taken together with the carbon atom to which they are attached to form a cyclopropyl ring optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, halogen, cyano, cyanomethyl, halomethyl, hydroxymethyl, methoxy or methylthio; or cyclopropyl optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, formylamino, C_2–C_3 alkylcarbonylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_1–C_2 alkylsulfonyloxy, C_1–C_2

haloalkylsulfonyloxy, C_3–C_4 cycloalkyl, C_3–C_7 cycloalkoxy, C_4–C_6 alkylcycloalkyl, C_4–C_6 cycloalkylalkyl, C_3–C_7 halocycloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, hydroxy, formyl, C_2–C_3 alkylcarbonyl, C_2–C_3 alkylcarbonyloxy, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ or -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_2–C_5 alkenyl, C_3–C_5 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$, $-S(=O)_tR^{10}$, $-(C=W)R^{11}$, NH_2 or OR^{21}; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

R^6 and R^7 are independently selected from H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_3–C_7 cycloalkyl, C_4–C_8 cycloalkylalkyl and C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting ring nitrogen atom, selected from carbon atoms and optionally up to one ring member selected from O, $S(O)_n$ and NR^{13};

each R^8, R^{9a} and R^{9b} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ and $S(O)_2CH_3$;

R^{10} is C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

each R^{11} is independently C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_7 alkoxyalkyl, C_2–C_7 alkylaminoalkyl, C_2–C_8 dialkylaminoalkyl, C_1–C_6 alkylthio or C_2–C_7 alkylthioalkyl;

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy, C_1–C_4 haloalkoxy, C_1–C_4 alkylthio, C_1–C_4 alkylsulfinyl, C_1–C_4 alkylsulfonyl or cyano;

R^{13} is H, C_1–C_3 alkyl or C_2–C_3 haloalkyl;

each R^{14} is independently H, cyano, C_1–C_3 alkyl or C_1–C_3 haloalkyl;

R^{15} is H, C_1–C_4 alkyl or OR^{18};

R^{16} is C_1–C_4 alkyl or OR^{18}; or

R^{15} and R^{16} are taken together as $-OCH_2CH_2O-$;

each R^{18} is independently H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$ or $-(C=W)R^{11}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

each R^{19} and R^{20} is independently H or CH_3;

R^{21} is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$ or $-(C=W)R^{11}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

each U is independently O, $S(=O)_w$, NR^{22} or a direct bond;

each V is independently C_1–C_6 alkylene, C_2–C_6 alkenylene, C_3–C_6 alkynylene, C_3–C_6 cycloalkylene or C_3–C_6 cycloalkenylene, wherein up to 3 carbon atoms are independently selected from C(=O), each optionally substituted with up to 5

substituents independently selected from halogen, cyano, nitro, hydroxy, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_1–C_6 alkoxy and C_1–C_6 haloalkoxy;

each T is independently cyano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} or $S(=O)_yR^{25}$

each R^{22} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl); or

a pair of R^{23a} and R^{23b} attached to the same nitrogen atom are taken together with the nitrogen atom to form a 3- to 6-membered heterocyclic ring, the ring optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^{26};

each R^{24} and R^{25} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{26} is independently halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_1–C_6 alkoxy;

each W is independently O or S;

each M^+ is independently a cation;

m is 0, 1 or 2;

n is 0, 1 or 2;

t is 0, 1 or 2;

each u and v are independently 0, 1 or 2 in each instance of $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, provided that the sum of u and v is 0, 1 or 2;

each w is independently 0, 1 or 2; and

each y is independently 0, 1 or 2;

provided that:

when Q^2 is a phenyl ring substituted on at least one ortho position with a substituent selected from -U-V-T wherein U is a direct bond, V is C(=O) and T is $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24}, then X is other than NR^4.

More particularly, this invention pertains to a compound of Formula 1 (including all geometric and stereoisomers), an *N*-oxide or a salt thereof.

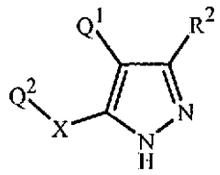
This invention also relates to a fungicidal composition comprising a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or a salt thereof, and at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

This invention also relates to a fungicidal composition comprising: (a) a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or a salt thereof, and (b) at least one other fungicide (e.g., at least one other fungicide having a different site of action).

This invention further relates to a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of the invention (e.g., as a composition described herein).

This invention also relates to a composition comprising a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or a salt thereof, and at least one invertebrate pest control compound or agent.

The invention also relates to compounds of Formula **2** (including all geometric and stereoisomers) and salts thereof



2

wherein

X is NH; and

Q^1, Q^2 and R^2 are as defined above for Formula **1**;

provided that:

(a) when Q^2 is a phenyl ring substituted on at least one ortho position with a substituent selected from -U-V-T wherein U is a direct bond and T is $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24}, then V is other than C(=O); and

(b) when Q^1 is phenyl and Q^2 is 4-(trifluoromethyl)phenyl, then R^2 is other than methyl;

and to use of said compounds as intermediates for preparing compounds of Formula **1**. More particularly, the present invention pertains to a compound of Formula **2** or a salt thereof.

DETAILS OF THE INVENTION

As used herein, the terms "comprises," "comprising," "includes," "including," "has," "having," "contains", "containing," "characterized by" or any other variation thereof, are intended to cover a non-exclusive inclusion, subject to any limitation explicitly indicated. For example, a composition, mixture, process or method that comprises a list of elements is not necessarily limited to only those elements but may include other elements not expressly listed or inherent to such composition, mixture, process or method.

The transitional phrase "consisting of" excludes any element, step, or ingredient not specified. If in the claim, such would close the claim to the inclusion of materials other than those recited except for impurities ordinarily associated therewith. When the phrase "consisting of" appears in a clause of the body of a claim, rather than immediately following the preamble, it limits only the element set forth in that clause; other elements are not excluded from the claim as a whole.

The transitional phrase "consisting essentially of" is used to define a composition or method that includes materials, steps, features, components, or elements, in addition to those literally disclosed, provided that these additional materials, steps, features, components, or elements do not materially affect the basic and novel characteristic(s) of the claimed invention. The term "consisting essentially of" occupies a middle ground between "comprising" and "consisting of".

Where applicants have defined an invention or a portion thereof with an open-ended term such as "comprising," it should be readily understood that (unless otherwise stated) the description should be interpreted to also describe such an invention using the terms "consisting essentially of" or "consisting of."

Further, unless expressly stated to the contrary, "or" refers to an inclusive or and not to an exclusive or. For example, a condition A or B is satisfied by any one of the following: A is true (or present) and B is false (or not present), A is false (or not present) and B is true (or present), and both A and B are true (or present).

Also, the indefinite articles "a" and "an" preceding an element or component of the invention are intended to be nonrestrictive regarding the number of instances (i.e. occurrences) of the element or component. Therefore "a" or "an" should be read to include one or at least one, and the singular word form of the element or component also includes the plural unless the number is obviously meant to be singular.

As referred to in the present disclosure and claims, "plant" includes members of Kingdom Plantae, particularly seed plants (Spermatopsida), at all life stages, including young plants (e.g., germinating seeds developing into seedlings) and mature, reproductive stages (e.g., plants producing flowers and seeds). Portions of plants include geotropic members typically growing beneath the surface of the growing medium (e.g., soil), such as roots, tubers, bulbs and corms, and also members growing above the growing medium, such as foliage (including stems and leaves), flowers, fruits and seeds.

As referred to herein, the term "seedling", used either alone or in a combination of words means a young plant developing from the embryo of a seed.

As used herein, the term "alkylating agent" refers to a chemical compound in which a carbon-containing radical is bound through a carbon atom to leaving group such as halide or sulfonate, which is displaceable by bonding of a nucleophile to said carbon atom. Unless otherwise indicated, the term "alkylating" does not limit the carbon-containing radical to

alkyl; the carbon-containing radicals in alkylating agents include the variety of carbon-bound substituent radicals specified for R^1.

Generally when a molecular fragment (i.e. radical) is denoted by a series of atom symbols (e.g., C, H, N, O, S) the implicit point or points of attachment will be easily recognized by those skilled in the art. In some instances herein, particularly when alternative points of attachment are possible, the point or points of attachment may be explicitly indicated by a hyphen ("-"). For example, "-SCN" indicates that the point of attachment is the sulfur atom (i.e. thiocyanato, not isothiocyanato).

In the above recitations, the term "alkyl", used either alone or in compound words such as "alkylthio" or "haloalkyl" includes straight-chain or branched alkyl, such as, methyl, ethyl, *n*-propyl, *i*-propyl, or the different butyl, pentyl or hexyl isomers. "Alkenyl" includes straight-chain or branched alkenes such as ethenyl, 1-propenyl, 2-propenyl, and the different butenyl isomers. "Alkenyl" also includes polyenes such as 1,2-propadienyl. "Alkynyl" includes straight-chain or branched alkynes such as ethynyl, 1-propynyl, 2-propynyl and the different butynyl isomers. "Alkenylene" denotes a straight-chain or branched alkenediyl containing one olefinic bond. Examples of "alkenylene" include CH=CH, CH_2CH=CH, CH=$C(CH_3)$. "Alkynylene" denotes a straight-chain or branched alkynediyl containing one triple bond. Examples of "alkynylene" include $CH_2C{\equiv}C$, $C{\equiv}CCH_2$ and the different butynylene, pentynylene and hexynylene isomers.

"Alkoxy" includes, for example, methoxy, ethoxy, *n*-propyloxy, isopropyloxy and the different butoxy, pentoxy and hexyloxy isomers. "Alkoxyalkyl" denotes alkoxy substitution on alkyl. Examples of "alkoxyalkyl" include CH_3OCH_2, $CH_3OCH_2CH_2$, $CH_3CH_2OCH_2$, $CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$ and $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. "Alkylthio" includes branched or straight-chain alkylthio moieties such as methylthio, ethylthio, and the different propylthio, butylthio, pentylthio and hexylthio isomers. "Alkylsulfinyl" includes both enantiomers of an alkylsulfinyl group. Examples of "alkylsulfinyl" include $CH_3S(O)$-, $CH_3CH_2S(O)$-, $CH_3CH_2CH_2S(O)$-, $(CH_3)_2CHS(O)$- and the different butylsulfinyl isomers. Examples of "alkylsulfonyl" include $CH_3S(O)_2$-, $CH_3CH_2S(O)_2$-, $CH_3CH_2CH_2S(O)_2$-, $(CH_3)_2CHS(O)_2$-, and the different butylsulfonyl isomers. "Alkylthioalkyl" denotes alkylthio substitution on alkyl. Examples of "alkylthioalkyl" include CH_3SCH_2, $CH_3SCH_2CH_2$, $CH_3CH_2SCH_2$, $CH_3CH_2CH_2CH_2SCH_2$ and $CH_3CH_2SCH_2CH_2$. "(Alkylthio)carbonyl" denotes a straight-chain or branched alkylthio group bonded to a C(=O) moiety. Examples of "(alkylthio)carbonyl" include $CH_3SC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2SC(=O)$ and $(CH_3)_2CHSC(=O)$. "Alkoxy(thiocarbonyl)" denotes a straight-chain or branched alkoxy group bonded to a C(=S) moiety. Examples of "alkoxy(thiocarbonyl)" include $CH_3OC(=S)$, $CH_3CH_2CH_2OC(=S)$ and $(CH_3)_2CHOC(=S)$. "Alkylaminoalkyl" denotes a straight-chain or branched alkyl moieties bonded to a nitrogen atom of an amino(straight-chain or branched)alkyl moiety. Examples of "alkylaminoalkyl" include CH_3NHCH_2-,

$(CH_3)_2CHNHCH_2$- and $CH_3NHCH(CH_3)$-. "Dialkylaminoalkyl" denotes two independent straight-chain or branched alkyl moieties bonded to a nitrogen atom of an amino(straight-chain or branched)alkyl moiety. Examples of "dialkylaminoalkyl" include $(CH_3)_2NCH_2$-, $(CH_3)_2CH(CH_3)NCH_2$- and $(CH_3)_2NCH(CH_3)$-. The term "alkylcarbonylamino" denotes alkyl bonded to a C(=O)NH moiety. Examples of "alkylcarbonylamino" include $CH_3CH_2C(=O)NH$ and $CH_3CH_2CH_2C(=O)NH$.

"Cycloalkyl" includes, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl. The term "alkylcycloalkyl" denotes alkyl substitution on a cycloalkyl moiety and includes, for example, ethylcyclopropyl, *i*-propylcyclobutyl, 3-methylcyclopentyl and 4-methylcyclohexyl. The term "cycloalkylalkyl" denotes cycloalkyl substitution on an alkyl moiety. Examples of "cycloalkylalkyl" include cyclopropylmethyl, cyclopentylethyl, and other cycloalkyl moieties bonded to straight-chain or branched alkyl groups. The term "cycloalkoxy" denotes cycloalkyl linked through an oxygen atom such as cyclopentyloxy and cyclohexyloxy. "Cycloalkenyl" includes carbocyclic rings that contain only one double bond such as cyclopentenyl and cyclohexenyl, as well as carbocyclic rings with more than one double bond such as 1,3- and 1,4-cyclohexadienyl, but are not aromatic. "Cycloalkylcarbonyl" denotes cycloalkyl bonded to a C(=O) group including, for example, cyclopropylcarbonyl and cyclopentylcarbonyl. The term "cycloalkoxycarbonyl" means cycloalkoxy bonded to a C(=O) group, for example, cyclopropyloxycarbonyl and cyclopentyloxycarbonyl. The term"cycloalkylene" denotes a cycloalkanediyl ring. Examples of "cycloalkylene" include cyclopropylene, cyclobutylene, cyclopentylene and cyclohexylene. The term"cycloalkenylene" denotes a cycloalkenediyl ring containing one olefinic bond. Examples of "cycloalkenylene" include cylopropenediyl and cyclpentenediyl.

The term "halogen", either alone or in compound words such as "haloalkyl", or when used in descriptions such as "alkyl substituted with halogen" includes fluorine, chlorine, bromine or iodine. Further, when used in compound words such as "haloalkyl", or when used in descriptions such as "alkyl substituted with halogen" said alkyl may be partially or fully substituted with halogen atoms which may be the same or different. Examples of "haloalkyl" or "alkyl substituted with halogen" include F_3C-, $ClCH_2$-, CF_3CH_2- and CF_3CCl_2-. The terms "halocycloalkyl", "haloalkoxy", "haloalkylthio", and the like, are defined analogously to the term "haloalkyl". Examples of "haloalkoxy" include CH_2FO-, CHF_2O-, CF_3O-, CCl_3CH_2O-, $HCF_2CH_2CH_2O$- and CF_3CH_2O-. Examples of "fluoroalkoxy" include CH_2FO-, CHF_2O-, CF_3O- $HCF_2CH_2CH_2O$- and CF_3CH_2O-. Examples of "fluoromethoxy" include CH_2FO-, CHF_2O- and CF_3O-. Examples of "haloalkylthio" include CCl_3S-, CF_3S-, CCl_3CH_2S- and $ClCH_2CH_2CH_2S$-. Examples of "haloalkylsulfinyl" include $CF_3S(O)$-, $CCl_3S(O)$-, $CF_3CH_2S(O)$- and $CF_3CF_2S(O)$-. Examples of "haloalkylsulfonyl" include $CF_3S(O)_2$-, $CCl_3S(O)_2$-, $CF_3CH_2S(O)_2$- and $CF_3CF_2S(O)_2$-.

The total number of carbon atoms in a substituent group is indicated by the "C_i–C_j" prefix where i and j are numbers from 1 to 12. For example, C_1–C_4 alkylsulfonyl designates methylsulfonyl through butylsulfonyl; C_2 alkoxyalkyl designates CH_3OCH_2-; C_3 alkoxyalkyl designates, for example, $CH_3CH(OCH_3)$-, $CH_3OCH_2CH_2$- or $CH_3CH_2OCH_2$-; and C_4 alkoxyalkyl designates the various isomers of an alkyl group substituted with an alkoxy group containing a total of four carbon atoms, examples including $CH_3CH_2CH_2OCH_2$- and $CH_3CH_2OCH_2CH_2$-.

As used herein, the following definitions shall apply unless otherwise indicated. The term "optionally substituted" is used interchangeably with the phrase "substituted or unsubstituted" or with the term "(un)substituted." Unless otherwise indicated, an optionally substituted group may have a substituent at each substitutable position of the group, and each substitution is independent of the other.

The term "unsubstituted" in connection with a group such as a ring or ring system means the group does not have any substituents other than its one or more attachments to the remainder of Formula **1**. The term "optionally substituted" means that the number of substituents can be zero. Unless otherwise indicated, optionally substituted groups may be substituted with as many optional substituents as can be accommodated by replacing a hydrogen atom with a non-hydrogen substituent on any available carbon or nitrogen atom. The number of optional substituents may be restricted by an expressed limitation. For example, the phrase "optionally substituted with up to 3 substituents selected from R^{9a} on carbon ring members" means that 0, 1, 2 or 3 substituents can be present (if the number of potential connection points allows). Similarly, the phrase "optionally substituted with up to 5 substituents selected from R^3 on carbon ring members" means that 0, 1, 2, 3, 4 or 5 substituents can be present if the number of available connection points allows. When a range specified for the number of substituents (e.g., r being an integer from 0 to 4 or from 0 to 3 for 5- and 6-membered nitrogen-containing heterocycles in Exhibit A) exceeds the number of positions available for substituents on a ring (e.g., 2 positions available for $(R^a)_r$ on U-27 in Exhibit A), the actual higher end of the range is recognized to be the number of available positions.

When a compound is substituted with a substituent bearing a subscript that indicates the number of said substituents can exceed 1, said substituents (when they exceed 1) are independently selected from the group of defined substituents, e.g., $(R^3)_p$ in Table 1 where p is 0, 1, 2, 3, 4 or 5. When a group contains a substituent which can be hydrogen, for example R^1, R^4, R^5, R^6, R^7 or R^{13}, then when this substituent is taken as hydrogen, it is recognized that this is equivalent to said group being unsubstituted. When a variable group is shown to be optionally attached to a position, for example $(R^a)_r$ in H-23 of Exhibit 1, wherein r may be 0, then hydrogen may be at the position even if not recited in the variable

group definition. When one or more positions on a group are said to be "not substituted" or "unsubstituted", then hydrogen atoms are attached to take up any free valency.

The variables "m", "n", "t", "u", "v", "w" and "y" in the Summary of the Invention and corresponding parts of the patent specification relate to subscripts appearing to the right of atoms or other molecular fragments within parentheses and denote the integral number of instances present of the atoms or other molecular fragments within the parentheses. "m" relates to "$S(O)_m$", "n" relates to "$S(O)_n$", "t" relates to "$-S(=O)_tR^{10}$", "u" and "v" relate to "$S(=O)_u(=NR^{14})_v$", "w" relates to "$S(=O)_w$", and "y" relates to "$S(=O)_yR^{25}$. For example, "m" being 0, 1 or 2 means that "$S(O)_m$" can be "S", "S(O)" or "$S(O)_2$".

Unless otherwise indicated, a "ring" as a component of Formula **1** is carbocyclic or heterocyclic. The term "ring system" as a component of Formula **1** denotes two fused rings (e.g., a phenyl ring fused to a pyridinyl ring to form quinolinyl). The term "ring member" refers to an atom or other moiety (e.g., O, S(O), $S(O)_2$ or $S(=O)_u(=NR^{14})_v$) forming the backbone of a ring or ring system.

The term "carbocyclic ring" denotes a ring wherein the atoms forming the ring backbone are selected only from carbon. Unless otherwise indicated, a carbocyclic ring can be a saturated, partially unsaturated, or fully unsaturated ring. "Saturated carbocyclic" refers to a ring having a backbone consisting of carbon atoms linked to one another by single bonds; unless otherwise specified, the remaining carbon valences are occupied by hydrogen atoms.

The terms "heterocyclic ring" or "heterocycle" denote a ring or ring system in which at least one atom forming the ring backbone is not carbon, e.g., nitrogen, oxygen or sulfur. Typically a heterocyclic ring contains no more than 4 nitrogens, no more than 2 oxygens and no more than 2 sulfurs. Unless otherwise indicated, a heterocyclic ring can be a saturated, partially unsaturated, or fully unsaturated ring. The term "saturated heterocyclic ring" refers to a heterocyclic ring containing only single bonds between ring members. In regards to degree of saturation, "a partially unsaturated heterocyclic ring" is intermediate between a saturated heterocyclic ring and a fully unsaturated heterocyclic ring (which may be aromatic). Therefore, as referred to in the present disclosure and claims, the term "partially unsaturated heterocyclic ring" denotes a heterocyclic ring comprising at least one ring member bonded to an adjacent ring member through a double bond and which conceptually potentially accommodates a number of non-cumulated double bonds between adjacent ring members (i.e. in its fully unsaturated counterpart form) greater than the number of double bonds present (i.e. in its partially unsaturated form). When a fully unsaturated heterocyclic ring satisfies Hückel's rule, then said ring is also called a "heteroaromatic ring" or "aromatic heterocyclic ring". The terms "heteroaromatic ring system" and "heteroaromatic bicyclic ring system" denote a ring system in which at least one atom forming the ring backbone is not carbon, e.g., nitrogen, oxygen or sulfur, and at least one ring is aromatic. Unless

otherwise indicated, heterocyclic rings and ring systems can be attached through any available carbon or nitrogen by replacement of a hydrogen on said carbon or nitrogen.

"Aromatic" indicates that each of the ring atoms is essentially in the same plane and has a *p*-orbital perpendicular to the ring plane, and that (4n + 2) π electrons, where n is a positive integer, are associated with the ring to comply with Hückel's rule. The term "aromatic heterocyclic ring system" denotes a heterocyclic ring system in which at least one ring of the ring system is aromatic. The term "nonaromatic ring system" denotes a carbocyclic or heterocyclic ring system that may be fully saturated, as well as partially or fully unsaturated, provided that none of the rings in the ring system are aromatic. The term "four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring" refers to rings containing four to seven ring members and which do not satisfy Hückel's rule. This term (as used where R^6 and R^7 are taken together) is not limited by carbon atoms only and can include ring members selected from O, $S(O)_n$ and NR^{13}.

In the context of the present invention when an instance of Q^1, Q^2 or R^1 comprises a phenyl or a 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring, the ortho, meta and para positions of each ring is relative to the connection of the ring to the remainder of Formula **1**.

As noted above, Q^1, Q^2 and R^1 can be (among others) phenyl optionally substituted with one or more substituents selected from a group of substituents as defined in the Summary of the Invention. An example of phenyl optionally substituted with one to five substituents is the ring illustrated as U-57 in Exhibit A, wherein R^8 is as defined in the Summary of the Invention for R^8 and q is an integer from 0 to 5.

As noted above, Q^1 is, *inter alia*, a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon atom ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from any substituent defined in the Summary of the Invention for Q^1 (e.g., a Q^1 ring or ring system is optionally substituted with R^3 on carbon ring members and cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members). Similarly, Q^2 is, *inter alia*, a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon atom ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each

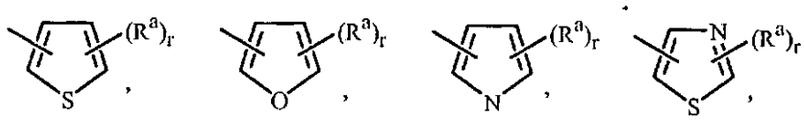
ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from any substituent defined in the Summary of the Invention for Q^2. As the substituents on the ring or ring system of Q^1 or Q^2 are optional, 0 to 5 substituents may be present, limited only by the number of available points of attachment. In these definitions of heterocyclic ring and heteroaromatic ring system, the ring members selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms are optional, provided at least one ring member is not carbon (e.g., N, O or S). The definition of $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ allows the up to 2 sulfur ring members, to be oxidized sulfur moieties (e.g., S(=O) or $S(=O)_2$) or unoxidized sulfur atoms (i.e. when u and v are both zero). The nitrogen atom ring members may be oxidized as *N*-oxides, because compounds relating to Formula 1 also include *N*-oxide derivatives. The up to 3 carbon atom ring members selected from C(=O) and C(=S) are in addition to the up to 4 heteroatoms selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms.

Also as noted above, R^1 can be (among others) 5- or 6-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle, which may be optionally substituted with one or more substituents selected from a group of substituents as defined in the Summary of Invention.

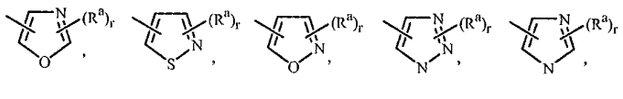
When R^1 is phenyl or a 5- or 6- membered nitrogen-containing aromatic heterocycle, it may be attached to the remainder of Formula 1 through any available carbon or nitrogen ring atom, unless otherwise described. Likewise, the ring or ring system of Q^1 or Q^2 may be attached to the remainder of Formula 1 through any available carbon or nitrogen ring atom, unless otherwise described.

Examples of a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring include the rings H-1 through H-39 illustrated in Exhibit 1, and examples of an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system include the ring systems B-1 through B-39 illustrated in Exhibit 2. In Exhibits 1 and 2 the variable R^a is any substituent as defined in the Summary of the Invention for Q^1, Q^2 or R^1 (e.g., a Q^1 ring or ring system is optionally substituted with R^3 on carbon ring members and cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members) and r is an integer from 0 to 5 for Q^1 and Q^2 or from 0 to 3 for R^1, limited by the number of available positions on each depicted ring or ring system.

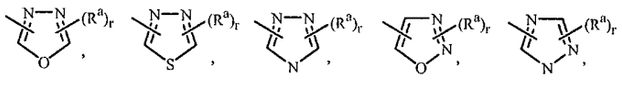
Exhibit 1



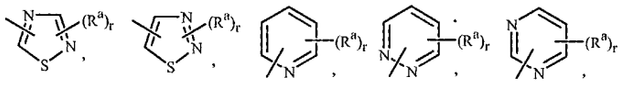
H-1 H-2 H-3 H-4



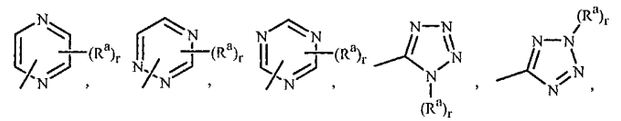
H-5 H-6 H-7 H-8 H-9



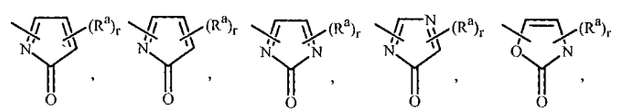
H-10 H-11 H-12 H-13 H-14



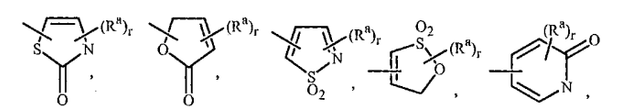
H-15 H-16 H-17 H-18 H-19



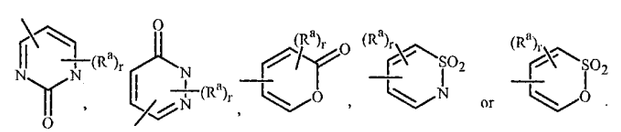
H-20 H-21 H-22 H-23 H-24



H-25 H-26 H-27 H-28 H-29

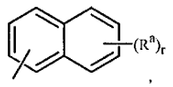


H-30 H-31 H-32 H-33 H-34

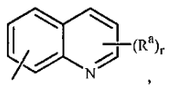


H-35 H-36 H-37 H-38 or H-39

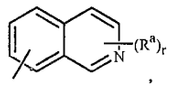
Exhibit 2



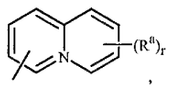
B-1



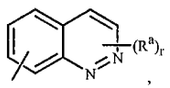
B-2



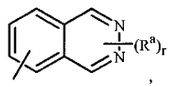
B-3



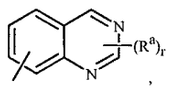
B-4



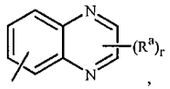
B-5



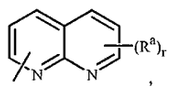
B-6



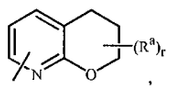
B-7



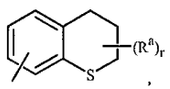
B-8



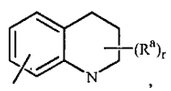
B-9



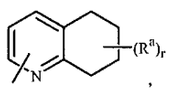
B-10



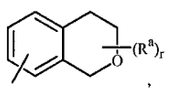
B-11



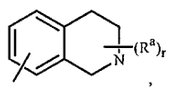
B-12



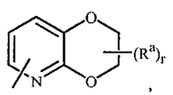
B-13



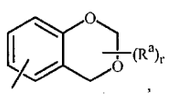
B-14



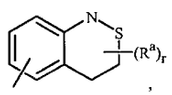
B-15



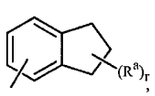
B-16



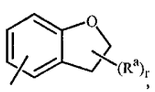
B-17



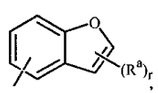
B-18



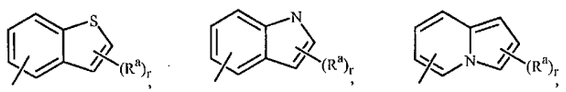
B-19



B-20



B-21

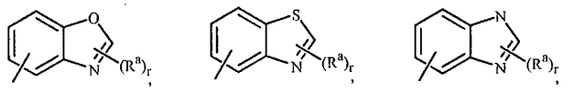


B-22

B-23



B-24

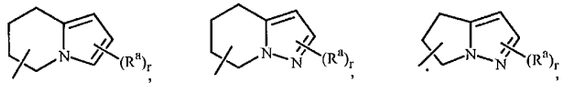


B-25

B-26



B-27

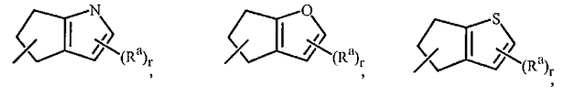


B-28

B-29



B-30

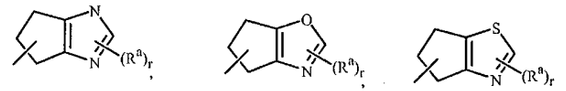


B-31

B-32



B-33

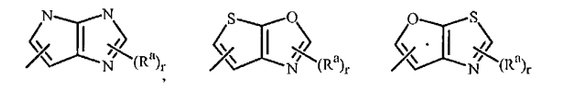


B-34

B-35



B-36



B-37

B-38

or

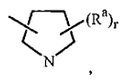


B-39

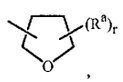
Examples of a saturated or partially unsaturated 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring include the rings P-1 through P-40 illustrated in Exhibit 3. In Exhibit 3 the variable R^a is any substituent as defined in the Summary of the Invention for Q^2 (e.g., a Q^2 ring is optionally substituted with R^3 on carbon ring members and cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl

on nitrogen atom ring members) and r is an integer from 0 to 5, limited by the number of available positions on each depicted ring or ring system.

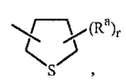
Exhibit 3



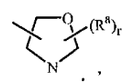
P-1



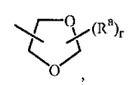
P-2



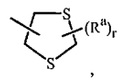
P-3



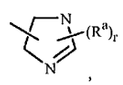
P-4



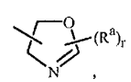
P-5



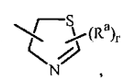
P-6



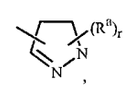
P-7



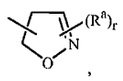
P-8



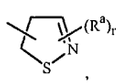
P-9



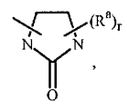
P-10



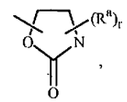
P-11



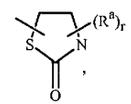
P-12



P-13



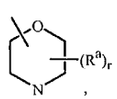
P-14



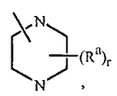
P-15



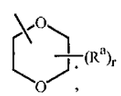
P-16



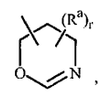
P-17



P-18



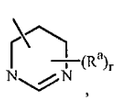
P-19



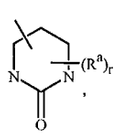
P-20



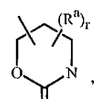
P-21



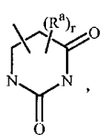
P-22



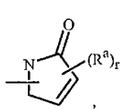
P-23



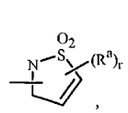
P-24



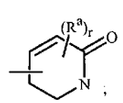
P-25



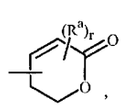
P-26



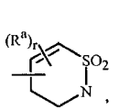
P-27



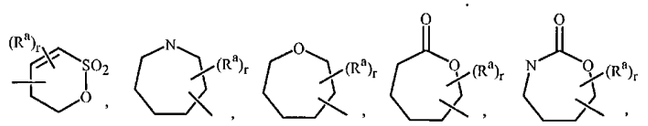
P-28



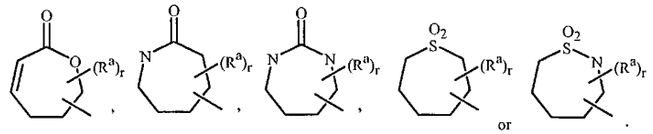
P-29



P-30



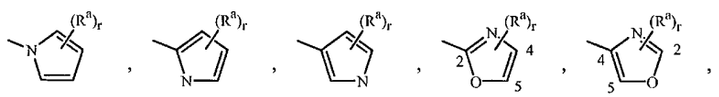
P-31 P-32 P-33 P-34 P-35



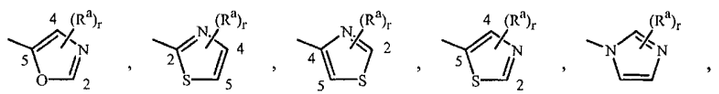
P-36 P-37 P-38 P-39 or P-40

Examples of a 5- or 6-membered nitrogen-containing heterocycle optionally substituted with from one or more substituents of particular note for Q^1, Q^2 and R^1 include the rings U-1 through U-56 illustrated in Exhibit A wherein R^a is any substituent as defined in the Summary of the Invention for Q^1 Q^2 and R^1, respectively (i.e. for Q^1 and Q^2: R^3 on carbon atom ring members, and the recited list of possible substituents on nitrogen atom ring members; and for R^1, R^{9a} on carbon ring members and R^{9b} on nitrogen ring members) and r is an integer ranging from 0 to 4 for Q^1 and Q^2 and from 0 to 3 for R^1, limited by the number of available positions on each U group. Note that some U groups can only be substituted with less than 4 R^a groups (e.g., U-4 through U-43 and U-47 through U-56). As U-24, U-25, U-31, U-32, U-33, U-34, U-35, U-36, U-37 and U-38 have only one available position, for these U groups, r is limited to the integers 0 or 1, and r being 0 means that the U group is unsubstituted and a hydrogen is present at the position indicated by $(R^a)_r$.

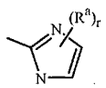
Exhibit A

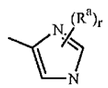


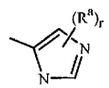
U-1 U-2 U-3 U-4 U-5

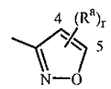


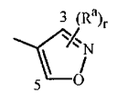
U-6 U-7 U-8 U-9 U-10

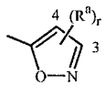

U-11 ,

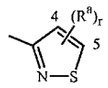

U-12 ,

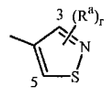

U-13 ,

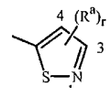

U-14 ,

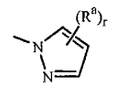

U-15 ,

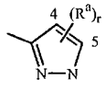

U-16 ,

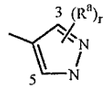

U-17 ,

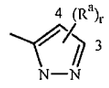

U-18 ,

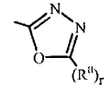

U-19 ,

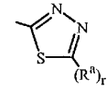

U-20 ,

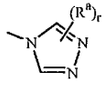

U-21 ,

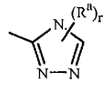

U-22 ,

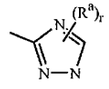

U-23 ,

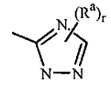

U-24 ,

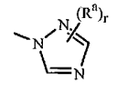

U-25 ,

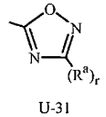

U-26 ,

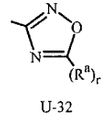

U-27 ,

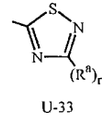

U-28 ,

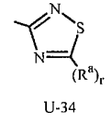

U-29 ,

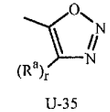

U-30 ,

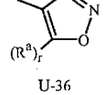

U-31 ,

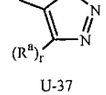

U-32 ,

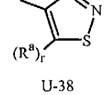

U-33 ,

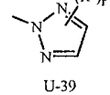

U-34 ,

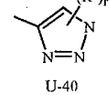

U-35 ,

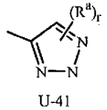

U-36 ,

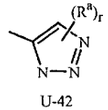

U-37 ,

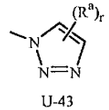

U-38 ,

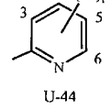

U-39 ,

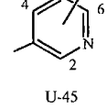

U-40 ,

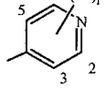

U-41 ,

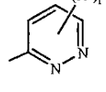

U-42 ,

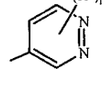

U-43 ,

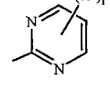

U-44 ,

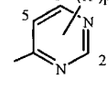

U-45 ,

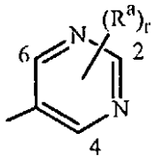

U-46 ,

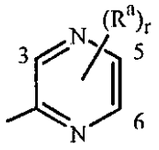

U-47 ,

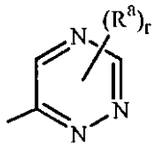

U-48 ,

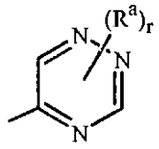

U-49 ,

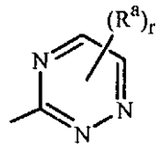

U-50 ,

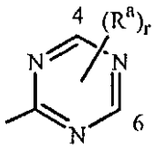

U-51

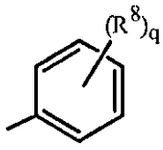

U-52


U-53


U-54


U-55


and

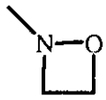

U-56 U-57

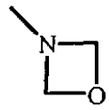
Although R^a groups are shown in the structures H-1 through H-39, B-1 through B-39, P-1 through P-40, and U-1 through U-57 in Exhibits 1 through 3 and Exhibit A, it is noted that they do not need to be present since they are optional substituents. The nitrogen atoms that require substitution to fill their valence are substituted with H or R^a. Note that when the attachment point between $(R^a)_r$ and the H, B, P or U group in Exhibits 1 through 3 and Exhibit A is illustrated as floating, $(R^a)_r$ can be attached to any available carbon atom or nitrogen atom of the H, B, P or U group. Note that when the attachment point on the H, B or P group in Exhibits 1 through 3 is illustrated as floating, the H, B or P group can be attached to the remainder of Formula 1 through any available carbon or nitrogen of the H, B or P group by replacement of a hydrogen atom. Of note are alternative depictions of the chemical structures shown in Exhibits 1 through 3 and Exhibit A in which the "R^a" variable substituent is replaced by "R^v", wherein the "v" superscript in "R^v" does not refer to the subscript variable "v" defined in the Summary of the Invention but instead differentiates "R^v" from other substituent variables beginning with "R".

Examples of where R^6 and R^7 are taken together to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring include the rings G-1 through G-28 as illustrated in Exhibit 4. Note that when R^6 and R^7 are taken together to form a ring comprising a ring selected from G-25 through G-28, G^2 is selected from O, $S(O)_n$ or NR^{13}. Note that when G^2 is N, the nitrogen atom can complete its valence by substitution with either H or the substituents corresponding to R^{13} as defined in the Summary of Invention.

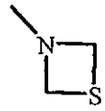
Exhibit 4

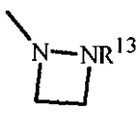
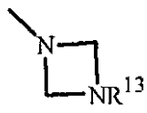
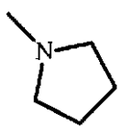
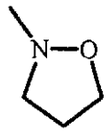
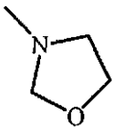
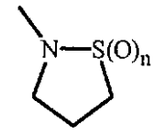
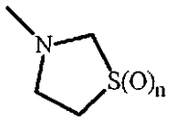
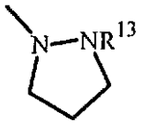
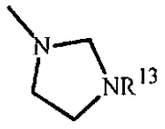
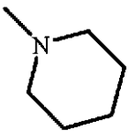
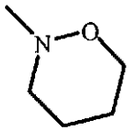
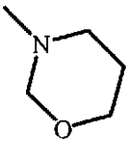
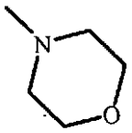
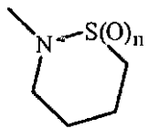
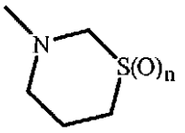
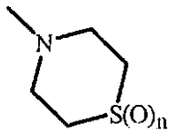
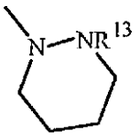
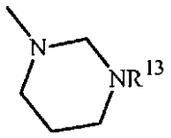
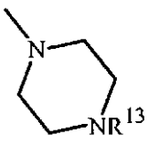
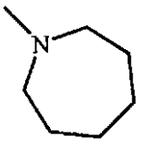
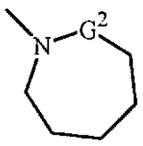
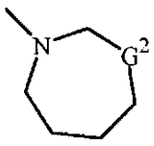
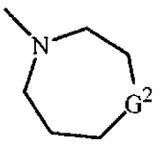

G-1


G-2


G-3


G-4


G-5


G-6 ,

G-7 ,

G-8 ,

G-9 ,

G-10 ,

G-11 ,

G-12 ,

G-13 ,

G-14 ,

G-15 ,

G-16 ,

G-17 ,

G-18 ,

G-19 ,

G-20 ,

G-21 ,

G-22 ,

G-23 ,

G-24 ,

G-25 ,

G-26 ,

G-27 and

G-28 .

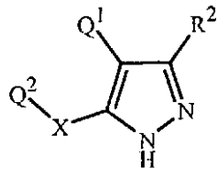
A wide variety of synthetic methods are known in the art to enable preparation of aromatic and nonaromatic heterocyclic rings and ring systems; for extensive reviews see the eight volume set of *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 and the twelve volume set of *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Compounds of this invention can exist as one or more stereoisomers. The various stereoisomers include enantiomers, diastereomers, atropisomers and geometric isomers. One skilled in the art will appreciate that one stereoisomer may be more active and/or may exhibit beneficial effects when enriched relative to the other stereoisomer(s) or when separated from the other stereoisomer(s). Additionally, the skilled artisan knows how to separate, enrich, and/or to selectively prepare said stereoisomers. The compounds of the invention may be present as a mixture of stereoisomers, individual stereoisomers or as an optically active form.

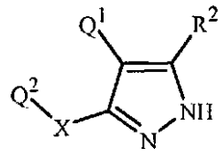
One skilled in the art will appreciate that not all nitrogen-containing heterocycles can form *N*-oxides since the nitrogen requires an available lone pair for oxidation to the oxide;

one skilled in the art will recognize those nitrogen-containing heterocycles which can form *N*-oxides. One skilled in the art will also recognize that tertiary amines can form *N*-oxides. Synthetic methods for the preparation of *N*-oxides of heterocycles and tertiary amines are very well known by one skilled in the art including the oxidation of heterocycles and tertiary amines with peroxy acids such as peracetic and *m*-chloroperbenzoic acid (MCPBA), hydrogen peroxide, alkyl hydroperoxides such as *t*-butyl hydroperoxide, sodium perborate, and dioxiranes such as dimethyldioxirane. These methods for the preparation of *N*-oxides have been extensively described and reviewed in the literature, see for example: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; and G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

One skilled in the art recognizes that some of the compounds disclosed herein can exist in equilibrium with one or more of their respective tautomeric counterparts. Unless otherwise indicated, reference to a compound by one tautomer description is to be considered to include all tautomers. For example, reference to the tautomeric form depicted by Formula **2**^{1} also includes the tautomic form depicted by Formula **2**^{2}.



2^1



2^2

One skilled in the art recognizes that because in the environment and under physiological conditions salts of chemical compounds are in equilibrium with their corresponding nonsalt forms, salts share the biological utility of the nonsalt forms. Thus a wide variety of salts of the compounds of Formula **1** are useful for control of plant diseases caused by fungal plant pathogens (i.e. are agriculturally suitable). The salts of the compounds of Formula **1** include acid-addition salts with inorganic or organic acids such as hydrobromic, hydrochloric, nitric, phosphoric, sulfuric, acetic, butyric, fumaric, lactic, maleic, malonic, oxalic, propionic, salicylic, tartaric, 4-toluenesulfonic or valeric acids.

Compounds selected from Formula **1**, geometric and stereoisomers, tautomers, *N*-oxides, and salts thereof, typically exist in more than one form, and Formula **1** thus includes all crystalline and non-crystalline forms of the compounds that Formula **1**

represents. Non-crystalline forms include embodiments which are solids such as waxes and gums as well as embodiments which are liquids such as solutions and melts. Crystalline forms include embodiments which represent essentially a single crystal type and embodiments which represent a mixture of polymorphs (i.e. different crystalline types). The term "polymorph" refers to a particular crystalline form of a chemical compound that can crystallize in different crystalline forms, these forms having different arrangements and/or conformations of the molecules in the crystal lattice. Although polymorphs can have the same chemical composition, they can also differ in composition due the presence or absence of co-crystallized water or other molecules, which can be weakly or strongly bound in the lattice. Polymorphs can differ in such chemical, physical and biological properties as crystal shape, density, hardness, color, chemical stability, melting point, hygroscopicity, suspensibility, dissolution rate and biological availability. One skilled in the art will appreciate that a polymorph of a compound represented by Formula 1 can exhibit beneficial effects (e.g., suitability for preparation of useful formulations, improved biological performance) relative to another polymorph or a mixture of polymorphs of the same compound represented by Formula 1. Preparation and isolation of a particular polymorph of a compound represented by Formula 1 can be achieved by methods known to those skilled in the art including, for example, crystallization using selected solvents and temperatures.

Embodiments of the present invention as described in the Summary of the Invention include (where Formula 1 as used in the following Embodiments includes *N*-oxides and salts, geometric isomers, stereoisomers and atropisomers thereof):

Embodiment 1. A compound of Formula 1 wherein X is O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$ or C(=O).

Embodiment 2. A compound of Formula 1 wherein X is O, $S(O)_m$, NR^4 or $CR^{15}R^{16}$.

Embodiment 3. A compound of Formula 1 wherein X is O, NR^4, $CR^{15}R^{16}$ or C(=O).

Embodiment 4. A compound of Formula 1 wherein X is O, NR^4 or $CR^{15}R^{16}$.

Embodiment 5. A compound of Formula 1 wherein X is O, $S(O)_m$ or NR^4.

Embodiment 6. A compound of Formula 1 wherein X is O or $S(O)_m$.

Embodiment 7. A compound of Formula 1 wherein X is O.

Embodiment 8. A compound of Formula 1 wherein X is NR^4.

Embodiment 9. A compound of Formula 1 wherein X is O or NR^4.

Embodiment 10. A compound of Formula 1 wherein X is $CR^{15}R^{16}$, C(=O) or C(=S).

Embodiment 11. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 10 wherein when Q^1 is a six-membered ring (e.g., phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl) and an R^3 substituent is located at a meta position (relative to the connection of the Q^1 ring to the remainder of Formula 1), then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano (-CN).

Embodiment 11a. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 11 wherein when Q^1 is a six-membered ring and an R^3 substituent is located at a meta position (relative to the connection of the Q^1 ring to the remainder of Formula 1), then said R^3 substituent is F.

Embodiment 12. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 11a wherein when Q^1 is a six-membered ring (e.g., phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl) substituted with only one R^3 substituent, then said R^3 substituent is attached at an ortho position (relative to the connection of the Q^1 ring to the remainder of Formula 1).

Embodiment 13. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 12 wherein Q^1 is phenyl, thienyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrimidinyl, naphthalenyl, quinolinyl, isoquinolinyl or quinoxalinyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 14. A compound of Embodiment 13 wherein Q^1 is phenyl, thienyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl or pyrimidinyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 15. A compound of Embodiment 14 wherein Q^1 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with from 1 to 4 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 16. A compound of Embodiment 15 wherein Q^1 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 17. A compound of Embodiment 16 wherein the substituents are located at the ortho and/or para positions (relative to the connection of the Q^1 ring to the remainder of Formula 1) of the phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl of Q^1.

Embodiment 18. A compound of Embodiment 16 or 17 wherein Q^1 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 19. A compound of Embodiment 18 wherein Q^1 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 20. A compound of Embodiment 19 wherein Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 21. A compound of Embodiment 20 wherein Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or

phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 22. A compound of Embodiment 21 wherein Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 23. A compound of Embodiment 21 wherein Q^1 is phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 24. A compound of Embodiment 21 wherein Q^1 is phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 25. A compound of Embodiment 18 wherein Q^1 is pyridinyl substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 26. A compound of Embodiment 25 wherein Q^1 is pyridinyl substituted with 1 or 2 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 27. A compound of Embodiment 26 wherein Q^1 is pyridinyl substituted with 1 substituent independently selected from R^3.

Embodiment 28. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 27 wherein when Q^2 is a six-membered ring (e.g., phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl) and an R^3 substituent is located at a meta position (relative to the connection of the Q^2 ring to the remainder of Formula 1), then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano (-CN).

Embodiment 29. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 28 wherein when Q^2 is a six-membered ring and an R^3 substituent is located at a meta position (relative to the connection of the Q^2 ring to the remainder of Formula 1), then said R^3 substituent is F.

Embodiment 30. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 29 wherein when Q^2 is a six-membered ring (e.g., phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl) substituted with only one R^3 substituent, then said R^3 substituent is attached at an ortho position (relative to the connection of the Q^2 ring to the remainder of Formula 1).

Embodiment 31. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 30 wherein Q^2 is phenyl, thienyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrimidinyl, naphthalenyl, quinolinyl, isoquinolinyl or quinoxalinyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 32. A compound of Embodiment 31 wherein Q^2 is phenyl, thienyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl or pyrimidinyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 33. A compound of Embodiment 32 wherein Q^2 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with from 1 to 4 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 34. A compound of any one of Embodiments 31 through 33 wherein Q^2 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 35. A compound of Embodiment 34 wherein the substituents are located at the ortho and/or para positions (relative to the connection of the Q^2 ring to the remainder of Formula 1) of the phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl of Q^2.

Embodiment 36. A compound of any one of Embodiments 34 or 35 wherein Q^2 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 37. A compound of Embodiment 36 wherein Q^2 is phenyl substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 38. A compound of Embodiment 37 wherein Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 39. A compound of Embodiment 38 wherein Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 40. A compound of Embodiment 38 wherein Q^2 is phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 41. A compound of Embodiment 38 wherein Q^2 is phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3.

Embodiment 42. A compound of Embodiment 36 wherein Q^2 is pyridinyl substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 43. A compound of Embodiment 42 wherein Q^2 is pyridinyl substituted with 1 or 2 subsituents independently selected from R^3.

Embodiment 44. A compound of Embodiment 43 wherein Q^2 is pyridinyl substituted with 1 substituent selected from R^3.

Embodiment 45. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 44 wherein at least one of Q^1 and Q^2 is phenyl optionally substituted with R^3 (e.g., optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3).

Embodiment 46. A compound of Embodiment 45 wherein at least one of Q^1 and Q^2 is phenyl substituted with 2, 3 or 4 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 47. A compound of Embodiment 46 wherein at least one Q^1 and Q^2 is phenyl substituted with 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 48. A compound of Embodiment 47 wherein each of Q^1 and Q^2 is phenyl substituted with 2 or 3 substituents independently selected from R^3.

Embodiment 49. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 48 wherein R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl; or R^1 is a five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members.

Embodiment 50. A compound of Embodiment 49 wherein R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, cyano, C_1–C_6 alkoxy or C_1–C_6 haloalkoxy; or R^1 is pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazolyl or oxazolyl, each optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members.

Embodiment 51. A compound of Embodiment 50 wherein R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl.

Embodiment 52. A compound of Embodiment 51 wherein R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl.

Embodiment 53. A compound of Embodiment 52 wherein R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl.

Embodiment 54. A compound of Embodiment 53 wherein R^1 is H, halogen or C_1–C_6 alkyl.

Embodiment 55. A compound of Embodiment 54 wherein R^1 is H or CH_3.

Embodiment 56. A compound of Embodiment 55 wherein R^1 is H.

Embodiment 57. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 56 wherein R^1 is other than an optionally substituted phenyl or an optionally substituted five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle.

Embodiment 58. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 50 wherein R^1 is other than H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl.

Embodiment 59. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 58 wherein R^{1a} is H.

Embodiment 60. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 59 wherein R^2 is CH_3, CH_2CH_3, halogen, cyano, cyanomethyl, monohalomethyl, hydroxymethyl, methoxy or methylthio; or cyclopropyl optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl.

Embodiment 61. A compound of Embodiment 60 wherein R^2 is CH_3, CH_2CH_3, Cl, Br or I.

Embodiment 62. A compound of Embodiment 61 wherein R^2 is CH_3, CH_2CH_3, Cl or Br.

Embodiment 63. A compound of Embodiment 62 wherein R^2 is CH_3, Cl or Br.

Embodiment 64. A compound of Embodiment 63 wherein R^2 is CH_3 or Cl.

Embodiment 65. A compound of Embodiment 64 wherein R^2 is CH_3.

Embodiment 66. A compound of Embodiment 62 wherein R^2 is Cl or Br.

Embodiment 67. A compound of Embodiment 66 wherein R^2 is Cl.

Embodiment 68. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 67 wherein R^5 is H or C_1–C_6 alkyl.

Embodiment 69. A compound of Embodiment 68 wherein R^5 is H, CH_3 or CH_2CH_3.

Embodiment 70. A compound of Embodiment 68 wherein R^5 is C_1–C_6 alkyl.

Embodiment 71. A compound of Embodiment 69 or 70 wherein R^5 is CH_3 or CH_2CH_3.

Embodiment 72. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 71 wherein when R^6 is separate (i.e. not taken together with R^7 to form a ring), then R^6 is H or C_1–C_6 alkyl.

Embodiment 73. A compound of Embodiment 72 wherein R^6 is H.

Embodiment 74. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 73 wherein when R^7 is separate (i.e. not taken together with R^6 to form a ring), then R^7 is H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_4–C_8 alkylcycloalkyl.

Embodiment 75. A compound of Embodiment 74 wherein R^7 is H or C_1–C_6 alkyl.

Embodiment 76. A compound of Embodiment 75 wherein R^7 is H.

Embodiment 77. A compound of Formula 1 or any one Embodiments 1 through 76 wherein when R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a nonaromatic heterocyclic ring, the ring contains ring members, in addition to the connecting nitrogen atom, selected from carbon atoms and up to one ring member selected from O and NR^{13}.

Embodiment 78. A compound of Embodiment 77 wherein when R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a nonaromatic heterocyclic ring, the ring is six-membered and contains one ring member selected from O and NR^{13} in addition to the connecting nitrogen atom and ring members selected from carbon atoms.

Embodiment 79. A compound of Embodiment 77 wherein R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a piperidine ring.

Embodiment 80. A compound of Embodiment 78 wherein R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a piperazine or morpholine ring.

Embodiment 81. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 80 wherein each R^8 is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano and nitro.

Embodiment 82. A compound of Embodiment 81 wherein each R^8 is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 alkoxy, cyano and nitro.

Embodiment 83. A compound of Embodiment 82 wherein each R^8 is independently Cl or F.

Embodiment 84. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 83 wherein each R^{9a} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano and nitro.

Embodiment 85. A compound of Embodiment 84 wherein each R^{9a} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 alkoxy, cyano and nitro.

Embodiment 86. A compound of Embodiment 85 wherein each R^{9a} is independently selected from Cl, F, CH_3, -OCH_3 and cyano.

Embodiment 87. A compound of Embodiment 86 wherein each R^{9a} is independently Cl or F.

Embodiment 88. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 87 wherein each R^{9b} is independently C_1–C_2 alkyl.

Embodiment 89. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 88 wherein each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_3–C_4 cycloalkyl, $C(=S)NH_2$ and -U-V-T.

Embodiment 90. A compound of Embodiment 89 wherein each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy and -U-V-T.

Embodiment 91. A compound of Embodiment 90 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, nitro, CH_3, CF_3, -OCH_3, -$OCHF_2$ and -U-V-T.

Embodiment 92. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 91 wherein at least one R^3 substituent on the ring or ring system of Q^1 or Q^2 is -U-V-T.

Embodiment 93. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 91 wherein each R^3 is other than -U-V-T.

Embodiment 94. A compound of Embodiment 89 wherein each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio,

C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl and C_3–C_4 cycloalkyl.

Embodiment 95. A compound of Embodiment 94 wherein each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy and C_1–C_3 haloalkoxy.

Embodiment 96. A compound of Embodiment 95 wherein each R^3 is independently selected from halogen, cyano, C_1–C_3 alkyl, C_1–C_3 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy and C_1–C_3 haloalkoxy.

Embodiment 97. A compound of Embodiment 96 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy and C_1–C_2 haloalkoxy.

Embodiment 98. A compound of Embodiment 97 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, methyl, C_1–C_2 alkoxy and fluoromethoxy.

Embodiment 99. A compound of Embodiment 98 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, cyano, methyl, C_1–C_2 alkoxy and fluoromethoxy.

Embodiment 100. A compound of Embodiment 95 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, nitro, CH_3, CF_3, -OCH_3 and -$OCHF_2$.

Embodiment 101. A compound of any one of Embodiments 89 through 98 or 100 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano and methoxy.

Embodiment 102. A compound of Embodiment 101 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, Br and cyano.

Embodiment 103. A compound of Embodiment 101 wherein each R^3 is independently selected from F, Cl, cyano and -OCH_3.

Embodiment 104. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 92 wherein each U is independently O or NR^{22}.

Embodiment 105. A compound of Embodiment 104 wherein each U is independently O or NH.

Embodiment 106. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 92 and 104 through 105 wherein each V is C_2–C_4 alkylene.

Embodiment 107. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 92 and 104 through 106 wherein each T is independently $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24}.

Embodiment 108. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 92 and 104 through 107 wherein each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl.

Embodiment 109. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 92 and 104 through 108 wherein each R^{24} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl.

Embodiment 110. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 109 wherein when an R^3 substituent attached to phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl of Q^1or Q^2 is other than F, Cl, Br, cyano, methyl, C_1–C_2 alkoxy and fluoromethoxy, then said R^3 substituent is attached at the para position (of the phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl ring).

Embodiment 111. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 110 wherein R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12}.

Embodiment 112. A compound of Embodiment 111 wherein R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl substituted with one R^{12}.

Embodiment 113. A compound of Embodiment 112 wherein R^4 is H, formyl, -CH_2OCH_3, cyclopropyl, -SCH_3, -SCF_3 or -CH_2CN.

Embodiment 114. A compound of Embodiment 113 wherein R^4 is H, formyl, cyclopropyl or -CH_2CN.

Embodiment 115. A compound of Embodiment 113 wherein R^4 is H, formyl, -CH_2OCH_3, cyclopropyl, -SCH_3 or -SCF_3.

Embodiment 116. A compound of Embodiment 115 wherein R^4 is H, formyl or cyclopropyl.

Embodiment 117. A compound of Embodiment 114 or 116 wherein R^4 is H.

Embodiment 118. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 117 wherein R^{13} is H or CH_3.

Embodiment 119. A compound of Embodiment 118 wherein R^{13} is CH_3.

Embodiment 120. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 119 wherein each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy or cyano.

Embodiment 121. A compound of Embodiment 120 wherein each R^{12} is independently cyclopropyl, -OCH_3 or cyano.

Embodiment 122. A compound of Embodiment 120 wherein each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl or C_1–C_4 alkoxy.

Embodiment 123. A compound of Embodiment 122 wherein each R^{12} is independently cyclopropyl or -OCH_3.

Embodiment 124. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 123 wherein R^{10} is CH_3, CH_2CH_3, CF_3 or CF_2CF_3.

Embodiment 125. A compound of Embodiment 124 wherein R^{10} is CH_3.

Embodiment 126. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 125 wherein R^{11} is C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 alkoxy or C_1–C_6 alkylthio.

Embodiment 127. A compound of Embodiment 126 wherein R^{11} is CH_3, CH_2CH_3, -OCH_3, -OCH_2CH_3, -SCH_3 or -SCH_2CH_3.

Embodiment 128. A compound of Embodiment 127 wherein R^{11} is CH_3, $-OCH_3$ or $-SCH_3$.

Embodiment 129. A compound of Formula 1 or any one of Embodiments 1 through 128 wherein R^{15} is H or CH_3.

Embodiment 130. A compound of Embodiment 129 wherein R^{15} is H.

Embodiment 131. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 130 wherein R^{16} is CH_3 or OR^{18}.

Embodiment 132. A compound of Embodiment 131 wherein R^{16} is OR^{18}.

Embodiment 133. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 132 wherein R^{18} is H.

Embodiment 134. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 133 wherein W is O.

Embodiment 135. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 134 wherein M^+ is a cation selected from sodium, potassium and lithium ions.

Embodiment 136. A compound of Embodiment 135 wherein M^+ is a cation selected from sodium and potassium ions.

Embodiment 137. A compound of Embodiment 136 wherein M^+ is a sodium ion.

Embodiment 138. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 137 wherein m is 0.

Embodiment 139. A compound of Formula **1** or any one of Embodiments 1 through 138 wherein n is 0.

Embodiments of this invention, including Embodiments 1–139 above as well as any other embodiments described herein, can be combined in any manner, and the descriptions of variables in the embodiments pertain not only to the compounds of Formula **1** but also to the starting compounds and intermediate compounds (e.g. compounds of Formula **2**) useful for preparing the compounds of Formula **1**. In addition, embodiments of this invention, including Embodiments 1–139 above as well as any other embodiments described herein, and any combination thereof, pertain to the compositions and methods of the present invention.

Combinations of Embodiments 1–139 are illustrated by:

Embodiment A. A compound of Formula **1** wherein

Q^1 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with from 1 to 4 substituents independently selected from R^3; provided that when an R^3 substituent is located at a meta position, then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano;

Q^2 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3, provided that when an R^3

substituent is located at a meta position, then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano;

X is O, NR^4, C(=O) or $CR^{15}R^{16}$;

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl;

R^{1a} is H;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, Cl or Br;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_3–C_4 cycloalkyl, $C(=S)NH_2$ and -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or $-SR^{10}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is C_1–C_6 alkyl;

R^6 is H or C_1–C_6 alkyl;

R^7 is H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting nitrogen atom, selected from carbon atoms and up to one ring member selected from O and NR^{13};

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy or cyano;

R^{13} is H or CH_3;

R^{15} is H or CH_3; and

R^{16} is OR^{18}.

Embodiment B. A compound of Embodiment A wherein

Q^1 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

R^1 is H, halogen or C_1–C_6 alkyl;

R^2 is CH_3, Cl or Br;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy and -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or $-SR^{10}$; or C_1–C_6 alkyl substituted with one R^{12};

each R^{12} is independently cyclopropyl, $-OCH_3$ or cyano;

R^{15} is H;

each U is independently O or NH;

each V is C_2–C_4 alkylene;

each T is independently $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24};

each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl; and

each R^{24} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl.

Embodiment C. A compound of Embodiment B wherein

at least one of Q^1 and Q^2 is phenyl substituted with 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

R^1 is H or CH_3;

R^2 is CH_3;

R^4 is H;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, C_1–C_3 alkyl, C_1–C_3 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy and C_1–C_3 haloalkoxy; and

R^{18} is H.

Embodiment D. A compound of Embodiment C wherein

Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

X is O, NR^4 or $CR^{15}R^{16}$;

R^1 is H;

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy and C_1–C_2 haloalkoxy; and

R^4 is H.

Embodiment E. A compound of Embodiment D wherein

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, methyl, C_1–C_2 alkoxy and fluoromethoxy.

Embodiment F. A compound of Embodiment E wherein

X is O or NH; and

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano and methoxy.

Specific embodiments include compounds of Formula **1** selected from the group consisting of:

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 18),

N-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 22),

4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-*N*-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 23),

4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 24),

N-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-4-(3,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 36),

4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 41),

4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzonitrile (Compound 45),

4-[[4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile (Compound 361),

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 172),

4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile (Compound 118),

3-chloro-4-[[4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile (Compound 358),

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-α-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 351),

N,4-bis(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 175),

N-(2-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 193),

N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 297),

N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 343),

N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 349),

N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 357),

3-chloro-4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile (Compound 139),

4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]amino]-3,5-difluoro-benzonitrile (Compound 91),

4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-2,5-difluoro-benzonitrile (Compound 148),

N-(2-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 87),

α,4-bis(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 352),

N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-amine (Compound 286),

N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 287),

N-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 368),

3-chloro-4-[5-[(2-chloro-4,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitrile (Compound 332),

3-chloro-4-[5-[(4-chloro-2,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitrile (Compound 336),

N-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 346),

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,4-dichloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 367),

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 369),

4-[[4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile (Compound 284),

N-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 265),

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 266),

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 364),

4-[[4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluoro-benzonitrile (Compound 232),

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-*N*-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 292),

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-*N*-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 360),

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 365),

3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile (Compound 372),

3-chloro-4-[[4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile (Compound 373),

N-(2,4-dichloro-6-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 374),

N-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 375),

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 376),

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 377),

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 378),

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 379),

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 380),

α-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 381),

4-[5-[(2-chloro-4,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-fluorobenzonitrile (Compound 382),

4-[5-[(4-chloro-2,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-fluorobenzonitrile (Compound 383),

α-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 384),

α-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 385), and

α-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 386).

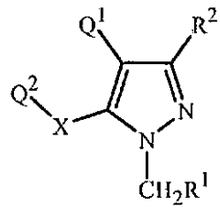
This invention provides a fungicidal composition comprising a compound of Formula 1 (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof), and at least one other fungicide. Of note as embodiments of such compositions are compositions comprising a compound corresponding to any of the compound embodiments described above.

This invention provides a fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound of Formula 1 (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof), and at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents. Of note as embodiments of such

compositions are compositions comprising a compound corresponding to any of the compound embodiments described above.

This invention provides a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of Formula 1 (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof). Of note as embodiment of such methods are methods comprising applying a fungicidally effective amount of a compound corresponding to any of the compound embodiments describe above. Of particular note are embodiments where the compounds are applied as compositions of this invention.

Of note are compounds of Formula 1 that are compounds of Formula 1P (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides, and salts thereof, and also agricultural compositions containing them and their use as fungicides:



1P

wherein

Q^1 and Q^2 are independently phenyl, thienyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl or pyrimidinyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3;

X is O, $S(O)_m$ or NR^4;

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl; or

R^1 is phenyl optionally substituted with up to 3 R^8; or a five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, cyclopropyl or halogen;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_3–C_4 cycloalkyl, C_3–C_7 cycloalkoxy, C_4–C_6 alkylcycloalkyl, C_4–C_6 cycloalkylalkyl, C_3–C_7 halocycloalkyl, C_2–C_4 alkenyl and C_2–C_4 alkynyl;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$, $-SR^{10}$ or $-(C=W)R^{11}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

R^6 and R^7 are independently selected from H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_3–C_7 cycloalkyl, C_4–C_8 cycloalkylalkyl and C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting ring nitrogen atom, selected from carbon atoms and optionally up to one ring member selected from O, $S(O)_n$ and NR^{13};

each R^8, R^{9a} and R^{9b} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ and $S(O)_2CH_3$;

R^{10} is C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

R^{11} is C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_7 alkoxyalkyl, C_2–C_7 alkylaminoalkyl, C_2–C_8 dialkylaminoalkyl, C_1–C_6 alkylthio or C_2–C_7 alkylthioalkyl;

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy, C_1–C_4 haloalkoxy, C_1–C_4 alkylthio, C_1–C_4 alkylsulfinyl or C_1–C_4 alkylsulfonyl;

R^{13} is H, C_1–C_3 alkyl or C_2–C_3 haloalkyl;

W is O or S;

M^+ is a cation;

m is 0, 1 or 2; and

n is 0, 1 or 2.

Accordingly of note is a compound selected from Formula **1P** (including all geometric and stereoisomers), *N*-oxides, and salts thereof, as defined above. Also of note are counterpart embodiments that are embodiment counterparts to Embodiments 1 through 139 and Embodiments A through F wherein in said counterpart embodiments "Formula **1**" is replaced by "Formula **1P**" and the scope of said counterpart embodiments does not exceed the scope defined above for Formula **1P**. Examples of combinations of Embodiments 1 through 139 as applied to Formula **1P** are Embodiments AP, BP, CP, DP and EP:

Embodiment AP. A compound of Formula **1P** wherein

Q^1 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with from 1 to 4 substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3

X is O or NR^4;

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl; or

R^1 is a five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, Cl or Br;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl and C_3–C_4 cycloalkyl;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is H or C_1–C_6 alkyl;

R^6 is H or C_1–C_6 alkyl;

R^7 is H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting nitrogen atom, selected from carbon atoms and up to one ring member selected from O and NR^{13};

each R^8 is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano and nitro;

each R^{9a} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano and nitro;

each R^{9b} is C_1–C_2 alkyl;

R^{10} is CH_3, CH_2CH_3, CF_3 or CF_2CF_3;

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl or C_1–C_4 alkoxy; and

R^{13} is H or CH_3.

Embodiment BP. A compound of Embodiment AP wherein

Q^1 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

X is NR^4;

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, cyano, C_1–C_6 alkoxy or C_1–C_6 haloalkoxy;

R^2 is CH_3;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy and C_1–C_3 haloalkoxy;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl substituted with one R^{12};

R^{10} is CH_3; and

each R^{12} is independently cyclopropyl or -OCH_3.

Embodiment CP. A compound of Embodiment AP wherein

Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or

Q^1 is phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

X is O;

R^2 is CH_3;

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, nitro, CH_3, CF_3, -OCH_3, and -$OCHF_2$; and

R^4 is H, formyl or cyclopropyl.

Embodiment DP. A compound of Embodiment CP wherein

Q^1 is phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

each R^3 is independently selected from F, Cl, cyano and -OCH_3; and

R^4 is H.

Embodiment EP. A compound of Embodiment BP wherein

Q^1 is phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

each R^3 is independently selected from F, Cl, CN and -OCH_3; and

R^4 is H.

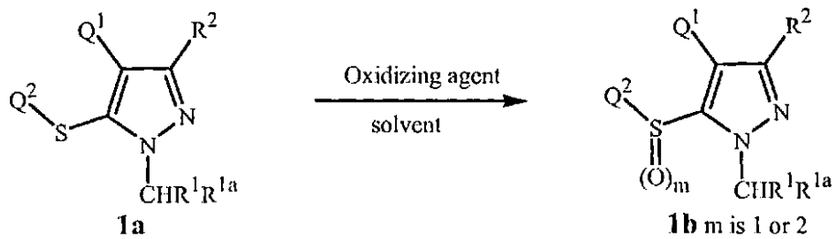
Also of note is a fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound of Formula **1P** (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof) or any one of counterpart embodiments that are embodiment counterparts to Embodiments 1 through 139 and Embodiments A through F (e.g., Embodiment AP, BP, CP, DP or EP), and at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents. Also of note is a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of Formula **1P** (including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof) or any one of said

counterpart embodiments. Of particular note are embodiments where the compounds of Formula **1P** are applied as compositions of this invention.

One or more of the following methods and variations as described in Schemes 1–24 can be used to prepare the compounds of Formula **1** (including Formula **1P**). The definitions of Q^1, Q^2, R^1, R^2 and m in the compounds of Formulae **1–33** below are as defined above in the Summary of the Invention unless otherwise noted. Formulae **1a**, **1b**, **1c**, **1d**, **1e**, **1f**, **1g** and **1h** are various subsets of Formula **1**; Formulae **4a**, **4b** and **4c** are various subsets of Formula **4**; Formulae **6a** and **6b** are various subsets of Formula **6**; Formula **11a** is a subset of Formula **11**; Formula **13a** is a subset or analog of Formula **13**; and Formula **17a** is a subset of Formula **17**. Substituents for each subset formula are as defined for its parent formula unless otherwise noted.

As illustrated in Scheme 1, sulfoxides and sulfones of Formula **1b** (i.e. Formula **1** wherein X is $S(O)_m$ and m is 1 or 2) can be made via oxidation of the linking sulfur atom on sulfides of Formula **1a** (i.e. Formula **1** wherein X is $S(O)_m$ and m is 0). In this method a compound of Formula **1b** wherein m is 1 (i.e. sulfoxides) or m is 2 (i.e. sulfones) is prepared by oxidizing a corresponding sulfide of Formula **1a** with a suitable oxidizing agent. In a typical procedure, an oxidizing agent in an amount from 1 to 4 equivalents depending on the oxidation state of the product desired is added to a solution of the compound of Formula **1a** in a solvent. Useful oxidizing agents include Oxone® (potassium peroxymonosulfate), hydrogen peroxide, sodium periodate, peracetic acid and 3-chloroperbenzoic acid. The solvent is selected with regard to the oxidizing agent employed. Aqueous ethanol or aqueous acetone is preferably used with potassium peroxymonosulfate, and dichloromethane is generally preferable with 3-chloroperbenzoic acid. Useful reaction temperatures typically range from –78 to 90 °C. Particular procedures useful for oxidizing sulfides to sulfoxides and sulfones are described by Brand et al., *J. Agric. Food Chem.* **1984**, *32*, 221–226 and references cited therein.

Scheme 1

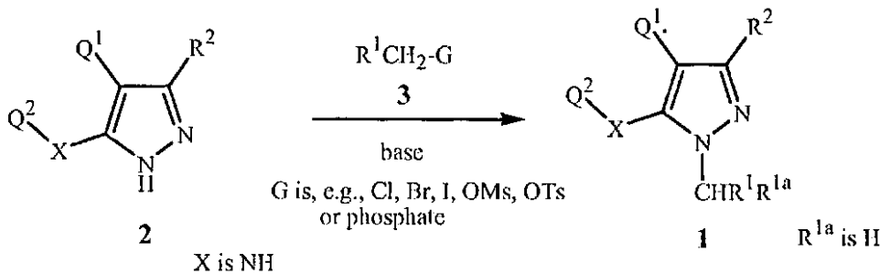


1a **1b** m is 1 or 2

As shown in Scheme 2, compounds of Formula **1** in which X is NH and R^{1a} is H can be prepared by the reaction of 1*H*-pyrazole compounds of Formula **2** with various alkylating agents (e.g., Formula **3**), such as iodoalkanes, alkylsulfonates (e.g., mesylate (OMs) or tosylate (OTs)) or trialkyl phosphates, preferably in the presence of an organic or inorganic

base such as 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene, potassium carbonate or potassium hydroxide, and in a solvent such as *N,N*-dimethylformamide, tetrahydrofuran, toluene or water.

Scheme 2

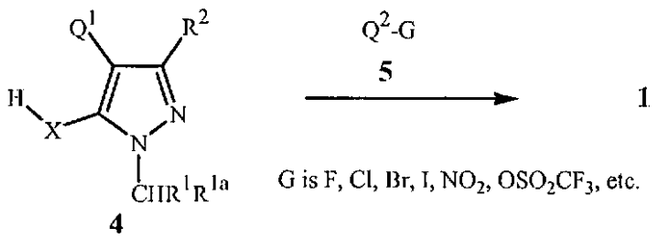


2 X is NH **1** R^{1a} is H

Compounds of Formula **1** wherein CHR^1R^{1a} forms an optionally substituted cyclopropyl ring can likewise be prepared by reaction of a pyrazole of Formula **2** with an organometallic reagent, such as tricyclopropylbismuth, in the presence of a catalyst, such as copper acetate, under conditions known in the art. See, for example, *J. Am. Chem. Soc.* **2007**, *129*(1), 44–45. Of note as starting materials in the method of Scheme 2 are compounds of Formula **2** specifically disclosed in Tables 588 through 671 below.

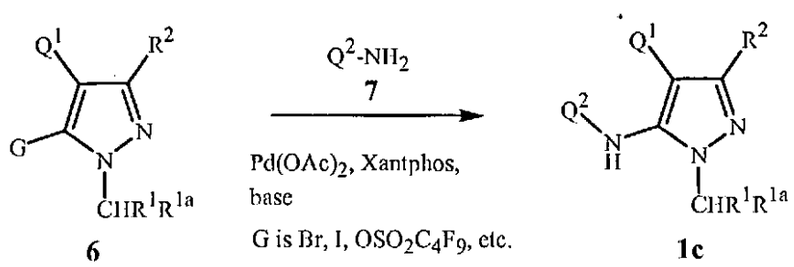
As is shown in Scheme 3, compounds of Formula **1** can be prepared by the reaction of compounds of Formula **4** (i.e. 5-aminopyrazoles for X being NR^4, 5-hydroxypyrazoles (5-pyrazolones) for X being O, or 5-mercaptopyrazoles for X being S) with aromatic compounds of Formula **5** containing a leaving group G (i.e. halogen or (halo)alkylsulfonate), optionally in the presence of a metal catalyst, and generally in the presence of a base and a polar aprotic solvent such as *N,N*-dimethylformamide or dimethyl sulfoxide. For example, compounds of Formula **5** in which Q^2 is an electron-deficient heteroaromatic ring, or a benzene ring with electron-withdrawing substituents, react by direct displacement of the leaving group G from the ring to provide compounds of Formula **1**. For compounds of Formula **5** wherein Q^2 is attached through a sp^3-hybridized carbon atom, G is typically Cl, Br, I or a sulfonate (e.g., $OS(O)_2CH_3$). Compounds of Formula **5** are commercially available or their preparation is known in the art. Of note are embodiments of the method of Scheme 3 wherein a compound of Formula **4** is used to prepare a corresponding compound of Formula **1** specifically disclosed in Tables 85 through 252 below.

Scheme 3



For reactions according to the method of Scheme 3 of a compound of Formula **4** wherein X is O or NR^4 with a compound of Formula **5** (Q^2-G) wherein Q is an aromatic or heteroaromatic ring Q lacking sufficiently electron-withdrawing substituents, or to improve reaction rate, yield or product purity, the use of a metal catalyst (e.g., metal or metal salt) in amounts ranging from catalytic up to superstoichiometric can facilitate the desired reaction. Typically for these conditions, G is Br or I or a sulfonate such as $OS(O)_2CF_3$ or $OS(O)_2(CF_2)_3CF_3$. For example, copper salt complexes (e.g., CuI with *N,N'*-dimethylethylenediamine, proline or bipyridyl), palladium complexes (e.g., tris(dibenzylideneacetone)dipalladium(0)) or palladium salts (e.g., palladium acetate) with ligands such as 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene (i.e. "Xantphos"), 2-dicyclohexylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl (i.e. "Xphos") or 2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthalene (i.e. "BINAP"), in the presence of a base such as potassium carbonate, cesium carbonate, sodium phenoxide or sodium *tert*-butoxide, in a solvent such as *N,N*-dimethylformamide, 1,2-dimethoxyethane, dimethyl sulfoxide, 1,4-dioxane or toluene, optionally mixed with alcohols such as ethanol, can be used. Alternatively as illustrated in Scheme 4, compounds of Formula **1c** (i.e. Formula **1** in which X is NR^4 and R^4 is H) can be prepared by reaction of compounds of Formula **6** (i.e. 5-bromopyrazoles or other pyrazoles substituted at the 5-position with a leaving group) with compounds of Formula **7** under metal-catalyzed conditions similar to those described above for Scheme 3. Compounds of Formula **7** are commercially available or their preparation is known in the art.

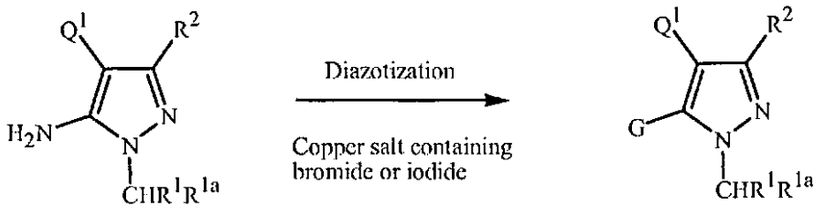
Scheme 4



As shown in Scheme 5, compounds of Formula **6** wherein G is Br or I can be prepared by reaction of 5-aminopyrazoles of Formula **4a** (i.e. Formula **4** wherein X is NH) under diazotization conditions either in the presence of, or followed by combination with, copper

salts containing bromide or iodide. For example, addition of *tert*-butyl nitrite to a solution of a 5-aminopyrazole of Formula **4a** in the presence of $CuBr_2$ in a solvent such as acetonitrile provides the corresponding 5-bromopyrazole of Formula **6**. Likewise, a 5-aminopyrazole of Formula **4a** can be converted to a diazonium salt and then to a corresponding 5-halopyrazole of Formula **6** by treatment with sodium nitrite in solvents such as water, acetic acid or trifluoroacetic acid, in the presence of a mineral acid typically containing the same halide atom (such as aqueous HI solution for G being I), followed by treatment with the corresponding copper(I) or copper(II) salt according to general procedures well known to those skilled in the art.

Scheme 5

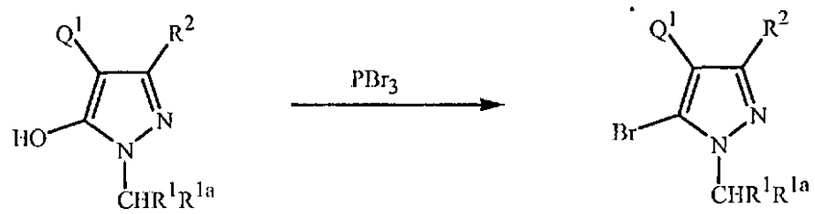


4a **6**

G is Br or I.

As shown in Scheme 6, 5-bromopyrazoles of Formula **6a** (i.e. Formula **6** wherein G is Br) can be prepared by reacting 5-hydroxypyrazoles of Formula **4b** (i.e. Formula **4** wherein X is O) with phosphorus tribromide as described in *Tetrahedron Lett.* **2000**, *41*(24), 4713.

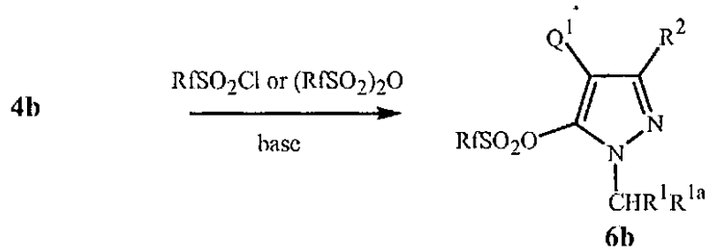
Scheme 6



4b **6a**

As shown in Scheme 7, 5-hydroxypyrazoles of Formula **4b** can also be used to prepare 5-fluoroalkylsulfonyl (e.g, 5-trifluoromethanesulfonyl, 5-nonafluorobutylsulfonyl) pyrazoles of Formula **6b** (i.e. Formula **6** wherein G is fluoroalkylsulfonyl) as described in *Synlett* **2004**, *5*, 795.

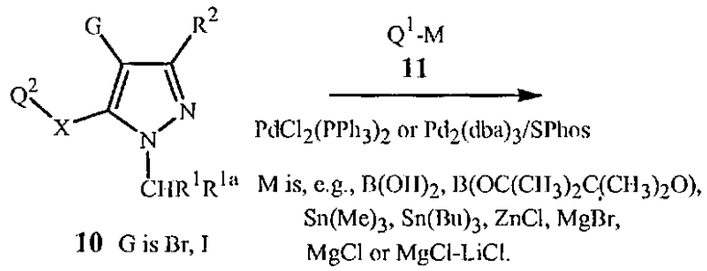
Scheme 7



wherein Rf is fluoroalkyl such as CF_3 or $(CF_2)_2CF_3$

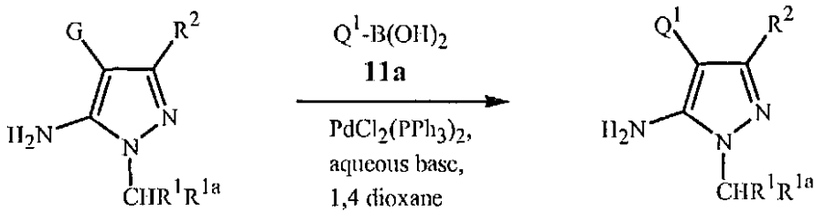
As shown in Scheme 8, compounds of Formula 1 can be prepared by reaction of 4-bromo or iodo pyrazoles of Formula **10** wherein X is O, NR^4, C(=O) or $S(O)_m$ in which m is 2 with organometallic compounds of formula Q^1-M (Formula **11**) under transition-metal-catalyzed cross-coupling reaction conditions. Reaction of a 4-bromo or iodo pyrazole of Formula **10** with a boronic acid, trialkyltin, zinc or organomagnesium reagent of Formula **11** in the presence of a palladium or nickel catalyst having appropriate ligands (e.g., triphenylphosphine (PPh_3), dibenzylideneacetone (dba), dicyclohexyl(2',6'-dimethoxy-[1,1'-biphenyl]-2-yl)phosphine (SPhos)) and a base, if needed, affords the corresponding compound of Formula **1**. For example, a substituted aryl boronic acid or derivative (e.g., Formula **11** wherein Q^1 is optionally substituted phenyl or heterocyclyl and M is $B(OH)_2$, $B(OC(CH_3)_2C(CH_3)_2O)$ or $B(O\text{-}i\text{-}Pr)_3$/ Li· reacts with a 4-bromo- or 4-iodopyrazole of Formula **10** in the presence of dichlorobis(triphenylphosphine) palladium(II) and aqueous base such as sodium carbonate or potassium hydroxide, in solvents such as 1,4-dioxane, 1,2-dimethoxyethane, toluene or ethyl alcohol, or under anhydrous conditions with a ligand such as phosphine oxide or phosphite ligand (e.g., diphenylphosphine oxide) and potassium fluoride in a solvent such as 1,4-dioxane (see *Angewandte Chemie, International Edition* **2008**, *47*(25), 4695–4698) to provide the corresponding compound of Formula **1**.

Scheme 8



As illustrated in Scheme 9, compounds of Formula **4a** (i.e. Formula **4** wherein X is NH) can be prepared by reacting compounds of Formula **12** with compounds of Formula **11** (such as Q^1-$B(OH)_2$ (Formula **11a**)) using transition-metal-catalyzed cross-coupling reaction conditions as described for the method of Scheme 8.

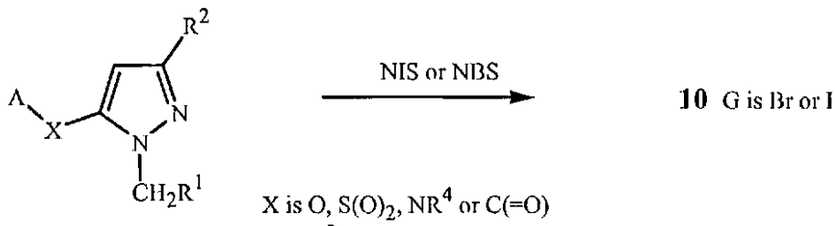
Scheme 9



12 G is Br, I **4a**

As illustrated in Scheme 10, pyrazoles of Formula **10** wherein X is O, $S(O)_2$, NR^4 or C(=O) and G is Br or I are readily prepared by the reaction of pyrazoles unsubstituted at the 4-position (Formula **13**) with halogenating reagents such as bromine, sodium bromite, *N*-bromosuccinimide (NBS) or *N*-iodosuccinimide (NIS), in solvents such as acetic acid, acetonitrile, *N,N*-dimethylformamide, *N,N*-dimethylacetamide or 1,4-dioxane, or a mixture of water with the aforementioned solvents, at temperatures ranging from ambient to the boiling point of the solvent.

Scheme 10



10 G is Br or I

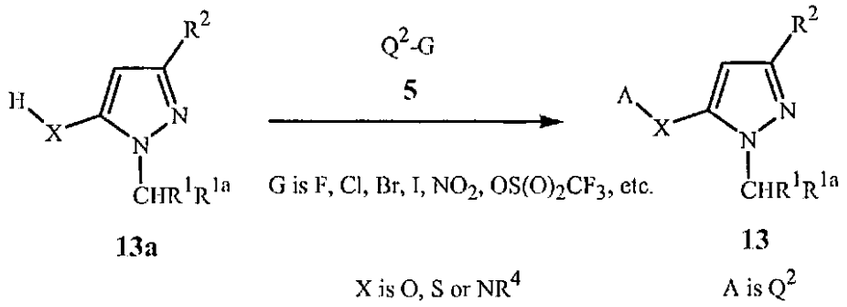
13 X is O, $S(O)_2$, NR^4 or C(=O); A is Q^2

Furthermore, using reaction conditions similar to those for the method of Scheme 10, compounds of Formula **13** wherein A is H or a protecting group can be converted into intermediates corresponding to Formula **10** wherein Q^2 is replaced by A or a protecting group, respectively, which are useful for preparing compounds of Formula **1**. Compounds of Formula **13** wherein A is H can be be prepared by methods known in the art; see, for example, *Synlett* **2004**, *5*, 795–798, US 4256902 and references cited therein. Furthermore, some compounds of Formula **13** wherein A is H, particularly those in which R^2 is methyl, ethyl or halogen, are commercially available.

As shown in Scheme 11, compounds of Formula **13** wherein X is O, $S(O)_m$ or NR^4, m is 0, and A is Q^2 can be prepared from corresponding compounds of Formula **13a** (i.e. Formula **13** wherein A is H) by procedures analogous those used for the method of Scheme 3. Compounds of Formula **13** wherein X is S (i.e. $S(O)_m$ wherein m is 0) can then be oxidized using procedures such as those used for the method of Scheme 1 to provide corresponding compounds of Formula **13** wherein X is $S(O)_2$ for use in the method of

Scheme 10. Compounds of Formula **13a** are commercially available or can be prepared by methods known in the art.

Scheme 11

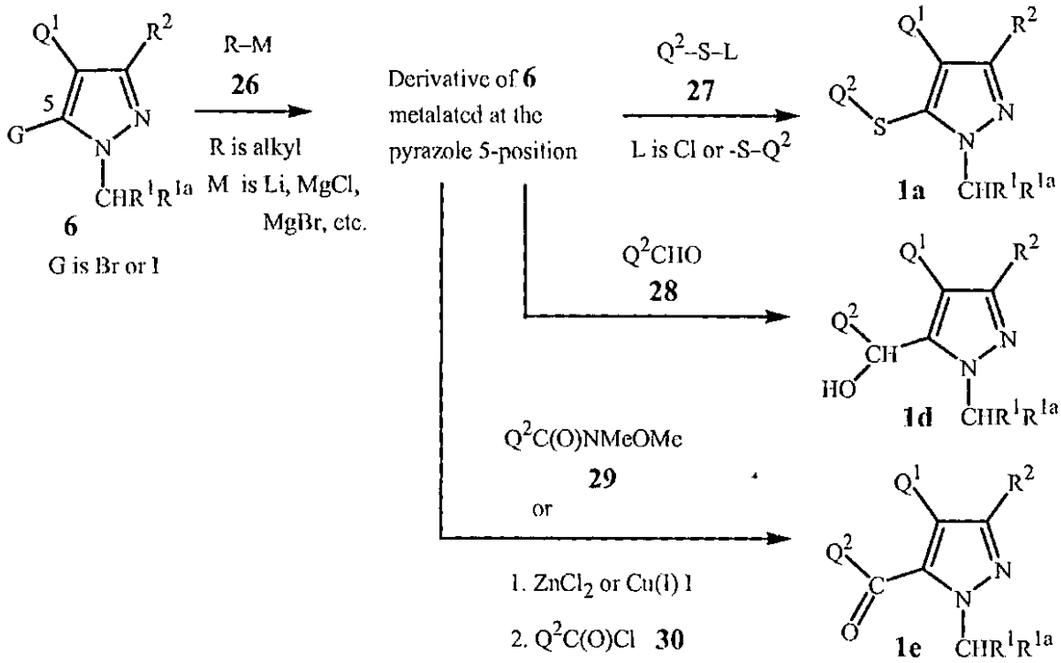


13a **13**

X is O, S or NR^4 A is Q^2

As shown in Scheme 12, compounds of Formula **1a** (i.e. Formula **1** wherein X is $S(O)_m$ and m is 0), Formula **1d** (i.e. Formula **1** wherein X is $CR^{15}R^{16}$, R^{15} is H, R^{16} is OR^{18} and R^{18} is H,) and Formula **1e** (i.e. Formula **1** wherein X is C(=O)) can be prepared by treatment of compounds of Formula **6** with an organometallic reagent (i.e. Formula **26**) such as an alkyllithium, preferably *n*-butyllithium, or an alkylmagnesium reagent, preferably isopropylmagnesium chloride (optionally complexed with lithium chloride), followed by the addition of a sulfur electrophile (i.e. Formula **27**) or carbonyl electrophile (i.e. Formula **28**, **29** or **30**). Reaction temperatures can range from –90 °C to the boiling point of the reaction solvent; temperatures of –78 °C to ambient temperature are generally preferred, with temperatures of –78 to –10 °C preferred when an alkyllithium reagent is used, and –20 °C to ambient temperature preferred with use of alkylmagnesium reagents. A variety of solvents are useful, such as toluene, ethyl ether, tetrahydrofuran or dimethoxymethane; anhydrous tetrahydrofuran is preferred. A second metallic component, such as zinc chloride, zinc bromide or a monovalent copper salt, such as copper(I) iodide or copper(I) cyanide, can advantageously be added before the electrophile in cases in which the electrophile is $Q^2C(O)Cl$ (i.e. Formula **30**). The Q^2-containing sulfur and carbonyl intermediates of Formulae **27**, **28**, **29** and **30** are commercially available or can be prepared by methods known in the art.

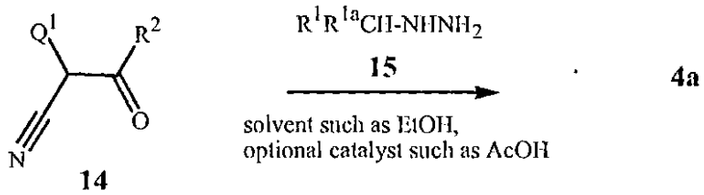
Scheme 12



It will be recognized by one skilled in the art that reactions analogous to those shown in Scheme 12 can also be utilized with pyrazoles lacking a Q^1 substituent, thus affording certain compounds of Formula **13** that are useful in the method outlined in Scheme 10.

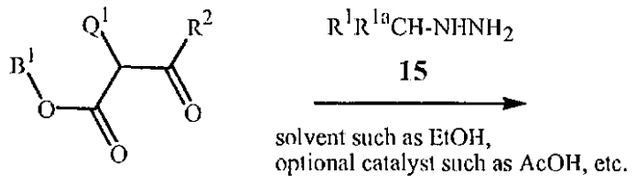
General methods useful for preparing 5-aminopyrazoles of Formula **4a** are well known in the art; see, for example, *Journal für Praktische Chemie (Leipzig)* **1911**, *83*, 171 and *J. Am. Chem. Soc.* **1954**, *76*, 501. Such a method is illustrated in Scheme 13 in which R^2 is alkyl or cycloalkyl.

Scheme 13



Similarly, general methods useful for preparing 5-hydroxypyrazoles of Formula **4b** are well known in the art; see, for example, *Annalen der Chemie* **1924**, *436*, 88. Such a method is illustrated in Scheme 14 in which R^2 is alkyl or cycloalkyl.

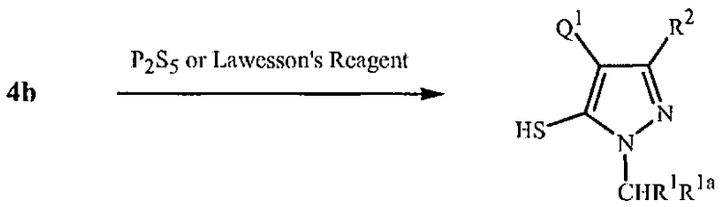
Scheme 14



16 B^1 is alkyl, aryl, benzyl, etc

As shown in Scheme 15, 5-thiopyrazole compounds of Formula **4c** (i.e. Formula 4 wherein X is S) can be prepared by reaction of corresponding 5-hydroxypyrazole compounds of Formula **4b** with P_2S_5 (see, for example, *Justus Liebigs Annalen der Chemie* **1908**, *361*, 251) or with Lawesson's Reagent (2,4-bis-(4-methoxyphenyl)-1,3-dithia-2,4-diphosphetane 2,4-disulfide; see, for example, International Patent Publication WO 2005/118575) in solvents such as toluene, xylene or tetrahydrofuran.

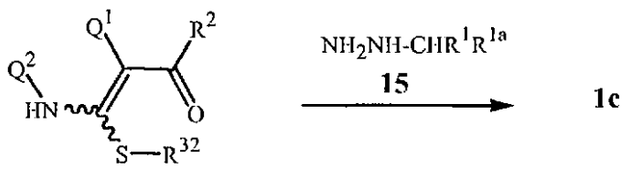
Scheme 15



4c

As shown in Scheme 16, compounds of Formula **1c** (i.e. Formula **1** wherein X is NR^4 and R^4 is H) can be prepared by condensing compounds of Formula **17** with alkylhydrazines of Formula **15** in a solvent such as ethanol or methanol and optionally in the presence of an acid or base catalyst such as acetic acid, piperidine or sodium methoxide, according to general procedures known in the art.

Scheme 16



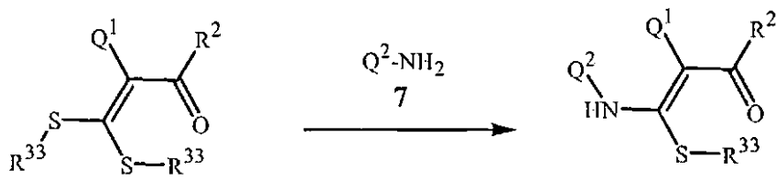
17

wherein R^{32} is H or lower alkyl (e.g., CH_3, CH_2CH_3 or $(CH_2)_2CH_3$)

In a manner analogous to the method of Scheme 16, compounds of Formula **2** wherein X is NH can be similarly prepared by condensing compounds of Formula **17** with hydrazine. This method is described in *Chemistry of Heterocyclic Compounds* **2005**, *41*(1), 105–110.

As shown in Scheme 17, compounds of Formula **17** (wherein, e.g., R^2 is methyl, ethyl or optionally substituted cyclopropyl and R^{33} is H or lower alkyl such as CH_3, CH_2CH_3 or $(CH_2)_2CH_3$) can be prepared by reaction of corresponding ketene dithioacetal compounds of Formula **18** with compounds of formula Q^2-NH_2 (i.e. Formula **7**) optionally in the presence of a base, such as sodium hydride or ethylmagnesium chloride, in solvents such as toluene, tetrahydrofuran or dimethoxymethane, at temperatures ranging from –10 °C to the boiling point of the solvent. See, for example, *J. Heterocycl. Chem.* **1975**, *12*(1), 139. Methods useful for preparing compounds of Formula **18** are known in the art.

Scheme 17



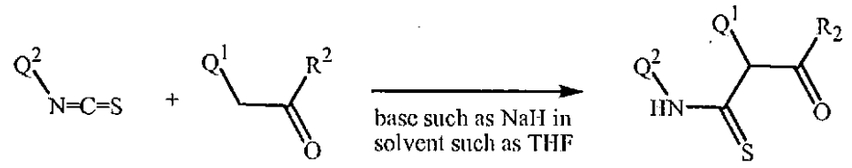
18 **17**

wherein R^{33} is H or lower alkyl (e.g., CH_3, CH_2CH_3 or $(CH_2)_2CH_3$)

It is also known in the art (see, for example, *Synthesis* **1989**, 398) that compounds of Formula **18** in which the two R^{33} groups are taken together as a single CH_2 group (thus forming a dithietane ring) react with an stoichiometric excess amount of hydrazines of Formula **15** to afford compounds of Formula **4c**, which are useful for preparation of compounds of Formula **1** in which X is S according to the method of Scheme 3.

As shown in Scheme 18, compounds of Formula **17a** (i.e. tautomer of Formula **17** wherein R^{33} is H) can be prepared by reaction of corresponding isothiocyanate compounds of Formula **19** with arylacetone compounds of Formula **20** wherein R^2 is methyl, ethyl or optionally substituted cyclopropyl; see, for example, *Zhurnal Organicheskoi Khimii* **1982**, *18*(12), 2501. Bases useful for this reaction include sodium hydride, alkoxide bases (e.g., potassium *tert*-butoxide or sodium ethoxide), potassium hydroxide, sodium hydroxide, potassium carbonate, or amine bases (e.g., triethylamine or *N*,*N*-diisopropylethylamine). A variety of solvents are useful, such as tetrahydrofuran, ether, toluene, *N*,*N*-dimethylformamide, alcohols (e.g., ethanol), esters (e.g., ethyl acetate or isopropyl acetate), or mixtures thereof. Solvents are chosen for compatibility with the base selected, as is well-known in the art. Reaction temperatures can range from –78 °C to the boiling point of the solvent. One useful mixture of base and solvent is potassium *tert*-butoxide in tetrahydrofuran, to which at –70 to 0 °C is added a combined solution of an isothiocyanate of Formula **19** and a carbonyl compound of Formula **20**.

Scheme 18

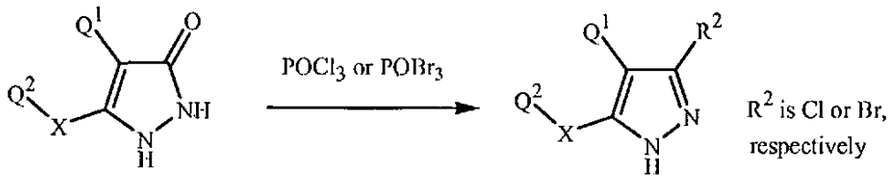


19 20 17a

Ketothioamides of Formula **17** can be also be prepared by allowing the corresponding ketoamides to react with sulfurizing agents such as Lawesson's reagent or P_2S_5; see, for example, *Helv. Chim. Act.* **1998**, *81*(7), 1207.

Compounds of Formula **2** wherein X is NH and R^2 is Cl or Br, which are useful for preparing compounds of Formula **1** according to the method of Scheme 2, can be prepared by reaction of corresponding compounds of Formula **31** with $POCl_3$ or $POBr_3$ using general procedures known in the art, as shown in Scheme 19.

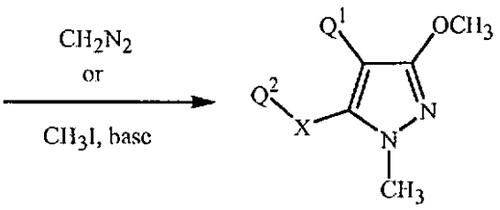
Scheme 19



31 X is NH **2**

As shown in Scheme 20, compounds of Formula **1f** (i.e. Formula **1** wherein R^1 and R^{1a} are H and R^2 is OCH_3) can be prepared by reacting corresponding compounds of Formula **31** with diazomethane or iodomethane in the presence of base using general procedures known in the art, such as those described in *J. Heterocyclic Chem.* **1988**, 1307–1310.

Scheme 20

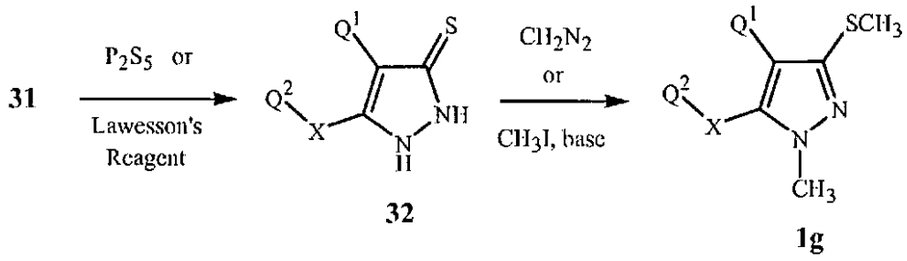


31 **1f**

Compounds of Formula **1g** (i.e. Formula **1** wherein R^1 and R^{1a} are H and R^2 is SCH_3) can be prepared by treating corresponding compounds of Formula **31** with P_2S_5 or Lawesson's Reagent to prepare compounds of Formula **32**, which are then reacted with

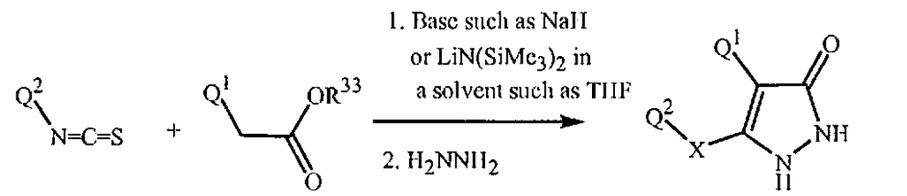
diazomethane or iodomethane in the presence of base using general procedures known in the art, as shown in Scheme 21.

Scheme 21



As shown in Scheme 22, compounds of Formula **31** wherein X is NH can be prepared by condensation of corresponding isothiocyanates of Formula **19** with esters of Formula **33** wherein R^{33} is lower alkyl (e.g., methyl, ethyl, propyl) in the presence of a strong, non-nucleophilic base such as sodium hydride or lithium hexamethyldisilazide, in an inert solvent such as tetrahydrofuran (analogous to the method of Scheme 18), followed by reaction of the intermediate with hydrazine or an acid salt of hydrazine, such as, for example, an acetate or hydrochloride salt (analogous to the method of Scheme 16).

Scheme 22



19 **33** **31**

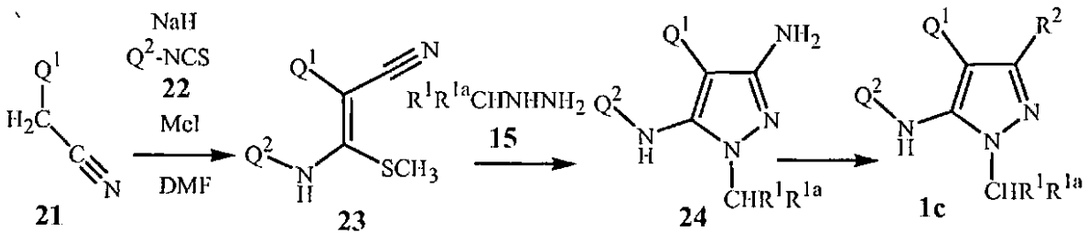
R^{33} is lower alkyl X is NH

One skilled in the art will recognize that use of a substituted hydrazine of formula $H_2NNHCHR^1R^{1a}$ instead of unsubstituted hydrazine in the method of Scheme 22, followed by the further manipulations described for Schemes 19, 20 and 21 will also afford compounds of Formula **1**.

Compounds of Formula **1c** (i.e. Formula **1** wherein X is NR^4 and R^4 is H) in which R^2 is halogen can also be prepared as shown in Scheme 23. In this method an acetonitrile compound of Formula **21** is condensed with an isothiocyanate compound of Formula **22** in the presence of a base such as sodium hydride or potassium *tert*-butoxide, in a solvent such as *N,N*-dimethylformamide or tetrahydrofuran, to afford a cyano ketoamide intermediate compound, which is then reacted with a methylating agent such as iodomethane or dimethyl sulfate, in the presence of a base to provide the corresponding compound of Formula **23**. Alternatively, the methylating agent can be included in the reaction mixture with the compounds of Formulae **21** and **22** without isolation of the cyano ketoamide intermediate.

One skilled in the art will recognize that compounds of Formula **23** can also be prepared by a method analogous to Scheme 17 wherein the $C(O)R^2$ of the compound of Formula **18** is replaced by cyano. According to the method of Scheme 23, the resultant compound of Formula **23** is then reacted with an alkylhydrazine of Formula **15** to form the corresponding 3-aminopyrazole compound of Formula **24** using general procedures known in the art; see, for example, *J. Chem. Soc. Perkin 1* **1988**, *2*, 169–173 and *J. Med. Chem.* **2003**, *46(7)*, 1229–1241. The amino group of the compound of Formula **24** can then be converted to R^2 being halogen in Formula **1c** by a diazotization reaction using conditions known in the art, such as those previously described for Scheme 5.

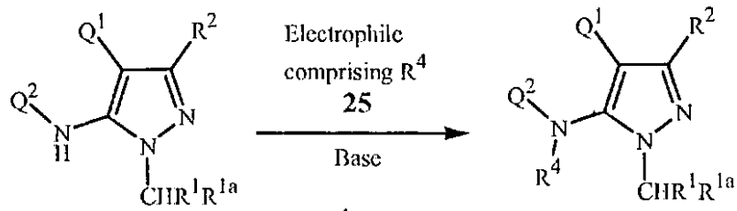
Scheme 23



Analogous to the method of Scheme 23, compounds of Formula **2** wherein X is NH and R^2 is halogen can be similarly prepared by condensing compounds of Formula **23** with hydrazine instead of an alkylhydrazine of Formula **15**.

As shown in Scheme 24, compounds of Formula **1h** (i.e. Formula **1** wherein X in NR^4) can be prepared by reacting corresponding compounds of Formula **1c** (i.e. Formula **1** wherein X is NH) with an electrophile comprising R^4 (i.e. Formula **25**) typically in the presence of a base such as NaH and a polar solvent such as *N,N*-dimethylformamide. In this context the expression "electrophile comprising R^4" means a chemical compound capable of transferring an R^4 moiety to a nucleophile (such as the nitrogen atom attached to Q^2 in Formula **1c**). Often electrophiles comprising R^4 have the formula R^4Lg wherein Lg is a nucleofuge (i.e. leaving group in nucleophilic reactions). Typical nucleofuges include halogens (e.g., Cl, Br, I) and sulfonates (e.g., $OS(O)_2CH_3$, $OS(O)_2CF_3$, $OS(O)_2$-(4-CH_3-Ph)). However, some electrophiles comprising R^4 do not comprise a nucleofuge; an example is sulfur trioxide (SO_3), which after deprotonation (such as by a base of the formulae M^+H^- wherein M^+ is a cation) of the nitrogen atom attached to Q^2 in Formula **1c**, can bond to the nitrogen atom as a $-SO_3^-M^+$ substituent.

Scheme 24



It is recognized by one skilled in the art that various functional groups can be converted into others to provide different compounds of Formula **1**. For example, compounds of Formula **1** in which R^2 is methyl, ethyl or cyclopropyl can be modified by free-radical halogenation to form compounds of Formula **1** wherein R^2 is halomethyl, haloethyl or halocyclopropyl. The halomethyl compounds can be used as intermediates to prepare compounds of Formula **1** wherein R^2 is hydroxymethyl or cyanomethyl. Compounds of Formula **1** or intermediates for their preparation may contain aromatic nitro groups, which can be reduced to amino groups, and then be converted via reactions well known in the art such as the Sandmeyer reaction, to various halides, providing other compounds of Formula **1**. By similar known reactions, aromatic amines (anilines) can be converted via diazonium salts to phenols, which can then be alkylated to prepare compounds of Formula **1** with alkoxy substituents. Likewise, aromatic halides such as bromides or iodides prepared via the Sandmeyer reaction can react with alcohols under copper-catalyzed conditions, such as the Ullmann reaction or known modifications thereof, to provide compounds of Formula **1** that contain alkoxy substituents. Additionally, some halogen groups, such as fluorine or chlorine, can be displaced with alcohols under basic conditions to provide compounds of Formula **1** containing the corresponding alkoxy substituents. The resultant alkoxy compounds can themselves be used in further reactions to prepare compounds of Formula **1** wherein R^3 is -U-V-T (see, for example, PCT Publication WO 2007/149448 A2). Compounds of Formula **1** or precursors thereof in which R^2 or R^3 is halide, preferably bromide or iodide, are particularly useful intermediates for transition metal-catalyzed cross-coupling reactions to prepare compounds of Formula **1**. These types of reactions are well documented in the literature; see, for example, Tsuji in *Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis*, John Wiley and Sons, Chichester, 2002; Tsuji in *Palladium in Organic Synthesis*, Springer, 2005; and Miyaura and Buchwald in *Cross Coupling Reactions: A Practical Guide*, 2002; and references cited therein.

One skilled in the art will recognize that sulfide groups can be oxidized to the corresponding sulfoxides or sulfones by conditions well-known in the art. Likewise, compounds of Formula **1** wherein X is $CR^{15}R^{16}$, R^{15} is H, R^{16} is OR^{18} and R^{18} is H can be readily interconverted with corresponding compounds of Formula **1** wherein X is C(=O) by

alcohol oxidation and ketone reduction reactions well known in the art. Compounds of Formula **1** wherein X is C(=O) (i.e. ketones) can be readily converted to ketals using general methods known in the art, thus providing compounds of Formula **1** wherein X is $CR^{15}R^{16}$ and R^{15} and R^{16} are taken together as $-OCH_2CH_2O-$. Compounds of Formula **1** wherein X is C(=O) can also be converted by the use of Lawesson's Reagent to prepare corresponding compounds of Formula **1** wherein X is C(=S). Furthermore, compounds of Formula **1** wherein X is $CR^{15}R^{16}$, R^{15} is C_1–C_4 alkyl, R^{16} is OR^{18}, and R^{18} is H can be prepared by adding an alkyl Grignard reagent to the corresponding compounds of Formula **1** wherein X is C(=O).

The above reactions can also in many cases be performed in alternate sequence, such as the preparation of 1*H* pyrazoles for use in the reaction in Scheme 2 by reactions illustrated later for the general preparation of substituted pyrazoles. The presence of certain functional groups may not be compatible with all of these reaction conditions, and the use of protecting groups may be desirable for obtaining the desired products with improved yields and or purity.

It is recognized that some reagents and reaction conditions described above for preparing compounds of Formula **1** may not be compatible with certain functionalities present in the intermediates. In these instances, the incorporation of protection/deprotection sequences or functional group interconversions into the synthesis will aid in obtaining the desired products. The use and choice of the protecting groups will be apparent to one skilled in chemical synthesis (see, for example, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). One skilled in the art will recognize that, in some cases, after the introduction of a given reagent as it is depicted in any individual scheme, it may be necessary to perform additional routine synthetic steps not described in detail to complete the synthesis of compounds of Formula **1**. One skilled in the art will also recognize that it may be necessary to perform a combination of the steps illustrated in the above schemes in an order other than that implied by the particular sequence presented to prepare the compounds of Formula **1**. One skilled in the art will also recognize that compounds of Formula **1** and the intermediates described herein can be subjected to various electrophilic, nucleophilic, radical, organometallic, oxidation, and reduction reactions to add substituents or modify existing substituents.

Without further elaboration, it is believed that one skilled in the art using the preceding description can utilize the present invention to its fullest extent. The following Synthesis Examples are, therefore, to be construed as merely illustrative, and not limiting of the disclosure in any way whatsoever. Steps in the following Synthesis Examples illustrate a procedure for each step in an overall synthetic transformation, and the starting material for each step may not have necessarily been prepared by a particular preparative run whose procedure is described in other Examples or Steps. Percentages are by weight except for

chromatographic solvent mixtures or where otherwise indicated. Parts and percentages for chromatographic solvent mixtures are by volume unless otherwise indicated. ^{1}H NMR spectra are reported in ppm downfield from tetramethylsilane in $CDCl_3$ unless otherwise noted; "s" means singlet, "m" means multiplet, "br s" means broad singlet. Mass spectra are reported as the molecular weight of the highest isotopic abundance parent ion (M+1) formed by addition of H^+ (molecular weight of 1) to the molecule, observed by mass spectrometry using atmospheric pressure chemical ionization (AP^+) where "amu" stands for atomic mass units.

SYNTHESIS EXAMPLE 1

Preparation of *N*-(3-Chlorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 1)

Step A: Preparation of α-Acetyl-2,4-difluorobenzeneacetonitrile (alternatively named methyl α-cyano-2,4-difluorobenzeneacetate)

Sodium hydride (60 % in mineral oil) (1.5 g, 38 mmol) was stirred in xylenes (7 mL) under a nitrogen atmosphere at ambient temperature. A solution of anhydrous ethanol (6.3 mL, 64 mmol) in xylenes (2 mL) was added dropwise over about 20 minutes at a temperature of about 40 °C. The reaction mixture was heated to 70 °C, and a solution of 2,4-difluorophenylacetonitrile (3.9 g, 25 mmol), ethyl acetate (3.8 mL, 38 mmol) and xylenes (1 mL) was added dropwise over 15 min. Additional xylenes (5 mL) was added to aid stirring. The reaction mixture was heated for 2 h, then allowed to cool. Water (50 mL) was added, and the mixture was extracted with hexanes (50 mL). The aqueous phase was then acidified to pH 3–4 with 1 N aqueous HCl solution. The aqueous phase was extracted with ether (50 mL), and the ethereal extract was washed with water (25 mL) and brine, then dried over $MgSO_4$, and concentrated to give the title compound as a viscous residue (3.3 g). ^{1}H NMR δ 7.42 (m, 1H), 6.8–7.0 (m, 2H), 4.95 (s, 1H), 2.36 (s, 3H).

Step B: Preparation of 4-(2,4-Difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine

Acetic acid (0.5 mL, 8.3 mmol) and methylhydrazine (534 μL, 10.0 mmol) were added to a solution of the residue obtained in Step A (1.6 g, 8.5 mmol) in ethyl alcohol (8 mL). The reaction mixture was then heated at reflux for 16 h under a nitrogen atmosphere. While the reaction mixture was still warm, water was added in small portions (1 mL at a time) until a precipitate formed (about 12 mL of water total). The mixture was reheated to dissolve the solids and then allowed cooled to room temperature. The resulting precipitate was collected on a glass frit, washed with 2 to 3 mL of 50% aqueous ethyl alcohol, and dried under vacuum to obtain the compound as a white solid (0.99 g).

^{1}H NMR δ 7.20 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.47 (br s, 2H), 2.14 (s, 3H).

Step C: Preparation of *N*-(3-Chlorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine

Palladium(II) acetate (90 mg, 0.40 mmol), 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene (460 mg, 0.80 mmol) and powdered potassium carbonate (5.5 g, 40 mmol) were combined in anhydrous 1,4-dioxane (20 mL), and the mixture was sparged with a subsurface stream of N_2 gas for 10 min. 4-(2,4-Difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (i.e. the product of Step B) (0.89 g, 4.0 mmol) was added in one portion, and 1-bromo-3-chlorobenzene (0.47 mL, 4.0 mmol) was added via a syringe. The reaction mixture was heated at reflux under a nitrogen atmosphere for 3 h. Additional 1-bromo-3-chlorobenzene (0.09 mL, 0.8 mmol) was added, and heating was continued for 1 h. The reaction mixture was allowed to cool to room temperature, and then partitioned between water (40 mL) and ethyl acetate (40 mL). The organic phase was washed with additional water (40 mL), brine (40 mL), dried over $MgSO_4$ and concentrated under reduced pressure. The residue was purified by column chromatography through 10 g of silica gel eluted with hexanes/ethyl acetate (1:1) to give the title compound, a compound of the present invention, as a solid (0.41 g).

^{1}H NMR δ 7.2–7.3 (m, 2H), 7.10 (m, 1H), 6.9–7.0 (m, 2H), 6.70 (m, 1H), 6.58 (m, 1H), 6.52 (m, 1H), 3.64 (s, 3H), 2.14 (s, 3H). MS: 334 amu.

SYNTHESIS EXAMPLE 2

Preparation of 4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 17)

Step A: Preparation of 5-Bromo-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole

Copper(II) bromide (3.94 g, 17.7 mmol) was added to a solution of 4-[2-chloro-4-fluorophenyl]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (prepared similarly to the preparation of 4-(2,4-Difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine in Steps A and B of Synthesis Example 1) (2.4 g, 10 mmol) in acetonitrile (50 mL), and the mixture was stirred and cooled in an ice-water bath while *tert*-butyl nitrite (90% technical grade, 2.33 mL, 17.7 mmol) was added dropwise over 5 min. The reaction mixture was allowed to warm slowly to ambient temperature. Aqueous HCl solution (20 mL) was added, and then ethyl acetate was added (20 mL). This mixture was filtered through a 2-cm pad of Celite® diatomaceous filter aid. The filter pad was washed with ethyl acetate (20 mL), and the phases were separated. The organic phase was washed with 1.0 N aqueous hydrochloric acid solution and brine, dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave the title compound as an orange-brown semisolid (2.8 g).

^{1}H NMR δ 7.18–7.25 (m, 2H), 7.04 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.14 (s, 3H).

Step B: Preparation of 4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine

5-Bromo-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole (i.e. the product of Step A) (0.20 g, 0.66 mmol), palladium(II) acetate (15 mg, 0.066 mmol), 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene (76 mg, 0.13 mmol) and powdered potassium carbonate (1.8 g, 13 mmol) were combined in anhydrous 1,4-dioxane (3 mL), and the mixture was sparged with a subsurface stream of N_2 gas for 10 min. 2,6-Difluoro-4-methoxyaniline (0.22 g, 1.3 mmol) was added in one portion, and the reaction mixture was heated at reflux for 22 h. The reaction mixture was filtered through Celite® diatomaceous filter aid, and the filter pad was washed with ethyl acetate (20 mL). The filtrate was washed with water (10 mL) and brine (10 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a semisolid residue. This residue was purified by column chromatography through 5 g of silica gel eluted with a gradient of hexanes/ethyl acetate (20:1 to 1:3) to give the title compound, a compound of the present invention, as a light-brown solid (48 mg).

^{1}H NMR δ 7.0–7.1 (m, 2H), 6.85 (m, 1H), 6.26 (m, 2H), 4.84 (br s, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.08 (s 3H). MS: 382 amu.

SYNTHESIS EXAMPLE 3

Preparation of 4-(2,6-Difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 24)

Step A: Preparation of 2,6-Difluoro-4-methoxybenzeneacetonitrile

A solution of KCN (0.88 g, 13 mmol) dissolved in water (2 mL) was added dropwise to a water-bath-cooled solution of 2,6-difluoro-4-methoxybenzyl bromide (2.50 g, 10.5 mmol) in *N*,*N*-dimethylformamide (10 mL). The reaction mixture was stirred for 20 min. Water was added (20 mL) and then the reaction mixture was poured into saturated aqueous $NaHCO_3$ solution (20 mL) and extracted with ether (50 mL). The organic phase was washed with water (5 x 25 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to give an oil, which crystallized on standing to provide the title compound as a white solid (1.9 g).

^{1}H NMR δ 6.50 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.65 (s, 2H).

Step B: Preparation of α-Acetyl-2,6-difluoro-4-methoxybenzeneacetonitrile

Solid sodium ethoxide (4.7 g, 66 mmol) was stirred in a mixture of xylene (20 mL) and ethanol (10 mL) and heated to 50 °C. A solution of 2,6-difluoro-4-methoxybenzene-acetonitrile (i.e. the product of Step A) (8.0 g, 44 mmol) in ethyl acetate (10.4 mL) was added dropwise. The reaction mixture was heated at 50 °C for 4 h and then allowed to cool to ambient temperature. The reaction mixture was poured into water (100 mL) and extracted with ethyl acetate (25 mL). The aqueous phase was acidified with 3 N aqueous HCl to pH 4 and extracted with ethyl acetate (100 mL). This organic phase was washed with water

(50 mL), brine (50 mL), then dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave the title compound as a tan semisolid (8.0 g).

^{1}H NMR δ 6.56 (m, 2H), 4.86 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.40 (s, 3H).

Step C: Preparation of 4-(2,6-Difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-amine

α-Acetyl-2,6-difluoro-4-methoxybenzeneacetonitrile (i.e. the product of Step B) (8.03 g, 35.7 mmol) and acetic acid (5 mL) were stirred in ethanol (35 mL), and methylhydrazine (1.91 mL, 35.7 mmol) was added. The reaction mixture was heated at reflux for 16 h, cooled, and then poured into water (100 mL). The resulting mixture was extracted with ethyl acetate (100 mL). The organic phase was washed with 1 N aqueous NaOH (50 mL) and then brine (50 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a solid. The solid was dissolved in methanol, and the resulting solution was warmed to 45 °C. Water (25 mL) was added dropwise, and the mixture was allowed to cool. The precipitate was collected on a glass frit to give the title compound as a white solid (3.88 g).

^{1}H NMR δ 6.55 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.43 (br s, 2H), 2.09 (s, 3H).

Step D: Preparation of 5-Bromo-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole

Copper(II) bromide (3.81 g, 16.9 mmol) was added to a solution of 4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole (i.e. the product of Step C) (3.88 g, 15.4 mmol) in acetonitrile (50 mL), and the mixture was stirred and cooled in an ice-water bath while *tert*-butyl nitrite (90% technical grade, 3.54 mL, 26.9 mmol) was added dropwise over 5 min. The reaction mixture was allowed to warm slowly to ambient temperature. Aqueous hydrochloric acid solution (25 mL) was added, then ethyl acetate (25 mL) was added, and the resulting mixture was filtered through a 2-cm pad of Celite® diatomaceous filter aid. The filter pad was washed with ethyl acetate (50 mL), and the phases were separated. The organic phase was washed with 1 N aqueous HCl solution (25 mL) and brine (25 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated. The residue was purified by column chromatography through 24 g of silica gel eluted with a gradient of hexanes/ethyl acetate (9:1 to 1:1) to give the title compound as a white solid (3.25 g).

^{1}H NMR δ 6.54 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

Step E: Preparation of 4-(2,6-Difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine

5-Bromo-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole (i.e. the product of Step D) (0.30 g, 0.94 mmol), palladium(II) acetate (20 mg, 0.090 mmol), 4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene (0.11 g, 0.19 mmol) and powdered potassium carbonate (2.6 g, 19 mmol) were combined in anhydrous 1,4-dioxane (4 mL), and the resulting mixture was sparged with a subsurface stream of N_2 gas for 10 min. 2,4,6-Trifluoroaniline (0.28 g, 1.9 mmol) was added in one portion, and the reaction mixture

was heated at reflux under nitrogen for 22 h. The reaction mixture was cooled, then filtered through Celite® diatomaceous filter aid. The filter pad was washed with ethyl acetate (20 mL), and the filtrate was washed with water (10 mL) and brine (10 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a semisolid residue. The residue was purified by column chromatography through 12 g of silica gel eluted with a gradient of hexanes/ethyl acetate (20:1 to 1:3) to give the title compound, a compound of the present invention, as a semisolid (73 mg).

^{1}H NMR (acetone-d_6) δ 6.84 (br s, 1H), 6.68 (m, 2H), 6.43 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.99 (s, 3H). MS: 384 amu (AP^+).

SYNTHESIS EXAMPLE 4

Preparation of 4-[[4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzonitrile (Compound 45)

Step A: Preparation of 4-[(1,3-Dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]-3,5-difluorobenzonitrile

Potassium carbonate (1.38 g, 10 mmol) was added to a solution of 2,4-dihydro-2,5-dimethyl-3*H*-pyrazol-3-one (0.70 g, 6.3 mmol) in *N*,*N*-dimethylformamide (15 mL). 3,4,5-Trifluorobenzonitrile (0.94 g, 6.0 mmol) was added, and the reaction mixture was heated at 75 °C under a nitrogen atmosphere for 16 h, then allowed to cool. The reaction mixture was partitioned between water (60 mL) and ethyl acetate (30 mL). The organic phase was washed with water (2 x 30 mL) and brine (30 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to give the title compound as a yellow oil (1.38 g).

^{1}H NMR δ 7.36 (m, 2H), 5.24 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

Step B: Preparation of 3,5-Difluoro-4-[(4-iodo-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]benzonitrile

A solution of 4-[(1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]-3,5-difluorobenzonitrile (i.e. the product of Step A) (1.38 g, 5.5 mmol) in acetonitrile (20 mL) was stirred at ambient temperature, and *N*-iodosuccinimide (1.35 g, 6.0 mmol) was added in one portion. The reaction mixture was heated at reflux for 2 h, cooled, and then poured into water (40 mL). The resulting mixture was extracted with ethyl acetate (40 mL). The organic phase was washed with water (20 mL) and saturated aqueous $NaHCO_3$ solution (20 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated under reduced pressure to give the title compound as a tan solid (2.1 g).

^{1}H NMR (acetone-d_6) δ 7.80 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 2.09 (s, 3H). MS: 376 amu (AP^+).

Step C: Preparation of 4-[[4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzonitrile

To a solution of 3,5-difluoro-4-[(4-iodo-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl)oxy]-benzonitrile (i.e. the product of Step B) (1.0 g, 2.67 mmol) in 1,4-dioxane (6 mL) was added

2-chloro-4-fluorobenzeneboronic acid (alternatively named *B*-(2-chloro-4-fluorophenyl)-boronic acid) (0.93 g, 5.33 mmol), dichloro (bis)triphenylphosphine palladium(II) (alternatively named bis(triphenylphosphine)palladium(II) dichloride) (93 mg, 0.13 mmol), potassium carbonate (0.74 g, 5.33 mmol), and water (4 mL). The resulting mixture was heated at reflux for 5 h, allowed to cool, and partitioned between water (20 mL) and ethyl acetate (20 mL). The organic layer was dried over $MgSO_4$ and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel with a gradient of hexanes / ethyl acetate to obtain the title compound, a compound of the present invention, as an off-white solid (110 mg).

^{1}H NMR δ 7.00–7.09 (m, 3H), 6.97 (m, 1H), 6.86 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 2.02 (s, 3H).

SYNTHESIS EXAMPLE 5

Preparation of 4-(2,4-Dichlorophenyl)-*N*-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine (Compound 69)

Step A: Preparation of α-Acetyl-2,4-dichloro-*N*-(2,4-difluorophenyl)benzene-ethanethioamide

2,4-Difluorophenyl isothiocyanate (0.27 mL, 2.0 mmol) was added to a stirred suspension of sodium hydride (60% in mineral oil) (112 mg, 2.8 mmol) in anhydrous tetrahydrofuran (4 mL) cooled in an ice-water bath under a nitrogen atmosphere. A solution of (2,4-dichlorophenyl)-2-propanone (570 mg, 2.8 mmol) in tetrahydrofuran (4 mL) was added dropwise over 5 min. The resultant yellow solution was stirred at 5–10 °C for 1 h. Water (10 mL) was carefully added, and the reaction mixture was extracted with ethyl acetate (10 mL). The aqueous phase was acidified to pH 3 with 1 N aqueous HCl, then extracted with ethyl acetate (20 mL). The organic extract was washed with water (10 mL) and brine (10 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a solid. The solid was triturated with hexanes / ethyl acetate (2:1), collected on a glass frit, and air-dried to give the title compound as a white solid (240 mg). MS: 373 amu (AP^+).

Step B: Preparation of 4-(2,4-Dichlorophenyl)-*N*-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine

Acetic acid (50 μL) and methylhydrazine (41 μL) were added to a stirred suspension of α-acetyl-2,4-dichloro-*N*-(2,4-difluorophenyl)benzeneethanethioamide (238 mg, 0.64 mmol) in ethanol (4 mL). The reaction mixture was heated at reflux for 2 h and allowed to cool. Then the reaction mixture was diluted with ethyl acetate (10 mL) and washed with 1 N aqueous NaOH (10 mL), water (10 mL) and brine (10 mL), dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a solid residue. The residue was purified by column chromatography on 5 g of silica gel with a gradient of hexanes/ethyl acetate (2:1 to 1:1) to give the title compound as a solid (170 mg).

^{1}H NMR δ 7.43 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.07 (m, 1H), 6.78 (m, 1H), 6.62 (m, 1H), 6.37 (m, 1H), 5.22 (br s, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.18 (s, 3H). MS: 368 amu (AP^+).

SYNTHESIS EXAMPLE 6

Preparation of 4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-α-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (Compound 351)

5-Bromo-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole (i.e. the product of Synthesis Example 2, Step A) (0.25 g, 0.82 mmol) was dissolved in anhydrous tetrahydrofuran (12 mL), and the mixture was cooled in a dry ice/acetone bath under a nitrogen atmosphere. A cyclohexane solution of *n*-butyllithium (2.0 M, 0.49 mL, 0.98 mmol) was added dropwise over 5 minutes. After 15 minutes, a solution of 2,4-difluorobenzaldehyde (0.09 mL, 0.82 mmol) in anhydrous tetrahydrofuran (3 mL) was added slowly dropwise, causing the dark red-colored solution to lighten to a yellow color. After 45 minutes, the reaction mixture was quenched by the addition of saturated aqueous NH_4Cl solution (~20 mL) and allowed to warm to ambient temperature. This mixture was extracted with ethyl acetate, and the organic phase was washed with saturated aqueous NH_4Cl solution (25 mL) and with brine, dried over Na_2SO_4, and concentrated to leave a viscous residue. This residue was purified by column chromatography through silica gel eluted with a gradient of ethyl acetate in hexane (7% to 10%) to give the title product, a compound of the present invention, as a white semi-solid (109 mg).

^{1}H NMR δ 7.5 (m, 1H), 7.1 (m, 2H), 7.0 (m, 1H), 6.85 (m, 2H), 6.0 (br s, 1H), 5.9 (s, 1H), 3.8 (s, 3H), 2.1 (s, 3H). MS: 367 amu (AP^+).

SYNTHESIS EXAMPLE 7

Preparation of [4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl](2,4-difluorophenyl)methanone (Compound 370)

4-(2-Chloro-4-fluorophenyl)-α-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol (i.e. the product of Synthesis Example 6) (90 mg, 0.25 mmol) was dissolved in dichloromethane (8 mL), and pyridinium dichromate (113 mg, 0.3 mmol) was added in one portion. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 16 h, and then the reaction mixture was partitioned between water (5 mL) and dichloromethane (5 mL). The organic phase was washed with additional water (5 mL) and with brine (5 mL), dried over Na_2SO_4 and concentrated under reduced pressure to give a viscous residue. This residue was purified by column chromatography through silica gel eluted with a gradient of ethyl acetate in hexane (25% to 30%) to give the title product, a compound of the present invention, as a pale yellow viscous oil (29 mg).

^{1}H NMR δ 7.94 (m, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.03 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.78 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.13 (s, 3H). MS: 365 amu (AP^+).

SYNTHESIS EXAMPLE 8

Preparation of 5-(2,6-Difluoro-4-nitrophenoxy)-1,3-dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazole (Compound 54)

Step A: Preparation of Methyl 2,4,6-trifluorobenzeneacetate

A solution of 2,4,6-trifluorobenzeneacetic acid (5.00 g, 26.3 mmol) in methanol (25 mL) was stirred at ambient temperature, and thionyl chloride (6 mL, ~ 3 eq.) was added dropwise, causing the temperature of the reaction mixture to reach 60 °C. The reaction mixture was allowed to cool to ambient temperature and was stirred for 3 h. Water (25 mL) was added with ice cooling. The mixture was extracted with ethyl acetate (2 x 100 mL). The combined organic phases were washed with water (2x), with saturated aqueous sodium bicarbonate solution and with brine, and dried over $MgSO_4$. Concentration provided the title product as a clear oil (5.38 g).

^{1}H NMR δ 6.68 (m, 2H), 3.72 (s, 3H), 3.66 (s, 2H).

Step B: Preparation of Methyl α-acetyl-2,4,6-trifluorobenzeneacetate

To a commercially obtained tetrahydrofuran solution of lithium bis(trimethylsilyl)amide (1.0 M, 21.0 mL), stirred under a nitrogen atmosphere and cooled to an internal temperature of –65 °C, was added dropwise over 30 minutes a solution of methyl 2,4,6-trifluorobenzeneacetate (i.e. the product of Step A) (2.04 g, 10.0 mmol) dissolved in dry tetrahydrofuran (10 mL). The reaction mixture was stirred for an additional 30 minutes, and then while maintaining the –65 °C temperature, a solution of freshly distilled acetyl chloride (0.80 mL, 11 mmol) in dry tetrahydrofuran (3 mL) was added dropwise. The reaction mixture was allowed to warm slowly to ambient temperature, and then water (30 mL) was added. The resultant mixture was extracted with ethyl acetate (60 mL). The aqueous phase was acidified with 1 N hydrochloric acid and extracted with ethyl acetate (60 mL). Only the first extract was retained, because thin layer chromatographic analysis showed the second extract to contain apparent polar impurities besides additional desired product. The initial organic phase was further washed with 1 N hydrochloric acid, water and brine, dried over $MgSO_4$, and concentrated to provide the title product as a clear oil (1.86 g).

^{1}H NMR δ 6.69 (m, 2H), 3.7 (m, 1H and s, 3H), 1.87 (s, 3 H); minor resonances at 13.2 ppm and 4.9 ppm indicated presence of enolic tautomer.

Step C: Preparation of 1,3-Dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-ol

To a solution of methyl α-acetyl-2,4,6-trifluorobenzeneacetate (i.e. the product of Step B) (2.46 g, 10.0 mmol) in methanol (15 mL) was added methylhydrazine (0.665 mL, 12.5 mmol), and the mixture was stirred at ambient temperature over 3 days. Aqueous citric acid solution (1 M, 10 mL) was added, and then water (50 mL) was added. The mixture was extracted with ethyl acetate (2 x 50 mL). The combined organic extracts were washed with water and with brine, dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a yellow solid. This solid was suspended in a small volume of ethyl acetate (about 5 mL), an equal volume of hexanes was gradually added, and the suspension was stirred for 30 minutes. The solid component was collected on a glass frit, washed with small portions of ethyl acetate/ hexanes (1:1 and 1:2 v:v), and allowed to dry in air to provide a white solid (1.02 g).

Evaporation of the mother liquor and treatment of the resultant residue with small volumes of ethyl acetate and hexanes as already described provided an additional 0.13 g of solid containing the title product (1.15 g total). Analysis of the combined solids by LC/MS showed a primary component of mass 242 (AP+) and a minor component, eluting later by reverse-phase LC, also having a mass of 242 (AP+). The apparent ratio of components was 94:6.

^{1}H NMR (acetone-d_6) δ 6.95 (m, 2H), 3.52 (s, 3H), 1.98 (s, 3H); 5-hydroxy resonance was not observed in this solvent.

Step D: Preparation of 5-(2,6-Difluoro-4-nitrophenoxy)-1,3-dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazole

1,3-Dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-ol (i.e. the product of Step C) (0.310 g, 1.28 mmol), was combined with 3,4,5-trifluoronitrobenzene (157 µL, 1.35 mmol) and potassium carbonate powder (0.27 g, 2 mmol) in dry *N*,*N*-dimethylformamide (4 mL). This mixture was stirred and heated at 80 °C for 45 minutes and then allowed to cool. The reaction mixture was diluted with water (10 mL) and extracted with ethyl acetate (2 x 10 mL). The organic phase was washed with water and with brine, dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave a viscous residue. This residue was purified by column chromatography through silica gel eluted with a gradient of ethyl acetate (30% to 100%) in hexane to give the title product, a compound of the present invention, as an off-white solid (209 mg).

^{1}H NMR δ 7.71 (m, 2H), 6.54 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.07 (s, 3H); 400 amu (AP+).

SYNTHESIS EXAMPLE 9

Preparation of 4-[[1,3-Dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzenamine (Compound 371)

5-(2,6-Difluoro-4-nitrophenoxy)-1,3-dimethyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazole (i.e. the product of Synthesis Example 8) (0.780 g, 1.95 mmol) was combined with iron powder (325 mesh, 0.58 g, 10 mmol) and ammonium chloride (64 mg, 1.2 mmol) in ethanol (27 mL) to which water (3 mL) had been added. The mixture was heated at reflux for 1.25 h and then allowed to cool. The reaction mixture was diluted with an equal volume of ethyl acetate and filtered through Celite filter aid. The filtrate was dried with $MgSO_4$ and concentrated. Analysis by LC/MS showed the major component (93%) to have mass 370 amu (AP+). The residue was dissolved in anhydrous dimethyl sulfoxide (8 mL), and a commercial solution of sodium methoxide in methanol (0.45 mL of 25% solution) was added. This solution was stirred under nitrogen and heated at reflux for 1 h. Additional sodium methoxide/methanol solution (0.20 mL) was added, and heating was continued for an additional 30 minutes. The reaction mixture was allowed to cool, and it was then treated with aqueous citric acid solution (1 M, 5 mL), diluted with water (50 mL) and extracted with ethyl acetate (2 x 25 mL). The organic phase was washed with water (3x) and with brine,

dried over $MgSO_4$, and concentrated to leave the title product, a compound of the present invention, as a viscous oil (0.52 g).

^1H NMR δ 6.29 (m, 2H), 5.95 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.55–3.75 (br s, NH_2), 2.01 (s, 3H); 382 amu (AP+).

SYNTHESIS EXAMPLE 10

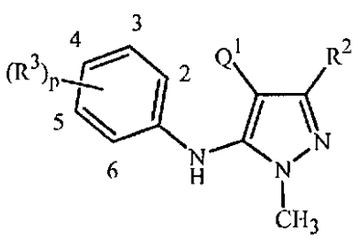
Preparation of 5-(4-Chloro-2,6-difluorophenoxy)-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole (Compound 58)

Copper(I) chloride (56 mg, 0.42 mmol) was added to a solution of 4-[[4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzenamine (prepared analogous to Synthesis Example 9) (132 mg, 0.346 mmol) in acetonitrile (5 mL). The stirred mixture was cooled using an ice-water bath, and *tert*-butyl nitrite (90% technical grade, 72 μL) was added dropwise. The reaction mixture was allowed to warm slowly to ambient temperature and stirred at room temperature overnight, and then it was heated at reflux for 1 h. Hydrochloric acid (1 N, 5 mL) was added, and the mixture was extracted with ethyl acetate (~20 mL). The organic phase was washed with brine, dried over $MgSO_4$, and concentrated. The residue was purified by column chromatography through silica gel eluted with 20% ethyl acetate in hexane to give the title product, a compound of the present invention, as a viscous oil (45 mg).

^1H NMR δ 6.74 (m, 2H), 6.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.03 (s, 3H); 401 amu (AP+).

By the procedures described herein together with methods known in the art, the compounds disclosed in the Tables that follow can be prepared. The following abbreviations are used in the Table which follows: Me means methyl, Et means ethyl, *n*-Pr means *n*-propyl, *c*-Pr means cyclopropyl, Ph means phenyl, OMe (or MeO) means methoxy, OEt (or EtO) means ethoxy, -CN means cyano, and $-NO_2$ means nitro.

TABLE 1



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F

2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF_3-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

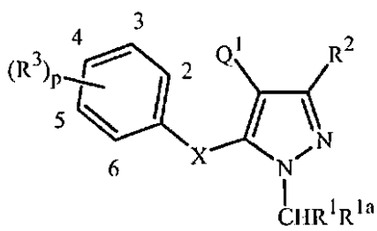
The present disclosure also includes Tables 2 through 84, each of which is constructed the same as Table 1 above, except that the row heading in Table 1 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 2 the row heading is "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.", and $(R^3)_p$ is as defined in Table 1 above. Thus, the first entry in Table 2 specifically discloses 2-chloro-4-(2,6-difluorophenyl)-*N*-(2-fluorophenyl)-1-methyl-1*H*-pyrazol-5-amine. Tables 3 through 84 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
2	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	47	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Cl.
3	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.	48	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Br.
4	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Me.	49	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Me.
5	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	50	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
6	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Br.	51	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Br.
7	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Me.	52	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Me.
8	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Cl.	53	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
9	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Br.	54	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Br.
10	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Me.	55	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Me.
11	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Cl.	56	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
12	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Br.	57	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Br.
12A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Me.	58	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
12B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Cl.	59	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
12C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Br.	60	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
13	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Me.	60A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
14	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Cl.	60B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.
15	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Br.	60C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.
16	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Me.	61	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
17	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Cl.	62	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
18	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Br.	63	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
19	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Me.	63A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
20	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Cl.	63B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.
21	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Br.	63C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.

Table	Row Heading
22	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.
23	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.
24	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.
25	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.
26	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.
27	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.
28	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Me.
29	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
30	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Br.
31	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Me.
32	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Cl.
33	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Br.
34	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Me.
35	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
36	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Br.
37	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Me.
38	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
39	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Br.
40	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Me.
41	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Cl.
42	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Br.
43	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Me.
44	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
45	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Br.
46	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Me.

Table	Row Heading
64	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
65	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
66	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
66A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
66B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.
66C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.
67	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
68	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
69	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Br.
70	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
71	Q^1 is 2-Cl -4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
72	Q^1 is 2-Cl -4-CN-Ph, and R^2 is Br.
73	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
74	Q^1 is 2-Br -4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
75	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^2 is Br.
76	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Me.
77	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Cl.
78	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Br.
79	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Me.
80	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Cl.
81	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Br.
82	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Me.
83	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Cl.
84	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Br.

TABLE 85



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
4-F	4-Cl	4-Br	2,4-di-F	2-Br-4-F
2,6-di-F	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2-Cl-4-F	2-F-4-Cl

2-F-4-Br	2-Br-6-F	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-I-4-F
2-F-4-I	2-Cl-4,6-di-F	4-Cl-2,6-di-F	2-Br-4,6-di-F	4-Br-2,6-di-F
2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN
2-Br-4-CN	2,6-di-F-4-CN	2-F-4-NO_2	2-Cl-4-NO_2	2-Br-4-NO_2
2,5-di-F-4-CN	4-Cl-2,5-di-F	2-Br-4,5-di-F	4-Br-2,5-di-F	2-Cl-4,5-di-F

The present disclosure also includes Tables 86 through 280, each of which is constructed the same as Table 85 above, except that the row heading in Table 85 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 86 the row heading is "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl." and $(R^3)_p$ is as defined in Table 85 above. Thus, the first entry in Table 86 specifically discloses 3-chloro-4-(2,6-difluorophenyl)-5-(4-fluorophenoxy)-1-methyl-1*H*-pyrazole. Tables 87 through 280 are constructed similarly.

Table	Row Heading
86	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
87	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
88	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
89	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
90	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
91	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
92	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
93	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
94	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
95	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
96	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
96A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
96B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
96C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
97	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
98	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
99	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
100	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
101	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
102	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
103	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
104	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
105	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
106	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
107	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.

Table	Row Heading
108	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
109	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
110	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
111	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
112	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
113	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
114	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
115	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
116	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
117	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
118	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
119	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
120	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
121	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
122	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
123	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
124	Q^1 is 2-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
125	Q^1 is 2-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
126	Q^1 is 2-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
127	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
128	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
129	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
130	Q^1 is 2-Br-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
131	Q^1 is 2-Br-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
132	Q^1 is 2-Br-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
133	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
134	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
135	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
136	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
137	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
138	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
139	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
140	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
141	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
142	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
143	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
144	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.

Table	Row Heading
144A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
144B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
144C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
145	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
146	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
147	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
147A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
147B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
147C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
148	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
149	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
150	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
150A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
150B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
150C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
151	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
152	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
153	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
154	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
155	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
156	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
157	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
158	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
159	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
160	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
161	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
162	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
163	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
164	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
165	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
166	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
167	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
168	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
169	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
170	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
171	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
172	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.

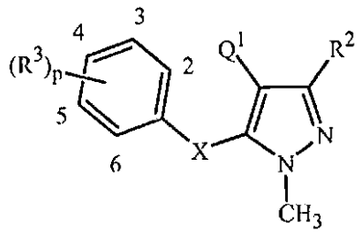
Table	Row Heading
173	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
174	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
175	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
176	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
177	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
178	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
179	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
180	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
180A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
180B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
180C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
181	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
182	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
183	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
184	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
185	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
186	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
187	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
188	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
189	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
190	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
191	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
192	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
193	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
194	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
195	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
196	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
197	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
198	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
199	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
200	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
201	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
202	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
203	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
204	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
205	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
206	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.

Table	Row Heading
207	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
208	Q^1 is 2-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
209	Q^1 is 2-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
210	Q^1 is 2-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
211	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
212	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
213	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
214	Q^1 is 2-Br-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
215	Q^1 is 2-Br-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
216	Q^1 is 2-Br-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
217	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
218	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
219	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
220	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
221	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
222	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
223	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
224	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
225	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
226	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
227	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
228	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
228A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
228B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
228C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
229	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
230	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
231	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
231A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
231B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
231C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
232	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
233	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
234	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
234A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
234B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
234C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.

Table	Row Heading
235	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
236	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
237	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
238	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
239	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
240	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
241	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
242	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
243	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
244	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
245	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
246	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
247	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
248	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
249	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
250	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
251	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
252	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
253	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is NH, R^1 and R^{1a} form *c*-Pr, and R^2 is Me.
254	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is O, R^1 is Et, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
255	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Et.
256	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is CHOH, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is CF_3.
257	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is NH, R^1 is $CH{=}CH_2$, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
258	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is CHOH, X is O, R^1 is *c*-Pr, R^{1a} is H, and R^2 is Br.
259	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} form *c*-Pr, and R^2 is Me.
260	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is CHOH, R^1 is *c*-Pr, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
261	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is NH, X is NH, R^1 is Et, R^{1a} is H, and R^2 is Br.
262	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is O, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Et.
263	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is S, R^1 is $CH_2CH{=}CH_2$, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
264	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is CHOH, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is *c*-Pr.
265	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is NH, R^1 is CH_2CF_3, R^{1a} is H, and R^2 is Me.
266	Q^1 is 2-F-Ph, X is O, R^1 is CH_2F, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
267	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is CH_2Cl.
268	Q^1 is 2-Br-Ph, X is $CHCH_3$, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
269	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is $C(CH_3)OH$, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Me.
270	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is O, R^1 is Et, R^{1a} is H, and R^2 is Br.
271	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is OMe.

Table	Row Heading
272	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is $CHOCH_3$, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Cl.
273	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is NH, R^1 and R^{1a} form *c*-Pr, and R^2 is Br.
274	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is O, R^1 is *n*-Pr, R^{1a} is H, and R^2 is Me.
275	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is NH, R^1 is $CH_2C{\equiv}CH$, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
276	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is $C(OCH_3)_2$, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Br.
277	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is NH, R^1 and R^{1a} form *c*-Pr, and R^2 is Me.
278	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is O, R^1 is *c*-Pr, R^{1a} is H, and R^2 is Cl.
279	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is S, R^1 and R^{1a} are both H, and R^2 is Et.
280	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is CHOH, R^1 is Et, R^{1a} is H, and R^2 is Me.

TABLE 281



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
4-F	4-Cl	4-Br	4-Me	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2-Cl-4-F	2-F-4-Cl
2-F-4-Br	2-Br-6-F	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-I-4-F
2-F-4-I	2-Cl-4,6-di-F	4-Cl-2,6-di-F	2-Br-4,6-di-F	4-Br-2,6-di-F
2-Br-4-F	2-Me-4-F	2,4,6-tri-F	2-Cl-4,5-di-F	4-Cl-2,5-di-F
2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN	2,6-diF-4-CN	2-F-4-MeO
2-Cl-4-MeO	2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	4-Br-2;5-di-F	2-Br-4,5-di-F

The present disclosure also includes Tables 282 through 448, each of which is constructed the same as Table 281 above, except that the row heading in Table 281 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 282 the row heading is "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl." and $(R^3)_p$ is as defined in Table 281 above. Thus, the first entry in Table 282 specifically discloses 3-chloro-4-(2,6-difluorophenyl)-α-(4-fluorophenyl)-1-methyl-1*H*-pyrazole-5-methanol. Tables 283 through 448 are constructed similarly.

Table	Row Heading
282	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
283	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
284	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.

Table	Row Heading
285	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
286	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
287	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
288	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
289	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
290	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
291	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
292	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
292A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
292B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
292C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
293	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
294	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
295	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
296	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
297	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
298	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
299	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
300	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
301	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
302	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
303	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
304	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
305	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
306	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
307	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
308	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
309	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
310	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
311	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
312	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
313	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
314	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
315	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
316	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
317	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
318	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.

Table	Row Heading
319	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
320	Q^1 is 2-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
321	Q^1 is 2-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
322	Q^1 is 2-F-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
323	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
324	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
325	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
326	Q^1 is 2-Br-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
327	Q^1 is 2-Br-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
328	Q^1 is 2-Br-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
329	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
330	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
331	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
332	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
333	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
334	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
335	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
336	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
337	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
338	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
339	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
340	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
340A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
340B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
340C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
341	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
342	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
343	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
343A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
343B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
343C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
344	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
345	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
346	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
346A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
346B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
346C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.

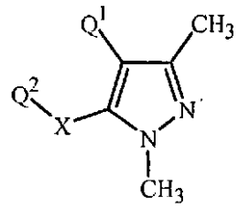
Table	Row Heading
347	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
348	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
349	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
350	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
351	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
352	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
353	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Me.
354	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Cl.
355	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is CHOH, and R^2 is Br.
356	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is CHOH, and R^2 is Me.
357	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is CHOH, and R^2 is Cl.
358	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is CHOH, and R^2 is Br.
359	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Me.
360	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Cl.
361	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Br.
362	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Me.
363	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Cl.
364	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is CHOH, and R^2 is Br.
365	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
366	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
367	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
368	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
369	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
370	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
371	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
372	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
373	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
374	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
375	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
376	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
376A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
376B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
376C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
377	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
378	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
379	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
380	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.

Table	Row Heading
381	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
382	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
383	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
384	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
385	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
386	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
387	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
388	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
389	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
390	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
391	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
392	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
393	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
394	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
395	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
396	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
397	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
398	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
399	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
400	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
401	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
402	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
403	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
404	Q^1 is 2-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
405	Q^1 is 2-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
406	Q^1 is 2-F-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
407	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
408	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
409	Q^1 is 2-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
410	Q^1 is 2-Br-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
411	Q^1 is 2-Br-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
412	Q^1 is 2-Br-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
413	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
414	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
415	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
416	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
417	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.

Table	Row Heading
418	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
419	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
420	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
421	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
422	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
423	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
424	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
424A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
424B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
424C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
425	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
426	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
427	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
427A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
427B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
427C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
428	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
429	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
430	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
430A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
430B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
430C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
431	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
432	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
433	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
434	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
435	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
436	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
437	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Me.
438	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Cl.
439	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, X is C(O), and R^2 is Br.
440	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is C(O), and R^2 is Me.
441	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is C(O), and R^2 is Cl.
442	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, X is C(O), and R^2 is Br.
443	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Me.
444	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Cl.
445	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Br.

Table	Row Heading
446	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Me.
447	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Cl.
448	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, X is C(O), and R^2 is Br.

TABLE 449



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is NH.

Q^2	Q^2	Q^2	Q^2
2-Cl-3-pyridinyl	6-Cl-3-pyridinyl	2,6-di-Cl-3-pyridinyl	3-Cl-2-pyridinyl
3,5-di-Cl-2-pyridinyl	3,5-di-F-2-pyridinyl	5-Me-2-pyridinyl	5-CN-2-pyridinyl
5-pyrimidinyl	2-Cl-5-pyrimidinyl	1,3-di-Me-5-pyrazolyl	5-Me-2-thiazolyl
5-Cl-2-pyridinyl	3,5-di-Cl-4-pyridinyl	tetrahydro-2*H*-pyran-4-yl	quinolin-2-yl

The present disclosure also includes Tables 450 through 587, each of which is constructed the same as Table 449 above, except that the row heading in Table 449 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is NH.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 450 the row heading is "Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is NH." and Q^2 is as defined in Table 449 above. Thus, the first entry in Table 450 specifically discloses 2-chloro-*N*-[4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]-3-pyridinamine. Tables 451 through 587 are constructed similarly.

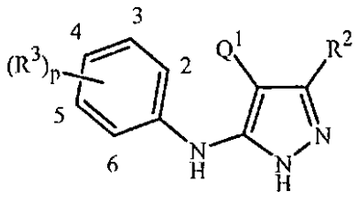
Table	Row Heading	Table	Row Heading
450	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is NH.	519	Q^1 is 2-Cl-Ph, and X is S.
451	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and X is NH.	520	Q^1 is 2-Br-Ph, and X is S.
452	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and X is NH.	521	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and X is S.
453	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and X is NH.	522	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and X is S.
454	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and X is NH.	523	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and X is S.
455	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and X is NH.	524	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and X is S.
456	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and X is NH.	525	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and X is S.
457	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and X is NH.	526	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and X is S.
458	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and X is NH.	527	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and X is S.
459	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and X is NH.	528	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and X is S.
460	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and X is NH.	529	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and X is S.
461	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and X is NH.	530	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and X is S.

Table	Row Heading
462	Q^1 is 2-F-Ph, and X is NH.
463	Q^1 is 2-Cl-Ph, and X is NH.
464	Q^1 is 2-Br-Ph, and X is NH.
465	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and X is NH.
466	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and X is NH.
467	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and X is NH.
468	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and X is NH.
469	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and X is NH.
470	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and X is NH.
471	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and X is NH.
472	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and X is NH.
473	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and X is NH.
474	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and X is NH.
475	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and X is NH.
476	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and X is NH.
477	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is O.
478	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is O.
479	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and X is O.
480	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and X is O.
481	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and X is O.
482	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and X is O.
483	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and X is O.
484	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and X is O.
485	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and X is O.
486	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and X is O.
487	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and X is O.
488	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and X is O.
489	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and X is O.
490	Q^1 is 2-F-Ph, and X is O.
491	Q^1 is 2-Cl-Ph, and X is O.
492	Q^1 is 2-Br-Ph, and X is O.
493	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and X is O.
494	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and X is O.
495	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and X is O.
496	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and X is O.
497	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and X is O.
498	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and X is O.
531	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and X is S.
532	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and X is S.
533	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is CHOH.
534	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is CHOH.
535	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and X is CHOH.
536	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and X is CHOH.
537	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and X is CHOH.
538	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and X is CHOH.
539	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and X is CHOH.
540	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and X is CHOH.
541	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and X is CHOH.
542	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and X is CHOH.
543	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and X is CHOH.
544	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and X is CHOH.
545	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and X is CHOH.
546	Q^1 is 2-F-Ph, and X is CHOH.
547	Q^1 is 2-Cl-Ph, and X is CHOH.
548	Q^1 is 2-Br-Ph, and X is CHOH.
549	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and X is CHOH.
550	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and X is CHOH.
551	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and X is CHOH.
552	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and X is CHOH.
553	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and X is CHOH.
554	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and X is CHOH.
555	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and X is CHOH.
556	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and X is CHOH.
557	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and X is CHOH.
558	Q^1 is 2,5-di-Cl-pyridin-3-yl, and X is CHOH.
559	Q^1 is 2,5-di-Cl-thien-3-yl, and X is CHOH.
560	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is C(O).
561	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is C(O).
562	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and X is C(O).
563	Q^1 is 2,6-di-F-4-OM-Ph e, and X is C(O).
564	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and X is C(O).
565	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and X is C(O).
566	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and X is C(O).
567	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and X is C(O).

Table	Row Heading
499	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and X is O.
500	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and X is O.
501	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and X is O.
502	Q^1 is 2,5-di-Cl-pyridin-3-yl, and X is O.
503	Q^1 is 2-Cl-thien-3-yl, and X is O.
504	Q^1 is 2,5-di-Cl-thien-3-yl, and X is O.
505	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and X is S.
506	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and X is S.
507	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and X is S.
508	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and X is S.
509	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and X is S.
510	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and X is S.
511	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and X is S.
512	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and X is S.
513	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and X is S.
514	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and X is S.
515	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and X is S.
516	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and X is S.
517	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and X is S.
518	Q^1 is 2-F-Ph, and X is S.

Table	Row Heading
568	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and X is C(O).
569	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and X is C(O).
570	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and X is C(O).
571	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and X is C(O).
572	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and X is C(O).
573	Q^1 is 2-F-Ph, and X is C(O).
574	Q^1 is 2-Cl-Ph, and X is C(O).
575	Q^1 is 2-Br-Ph, and X is C(O).
576	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and X is C(O).
577	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and X is C(O).
578	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and X is C(O).
579	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and X is C(O).
580	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and X is C(O).
581	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and X is C(O).
582	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and X is C(O).
583	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and X is C(O).
584	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and X is C(O).
585	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and X is C(O).
586	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and X is C(O).
587	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and X is C(O).

TABLE 588



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F

2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF_3-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

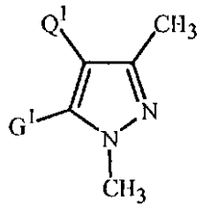
The present disclosure also includes Tables 589 through 671, each of which is constructed the same as Table 588 above, except that the row heading in Table 588 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 589 the row heading is "Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.", and $(R^3)_p$ is as defined in Table 588 above. Thus, the first entry in Table 589 specifically discloses 5-chloro-4-(2,6-difluorophenyl)-*N*-(2-fluorophenyl)-1*H*-pyrazol-3-amine. Tables 589 through 671 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
589	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	634	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Cl.
590	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.	635	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Br.
591	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Me.	636	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Me.
592	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	637	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
593	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^2 is Br.	638	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^2 is Br.
594	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Me.	639	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Me.
595	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Cl.	640	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
596	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^2 is Br.	641	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^2 is Br.
597	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Me.	642	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Me.
598	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Cl.	643	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
599	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^2 is Br.	644	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^2 is Br.
599A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Me.	645	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
599B	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Cl.	646	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
599C	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^2 is Br.	647	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
600	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Me.	647A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
601	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Cl.	647B	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.
602	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^2 is Br.	647C	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.
603	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Me.	648	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
604	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Cl.	649	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
605	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^2 is Br.	650	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
606	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Me.	650A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
607	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Cl.	650B	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.
608	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^2 is Br.	650C	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.
609	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.	651	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Me.
610	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	652	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Cl.
611	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.	653	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^2 is Br.
612	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Me.	653A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Me.
613	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Cl.	653B	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Cl.

Table	Row Heading
614	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^2 is Br.
615	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Me.
616	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
617	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^2 is Br.
618	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Me.
619	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Cl.
620	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^2 is Br.
621	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Me.
622	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
623	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^2 is Br.
624	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Me.
625	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Cl.
626	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^2 is Br.
627	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Me.
628	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Cl.
629	Q^1 is 2-F-Ph, and R^2 is Br.
630	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Me.
631	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Cl.
632	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^2 is Br.
633	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^2 is Me.
653C	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^2 is Br.
654	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
655	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
656	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^2 is Br.
657	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
658	Q^1 is 2-Cl -4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
659	Q^1 is 2-Cl -4-CN-Ph, and R^2 is Br.
660	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^2 is Me.
661	Q^1 is 2-Br -4-CN-Ph, and R^2 is Cl.
662	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^2 is Br.
663	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Me.
664	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Cl.
665	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^2 is Br.
666	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Me.
667	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Cl.
668	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^2 is Br.
669	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Me.
670	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Cl.
671	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^2 is Br.

The compounds of Tables 588 through 671 illustrate compounds of Formula **2** wherein X is NH, which are useful intermediates to prepare compounds of Formula **1** using the method of Scheme 2.

TABLE 672



G^1 is -OH.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-pyridinyl

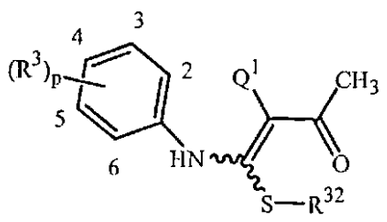
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-thienyl
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-thienyl
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

The present disclosure also includes Tables 673 through 676, each of which is constructed the same as Table 672 above, except that the row heading in Table 672 (i.e. "G^1 is -OH.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 673 the row heading is "G^1 is -SH.", and Q^1 is as defined in Table 672 above. Thus, the first entry in Table 673 specifically discloses 4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-thiol. Tables 674 through 676 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
673	G^1 is -SH.	675A	G^1 is I.
674	G^1 is Cl.	676	G^1 is $-NH_2$.
675	G^1 is Br.		

The compounds of Tables 672 and 673 illustrate compounds of Formula **4** wherein X is O or S, R^1 and R^{1a} are each H, and R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare compounds of Formula **1** using the method of Scheme 3. The compounds of Table 672 further illustrate compounds of Formula **4b** wherein R^1 and R^{1a} are each H, and R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare intermediate compounds of Formula **6a** using the method of Scheme 6 and to prepare intermediate compounds of Formula **6b** using the method of Scheme 7. Tables 674 and 675 illustrate compounds of Formula **6** wherein G is Cl or Br, and R^{1a} are each H, and R^2 is CH_3 which are useful intermediates to prepare compounds of Formula **1c** using the method of Scheme 4. Table 676 illustrates compounds of Formula **4a** wherein R^1 and R^{1a} are each H, and R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare intermediate compounds of Formula **6** using the method of Scheme 5.

TABLE 677



Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^{32} is Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl

2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF_3-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

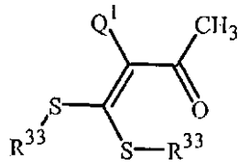
The present disclosure also includes Tables 678 through 704, each of which is constructed the same as Table 677 above, except that the row heading in Table 677 (i.e. "Q^1 is 2,6-di-F-Ph.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 2 the row heading is "Q^1 is 2,4-di-F-Ph.", and $(R^3)_p$ is as defined in Table 677 above. Thus, the first entry in Table 678 specifically discloses 3-(2,6-difluorophenyl)-4-[(2,4-difluorophenyl)amino]-4-(methylthio)-3-buten-2-one. Tables 679 through 704 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
678	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^{32} is Me.	721	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^{32} is Et.
679	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^{32} is Me.	722	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^{32} is Et.
680	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^{32} is Me.	723	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^{32} is Et.
680A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^{32} is Me.	724	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^{32} is Et.
681	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^{32} is Me.	724A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^{32} is Et.
682	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^{32} is Me.	725	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^{32} is Et.
683	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^{32} is Me.	725A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^{32} is Et.
684	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^{32} is Me.	726	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^{32} is Et.
685	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^{32} is Me.	726A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^{32} is Et.
686	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^{32} is Me.	727	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^{32} is Et.
687	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^{32} is Me.	728	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and R^{32} is Et.
688	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^{32} is Me.	729	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^{32} is Et.
689	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^{32} is Me.	730	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^{32} is Et.
690	Q^1 is 2-F-Ph, and R^{32} is Me.	731	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^{32} is Et.
691	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^{32} is Me.	732	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^{32} is Et.
692	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^{32} is Me.	733	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
693	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^{32} is Me.	734	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
694	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^{32} is Me.	735	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
695	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^{32} is Me.	736	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
696	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^{32} is Me.	736A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
696A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^{32} is Me.	737	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
697	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^{32} is Me.	738	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
697A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^{32} is Me.	739	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
698	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^{32} is Me.	740	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.

Table	Row Heading
698A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^{32} is Me.
699	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^{32} is Me.
700	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and R^{32} is Me.
701	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^{32} is Me.
702	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^{32} is Me.
703	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^{32} is Me.
704	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^{32} is Me.
705	Q^1 is 2,6-di-F-Ph, and R^{32} is Et.
706	Q^1 is 2,4-di-F-Ph, and R^{32} is Et.
707	Q^1 is 2,4,6-tri-F-Ph, and R^{32} is Et.
708	Q^1 is 2,6-di-F-4-OMe-Ph, and R^{32} is Et.
708A	Q^1 is 2,6-di-F-4-OEt-Ph, and R^{32} is Et.
709	Q^1 is 2,6-di-F-4-CN-Ph, and R^{32} is Et.
710	Q^1 is 2-Cl-4-F-Ph, and R^{32} is Et.
711	Q^1 is 2-Cl-6-F-Ph, and R^{32} is Et.
712	Q^1 is 2-Cl-4,6-di-F-Ph, and R^{32} is Et.
713	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^{32} is Et.
714	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^{32} is Et.
715	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^{32} is Et.
716	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^{32} is Et.
717	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^{32} is Et.
718	Q^1 is 2-F-Ph, and R^{32} is Et.
719	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^{32} is Et.
720	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^{32} is Et.
741	Q^1 is 4-Cl-2,6-di-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
742	Q^1 is 2-Br-4-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
743	Q^1 is 2-Br-6-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
744	Q^1 is 2-Me-4-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
745	Q^1 is 2-I-4-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
746	Q^1 is 2-F-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
747	Q^1 is 2-Cl-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
748	Q^1 is 2-Br-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
749	Q^1 is 2-F-4-Cl-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
750	Q^1 is 2,4-di-Cl-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
751	Q^1 is 2,6-di-Cl-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
752	Q^1 is 2-F-4-MeO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
752A	Q^1 is 2-F-4-EtO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
753	Q^1 is 2-Cl-4-MeO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
753A	Q^1 is 2-Cl-4-EtO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
754	Q^1 is 2-Br-4-MeO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
754A	Q^1 is 2-Br-4-EtO-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
755	Q^1 is 2-F-4-CN-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
756	Q^1 is 2-Cl-4-CN-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
757	Q^1 is 2-Br-4-CN-Ph, and R^{32} is *n*-Pr.
758	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-pyridinyl, and R^{32} is *n*-Pr.
759	Q^1 is 2-Cl-3-thienyl, and R^{32} is *n*-Pr.
760	Q^1 is 2,5-di-Cl-3-thienyl, and R^{32} is *n*-Pr.

The compounds of Tables 677 through 760 illustrate compounds of Formula **17** wherein R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare compounds of Formula **1c** using the method of Scheme 16.

TABLE 761



Each R^{33} is Me.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph

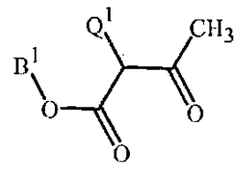
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-pyridinyl
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-thienyl
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-thienyl
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

The present disclosure also includes Tables 762 through 764, each of which is constructed the same as Table 761 above, except that the row heading in Table 761 (i.e. "Each R^{33} is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 762 the row heading is "Each R^{33} is Et.", and Q^1 is as defined in Table 761 above. Thus, the first entry in Table 762 specifically discloses 3-(2,6-difluorophenyl)-4,4-bis(ethylthio)-3-buten-2-one. Tables 763 and 764 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
762	Each R^{33} is Et.	764	The two R^{33} are taken together as $-CH_2-$.
763	Each R^{33} is *n*-Pr.		

The compounds of Tables 761 through 763 illustrate compounds of Formula **18** wherein R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare intermediate compounds of Formula **17** using the method of Scheme 17. The compounds of Table 764 illustrate compounds of Formula **18** wherein R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare intermediate compounds of Formula **4c** using the method described below Scheme 17.

TABLE 765



B^1 is Me.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-pyridinyl
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-thienyl
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-thienyl
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

The present disclosure also includes Tables 766 through 769, each of which is constructed the same as Table 765 above, except that the row heading in Table 765 (i.e. "B^1

is Me.") is replaced with the respective row heading shown below. For Example, in Table 766 the row heading is "B^1 is Et.", and Q^1 is as defined in Table 765 above. Thus, the first entry in Table 766 specifically discloses ethyl α-acetyl-2,6-difluorobenzeneacetate. Tables 767 through 769 are constructed similarly.

Table	Row Heading	Table	Row Heading
766	B^1 is Et.	768	B^1 is Ph.
767	B^1 is is *n*-Pr.	769	B^1 is CH_2Ph.

The compounds of Tables 765 through 769 illustrate compounds of Formula **16** wherein R^2 is CH_3, which are useful intermediates to prepare intermediate compounds of Formula **4b** using the method of Scheme 14.

Formulation/Utility

A compound of this invention will generally be used as a fungicidal active ingredient in a composition, i.e. formulation, with at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents, which serves as a carrier. The formulation or composition ingredients are selected to be consistent with the physical properties of the active ingredient, mode of application and environmental factors such as soil type, moisture and temperature.

Useful formulations include both liquid and solid compositions. Liquid compositions include solutions (including emulsifiable concentrates), suspensions, emulsions (including microemulsions and/or suspoemulsions) and the like, which optionally can be thickened into gels. The general types of aqueous liquid compositions are soluble concentrate, suspension concentrate, capsule suspension, concentrated emulsion, microemulsion and suspo-emulsion. The general types of nonaqueous liquid compositions are emulsifiable concentrate, microemulsifiable concentrate, dispersible concentrate and oil dispersion.

The general types of solid compositions are dusts, powders, granules, pellets, prills, pastilles, tablets, filled films (including seed coatings) and the like, which can be water-dispersible ("wettable") or water-soluble. Films and coatings formed from film-forming solutions or flowable suspensions are particularly useful for seed treatment. Active ingredient can be (micro)encapsulated and further formed into a suspension or solid formulation; alternatively the entire formulation of active ingredient can be encapsulated (or "overcoated"). Encapsulation can control or delay release of the active ingredient. An emulsifiable granule combines the advantages of both an emulsifiable concentrate formulation and a dry granular formulation. High-strength compositions are primarily used as intermediates for further formulation.

Sprayable formulations are typically extended in a suitable medium before spraying. Such liquid and solid formulations are formulated to be readily diluted in the spray medium, usually water. Spray volumes can range from about from about one to several thousand liters per hectare, but more typically are in the range from about ten to several hundred liters

per hectare. Sprayable formulations can be tank mixed with water or another suitable medium for foliar treatment by aerial or ground application, or for application to the growing medium of the plant. Liquid and dry formulations can be metered directly into drip irrigation systems or metered into the furrow during planting. Liquid and solid formulations can be applied onto seeds of crops and other desirable vegetation as seed treatments before planting to protect developing roots and other subterranean plant parts and/or foliage through systemic uptake.

The formulations will typically contain effective amounts of active ingredient, diluent and surfactant within the following approximate ranges which add up to 100 percent by weight.

	Weight Percent		
	Active Ingredient	Diluent	Surfactant
Water-Dispersible and Water-soluble Granules, Tablets and Powders	0.001–90	0–99.999	0–15
Oil Dispersions, Suspensions, Emulsions, Solutions (including Emulsifiable Concentrates)	1–50	40–99	0–50
Dusts	1–25	70–99	0–5
Granules and Pellets	0.001–95	5–99.999	0–15
High Strength Compositions	90–99	0–10	0–2

Solid diluents include, for example, clays such as bentonite, montmorillonite, attapulgite and kaolin, gypsum, cellulose, titanium dioxide, zinc oxide, starch, dextrin, sugars (e.g., lactose, sucrose), silica, talc, mica, diatomaceous earth, urea, calcium carbonate, sodium carbonate and bicarbonate, and sodium sulfate. Typical solid diluents are described in Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Liquid diluents include, for example, water, *N,N*-dimethylalkanamides (e.g., *N,N*-dimethylformamide), limonene, dimethyl sulfoxide, *N*-alkylpyrrolidones (e.g., *N*-methylpyrrolidinone), ethylene glycol, triethylene glycol, propylene glycol, dipropylene glycol, polypropylene glycol, propylene carbonate, butylene carbonate, paraffins (e.g., white mineral oils, normal paraffins, isoparaffins), alkylbenzenes, alkylnaphthalenes, glycerine, glycerol triacetate, sorbitol, triacetin, aromatic hydrocarbons, dearomatized aliphatics, alkylbenzenes, alkylnaphthalenes, ketones such as cyclohexanone, 2-heptanone, isophorone and 4-hydroxy-4-methyl-2-pentanone, acetates such as isoamyl acetate, hexyl acetate, heptyl acetate, octyl acetate, nonyl acetate, tridecyl acetate and isobornyl acetate, other esters such

as alkylated lactate esters, dibasic esters and γ-butyrolactone, and alcohols, which can be linear, branched, saturated or unsaturated, such as methanol, ethanol, *n*-propanol, isopropyl alcohol, *n*-butanol, isobutyl alcohol, *n*-hexanol, 2-ethylhexanol, *n*-octanol, decanol, isodecyl alcohol, isooctadecanol, cetyl alcohol, lauryl alcohol, tridecyl alcohol, oleyl alcohol, cyclohexanol, tetrahydrofurfuryl alcohol, diacetone alcohol and benzyl alcohol. Liquid diluents also include glycerol esters of saturated and unsaturated fatty acids (typically C_6–C_{22}), such as plant seed and fruit oils (e.g, oils of olive, castor, linseed, sesame, corn (maize), peanut, sunflower, grapeseed, safflower, cottonseed, soybean, rapeseed, coconut and palm kernel), animal-sourced fats (e.g., beef tallow, pork tallow, lard, cod liver oil, fish oil), and mixtures thereof. Liquid diluents also include alkylated fatty acids (e.g., methylated, ethylated, butylated) wherein the fatty acids may be obtained by hydrolysis of glycerol esters from plant and animal sources, and can be purified by distillation. Typical liquid diluents are described in Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

The solid and liquid compositions of the present invention often include one or more surfactants. When added to a liquid, surfactants (also known as "surface-active agents") generally modify, most often reduce, the surface tension of the liquid. Depending on the nature of the hydrophilic and lipophilic groups in a surfactant molecule, surfactants can be useful as wetting agents, dispersants, emulsifiers or defoaming agents.

Surfactants can be classified as nonionic, anionic or cationic. Nonionic surfactants useful for the present compositions include, but are not limited to: alcohol alkoxylates such as alcohol alkoxylates based on natural and synthetic alcohols (which may be branched or linear) and prepared from the alcohols and ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof; amine ethoxylates, alkanolamides and ethoxylated alkanolamides; alkoxylated triglycerides such as ethoxylated soybean, castor and rapeseed oils; alkylphenol alkoxylates such as octylphenol ethoxylates, nonylphenol ethoxylates, dinonyl phenol ethoxylates and dodecyl phenol ethoxylates (prepared from the phenols and ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof); block polymers prepared from ethylene oxide or propylene oxide and reverse block polymers where the terminal blocks are prepared from propylene oxide; ethoxylated fatty acids; ethoxylated fatty esters and oils; ethoxylated methyl esters; ethoxylated tristyrylphenol (including those prepared from ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof); fatty acid esters, glycerol esters, lanolin-based derivatives, polyethoxylate esters such as polyethoxylated sorbitan fatty acid esters, polyethoxylated sorbitol fatty acid esters and polyethoxylated glycerol fatty acid esters; other sorbitan derivatives such as sorbitan esters; polymeric surfactants such as random copolymers, block copolymers, alkyd peg (polyethylene glycol) resins, graft or comb polymers and star polymers; polyethylene glycols (pegs); polyethylene

glycol fatty acid esters; silicone-based surfactants; and sugar-derivatives such as sucrose esters, alkyl polyglycosides and alkyl polysaccharides.

Useful anionic surfactants include, but are not limited to: alkylaryl sulfonic acids and their salts; carboxylated alcohol or alkylphenol ethoxylates; diphenyl sulfonate derivatives; lignin and lignin derivatives such as lignosulfonates; maleic or succinic acids or their anhydrides; olefin sulfonates; phosphate esters such as phosphate esters of alcohol alkoxylates, phosphate esters of alkylphenol alkoxylates and phosphate esters of styryl phenol ethoxylates; protein-based surfactants; sarcosine derivatives; styryl phenol ether sulfate; sulfates and sulfonates of oils and fatty acids; sulfates and sulfonates of ethoxylated alkylphenols; sulfates of alcohols; sulfates of ethoxylated alcohols; sulfonates of amines and amides such as *N,N*-alkyltaurates; sulfonates of benzene, cumene, toluene, xylene, and dodecyl and tridecylbenzenes; sulfonates of condensed naphthalenes; sulfonates of naphthalene and alkyl naphthalene; sulfonates of fractionated petroleum; sulfosuccinamates; and sulfosuccinates and their derivatives such as dialkyl sulfosuccinate salts.

Useful cationic surfactants include, but are not limited to: amides and ethoxylated amides; amines such as *N*-alkyl propanediamines, tripropylenetriamines and dipropylenetetramines, and ethoxylated amines, ethoxylated diamines and propoxylated amines (prepared from the amines and ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof); amine salts such as amine acetates and diamine salts; quaternary ammonium salts such as quaternary salts, ethoxylated quaternary salts and diquaternary salts; and amine oxides such as alkyldimethylamine oxides and bis-(2-hydroxyethyl)-alkylamine oxides.

Also useful for the present compositions are mixtures of nonionic and anionic surfactants or mixtures of nonionic and cationic surfactants. Nonionic, anionic and cationic surfactants and their recommended uses are disclosed in a variety of published references including *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Compositions of this invention may also contain formulation auxiliaries and additives, known to those skilled in the art as formulation aids (some of which may be considered to also function as solid diluents, liquid diluents or surfactants). Such formulation auxiliaries and additives may control: pH (buffers), foaming during processing (antifoams such polyorganosiloxanes), sedimentation of active ingredients (suspending agents), viscosity (thixotropic thickeners), in-container microbial growth (antimicrobials), product freezing (antifreezes), color (dyes/pigment dispersions), wash-off (film formers or stickers), evaporation (evaporation retardants), and other formulation attributes. Film formers include,

for example, polyvinyl acetates, polyvinyl acetate copolymers, polyvinylpyrrolidone-vinyl acetate copolymer, polyvinyl alcohols, polyvinyl alcohol copolymers and waxes. Examples of formulation auxiliaries and additives include those listed in *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; and PCT Publication WO 03/024222.

The compound of Formula 1 and any other active ingredients are typically incorporated into the present compositions by dissolving the active ingredient in a solvent or by grinding in a liquid or dry diluent. Solutions, including emulsifiable concentrates, can be prepared by simply mixing the ingredients. If the solvent of a liquid composition intended for use as an emulsifiable concentrate is water-immiscible, an emulsifier is typically added to emulsify the active-containing solvent upon dilution with water. Active ingredient slurries, with particle diameters of up to 2,000 μm can be wet milled using media mills to obtain particles with average diameters below 3 μm. Aqueous slurries can be made into finished suspension concentrates (see, for example, U.S. 3,060,084) or further processed by spray drying to form water-dispersible granules. Dry formulations usually require dry milling processes, which produce average particle diameters in the 2 to 10 μm range. Dusts and powders can be prepared by blending and usually grinding (such as with a hammer mill or fluid-energy mill). Granules and pellets can be prepared by spraying the active material upon preformed granular carriers or by agglomeration techniques. See Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8–57 and following, and WO 91/13546. Pellets can be prepared as described in U.S. 4,172,714. Water-dispersible and water-soluble granules can be prepared as taught in U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 and DE 3,246,493. Tablets can be prepared as taught in U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 and U.S. 5,208,030. Films can be prepared as taught in GB 2,095,558 and U.S. 3,299,566.

For further information regarding the art of formulation, see T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. See also U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 and 169–182; U.S. 2,891,855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; and *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

In the following Examples, all percentages are by weight and all formulations are prepared in conventional ways. Compound numbers refer to compounds in Index Table A. Without further elaboration, it is believed that one skilled in the art using the preceding description can utilize the present invention to its fullest extent. The following Examples are, therefore, to be construed as merely illustrative, and not limiting of the disclosure in any way whatsoever. Percentages are by weight except where otherwise indicated.

Example A

High Strength Concentrate

Compound 18	98.5%
silica aerogel	0.5%
synthetic amorphous fine silica	1.0%

Example B

Wettable Powder

Compound 22	65.0%
dodecylphenol polyethylene glycol ether	2.0%
sodium ligninsulfonate	4.0%
sodium silicoaluminate	6.0%
montmorillonite (calcined)	23.0%

Example C

Granule

Compound 23	10.0%
attapulgite granules (low volatile matter, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25–50 sieves)	90.0%

Example D

Extruded Pellet

Compound 24	25.0%
anhydrous sodium sulfate	10.0%
crude calcium ligninsulfonate	5.0%
sodium alkylnaphthalenesulfonate	1.0%
calcium/magnesium bentonite	59.0%

Example E

Emulsifiable Concentrate

Compound 36	10.0%
polyoxyethylene sorbitol hexoleate	20.0%
C_6–C_{10} fatty acid methyl ester	70.0%

Example F

Microemulsion

Compound 41	5.0%
polyvinylpyrrolidone-vinyl acetate copolymer	30.0%
alkylpolyglycoside	30.0%
glyceryl monooleate	15.0%
water	20.0%

Example G

Seed Treatment

Compound 45	20.00%
polyvinylpyrrolidone-vinyl acetate copolymer	5.00%
montan acid wax	5.00%
calcium ligninsulfonate	1.00%
polyoxyethylene/polyoxypropylene block copolymers	1.00%
stearyl alcohol (POE 20)	2.00%
polyorganosilane	0.20%
colorant red dye	0.05%
water	65.75%

Formulations such as those in the Formulation Table are typically diluted with water to form aqueous compositions before application. Aqueous compositions for direct applications to the plant or portion thereof (e.g., spray tank compositions) typically at least about 1 ppm or more (e.g., from 1 ppm to 100 ppm) of the compound(s) of this invention.

The compounds of this invention are useful as plant disease control agents. The present invention therefore further comprises a method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof to be protected, or to the plant seed to be protected, an effective amount of a compound of the invention or a fungicidal composition containing said compound. The compounds and/or compositions of this invention provide control of diseases caused by a broad spectrum of fungal plant pathogens in the Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete and Deuteromycete classes. They are effective in controlling a broad spectrum of plant diseases, particularly foliar pathogens of ornamental, turf, vegetable, field, cereal, and fruit crops. These pathogens include: Oomycetes, including *Phytophthora* diseases such as *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* and *Phytophthora capsici*, *Pythium* diseases such as *Pythium aphanidermatum*, and diseases in the Peronosporaceae family such as *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (including *Peronospora tabacina* and *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (including *Pseudoperonospora cubensis)* and *Bremia lactucae*; Ascomycetes, including *Alternaria* diseases such as *Alternaria solani* and *Alternaria brassicae*, *Guignardia* diseases such as

Guignardia bidwell, *Venturia* diseases such as *Venturia inaequalis*, *Septoria* diseases such as *Septoria nodorum* and *Septoria tritici*, powdery mildew diseases such as *Erysiphe* spp. (including *Erysiphe graminis* and *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necatur*, *Sphaerotheca fuligena* and *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercosporella herpotrichoides*, *Botrytis* diseases such as *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, *Sclerotinia* diseases such as *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, *Helminthosporium* diseases such as *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, anthracnose diseases such as *Glomerella* or *Colletotrichum* spp. (such as *Colletotrichum graminicola* and *Colletotrichum orbiculare*), and *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomycetes, including rust diseases caused by *Puccinia* spp. (such as *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* and *Puccinia arachidis)*, *Hemileia vastatrix* and *Phakopsora pachyrhizi*; other pathogens including *Rutstroemia floccosum* (also known as *Sclerontina homoeocarpa*); *Rhizoctonia* spp. (such as *Rhizoctonia solani)*; *Fusarium* diseases such as *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* and *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* and *Cercospora beticola*; and other genera and species closely related to these pathogens. In addition to their fungicidal activity, the compositions or combinations also have activity against bacteria such as *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae*, and other related species.

Plant disease control is ordinarily accomplished by applying an effective amount of a compound of this invention either pre- or post-infection, to the portion of the plant to be protected such as the roots, stems, foliage, fruit, seeds, tubers or bulbs, or to the media (soil or sand) in which the plants to be protected are growing. The compounds can also be applied to seeds to protect the seeds and seedlings developing from the seeds. The compounds can also be applied through irrigation water to treat plants.

Accordingly, this aspect of the present invention can also be described as a method for protecting a plant or plant seed from diseases caused by fungal pathogens comprising applying a fungicidally effective amount of a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or salt thereof to the plant (or portion thereof) or plant seed (directly or through the environment (e.g., growing medium) of the plant or plant seed).

Rates of application for these compounds can be influenced by many factors of the environment and should be determined under actual use conditions. Foliage can normally be protected when treated at a rate of from less than about 1 g/ha to about 5,000 g/ha of active ingredient. Seed and seedlings can normally be protected when seed is treated at a rate of from about 0.1 to about 10 g per kilogram of seed.

Compounds of this invention can also be mixed with one or more other biologically active compounds or agents including fungicides, insecticides, nematocides, bactericides, acaricides, herbicides, herbicide safeners, growth regulators such as insect molting inhibitors

and rooting stimulants, chemosterilants, semiochemicals, repellents, attractants, pheromones, feeding stimulants, plant nutrients, other biologically active compounds or entomopathogenic bacteria, virus or fungi to form a multi-component pesticide giving an even broader spectrum of agricultural protection. Thus the present invention also pertains to a composition comprising a fungicidally effective amount of a compound of Formula 1 and a biologically effective amount of at least one additional biologically active compound or agent and can further comprise at least one of a surfactant, a solid diluent or a liquid diluent. The other biologically active compounds or agents can be formulated in compositions comprising at least one of a surfactant, solid or liquid diluent. For mixtures of the present invention, one or more other biologically active compounds or agents can be formulated together with a compound of Formula **1**, to form a premix, or one or more other biologically active compounds or agents can be formulated separately from the compound of Formula **1**, and the formulations combined together before application (e.g., in a spray tank) or, alternatively, applied in succession.

As mentioned in the Summary of the Invention, one aspect of the present invention is a fungicidal composition comprising (i.e. a mixture or combination of) a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or a salt thereof (i.e. component a), and at least one other fungicide (i.e. component b).

Of note is a composition which, in addition to the Formula **1** compound of component (a), includes as component (b) at least one fungicidal compound selected from the group consisting of the classes (b1) methyl benzimidazole carbamate (MBC) fungicides; (b2) dicarboximide fungicides; (b3) demethylation inhibitor (DMI) fungicides; (b4) phenylamide fungicides; (b5) amine/morpholine fungicides; (b6) phospholipid biosynthesis inhibitor fungicides; (b7) carboxamide fungicides; (b8) hydroxy(2-amino-)pyrimidine fungicides; (b9) anilinopyrimidine fungicides; (b10) *N*-phenyl carbamate fungicides; (b11) quinone outside inhibitor (QoI) fungicides; (b12) phenylpyrrole fungicides; (b13) quinoline fungicides; (b14) lipid peroxidation inhibitor fungicides; (b15) melanin biosynthesis inhibitors-reductase (MBI-R) fungicides; (b16) melanin biosynthesis inhibitors-dehydratase (MBI-D) fungicides; (b17) hydroxyanilide fungicides; (b18) squalene-epoxidase inhibitor fungicides; (b19) polyoxin fungicides; (b20) phenylurea fungicides; (b21) quinone inside inhibitor (QiI) fungicides; (b22) benzamide fungicides; (b23) enopyranuronic acid antibiotic fungicides; (b24) hexopyranosyl antibiotic fungicides; (b25) glucopyranosyl antibiotic: protein synthesis fungicides; (b26) glucopyranosyl antibiotic: trehalase and inositol biosynthesis fungicides; (b27) cyanoacetamideoxime fungicides; (b28) carbamate fungicides; (b29) oxidative phosphorylation uncoupling fungicides; (b30) organo tin fungicides; (b31) carboxylic acid fungicides; (b32) heteroaromatic fungicides; (b33) phosphonate fungicides; (b34) phthalamic acid fungicides; (b35) benzotriazine fungicides; (b36) benzene-sulfonamide fungicides; (b37) pyridazinone fungicides; (b38) thiophene-carboxamide fungicides; (b39)

pyrimidinamide fungicides; (b40) carboxylic acid amide (CAA) fungicides; (b41) tetracycline antibiotic fungicides; (b42) thiocarbamate fungicides; (b43) benzamide fungicides; (b44) host plant defense induction fungicides; (b45) multi-site contact activity fungicides; (b46) fungicides other than classes (b1) through (b45); and salts of compounds of classes (b1) through (b46).

Further descriptions of these classes of fungicidal compounds are provided below.

(b1) "Methyl benzimidazole carbamate (MBC) fungicides" (FRAC (Fungicide Resistance Action Committee) code 1) inhibit mitosis by binding to β-tubulin during microtubule assembly. Inhibition of microtubule assembly can disrupt cell division, transport within the cell and cell structure. Methyl benzimidazole carbamate fungicides include benzimidazole and thiophanate fungicides. The benzimidazoles include benomyl, carbendazim, fuberidazole and thiabendazole. The thiophanates include thiophanate and thiophanate-methyl.

(b2) "Dicarboximide fungicides" (FRAC code 2) are proposed to inhibit a lipid peroxidation in fungi through interference with NADH cytochrome c reductase. Examples include chlozolinate, iprodione, procymidone and vinclozolin.

(b3) "Demethylation inhibitor (DMI) fungicides" (FRAC code 3) inhibit C14-demethylase which plays a role in sterol production. Sterols, such as ergosterol, are needed for membrane structure and function, making them essential for the development of functional cell walls. Therefore, exposure to these fungicides result in abnormal growth and eventually death of sensitive fungi. DMI fungicides are divided between several chemical classes: azoles (including triazoles and imidazoles), pyrimidines, piperazines and pyridines. The triazoles include azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole (including diniconazole-M), epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prothioconazole, quinconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole and uniconazole. The imidazoles include clotrimazole, econazole, imazalil, isoconazole, miconazole, oxpoconazole, prochloraz, pefurazoate and triflumizole. The pyrimidines include fenarimol, nuarimol and triarimol. The piperazines include triforine. The pyridines include buthiobate and pyrifenox. Biochemical investigations have shown that all of the above mentioned fungicides are DMI fungicides as described by K. H. Kuck et al. in *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205–258.

(b4) "Phenylamide fungicides" (FRAC code 4) are specific inhibitors of RNA polymerase in Oomycete fungi. Sensitive fungi exposed to these fungicides show a reduced capacity to incorporate uridine into rRNA. Growth and development in sensitive fungi is prevented by exposure to this class of fungicide. Phenylamide fungicides include

acylalanine, oxazolidinone and butyrolactone fungicides. The acylalanines include benalaxyl, benalaxyl-M, furalaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M (also known as mefenoxam). The oxazolidinones include oxadixyl. The butyrolactones include ofurace.

(b5) "Amine/morpholine fungicides" (FRAC code 5) inhibit two target sites within the sterol biosynthetic pathway, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerase and Δ^{14} reductase. Sterols, such as ergosterol, are needed for membrane structure and function, making them essential for the development of functional cell walls. Therefore, exposure to these fungicides results in abnormal growth and eventually death of sensitive fungi. Amine/morpholine fungicides (also known as non-DMI sterol biosynthesis inhibitors) include morpholine, piperidine and spiroketal-amine fungicides. The morpholines include aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph and trimorphamide. The piperidines include fenpropidin and piperalin. The spiroketal-amines include spiroxamine.

(b6) "Phospholipid biosynthesis inhibitor fungicides" (FRAC code 6) inhibit growth of fungi by affecting phospholipid biosynthesis. Phospholipid biosynthesis fungicides include phosphorothiolate and dithiolane fungicides. The phosphorothiolates include edifenphos, iprobenfos and pyrazophos. The dithiolanes include isoprothiolane.

(b7) "Carboxamide fungicides" (FRAC code 7) inhibit Complex II (succinate dehydrogenase) fungal respiration by disrupting a key enzyme in the Krebs Cycle (TCA cycle) named succinate dehydrogenase. Inhibiting respiration prevents the fungus from making ATP, and thus inhibits growth and reproduction. Carboxamide fungicides include benzamide, furan carboxamide, oxathiin carboxamide, thiazole carboxamide, pyrazole carboxamide and pyridine carboxamide. The benzamides include benodanil, flutolanil and mepronil. The furan carboxamides include fenfuram. The oxathiin carboxamides include carboxin and oxycarboxin. The thiazole carboxamides include thifluzamide. The pyrazole carboxamides include bixafen, furametpyr, isopyrazam, fluxapyroxad, sedaxane (*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-bicyclopropyl]-2-ylphenyl]-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide) and penflufen (*N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide (PCT Patent Publication WO 2003/010149)). The pyridine carboxamides include boscalid.

(b8) "Hydroxy(2-amino-)pyrimidine fungicides" (FRAC code 8) inhibit nucleic acid synthesis by interfering with adenosine deaminase. Examples include bupirimate, dimethirimol and ethirimol.

(b9) "Anilinopyrimidine fungicides" (FRAC code 9) are proposed to inhibit biosynthesis of the amino acid methionine and to disrupt the secretion of hydrolytic enzymes that lyse plant cells during infection. Examples include cyprodinil, mepanipyrim and pyrimethanil.

(b10) "*N*-Phenyl carbamate fungicides" (FRAC code 10) inhibit mitosis by binding to β-tubulin and disrupting microtubule assembly. Inhibition of microtubule assembly can

disrupt cell division, transport within the cell and cell structure. Examples include diethofencarb.

(b11) "Quinone outside inhibitor (QoI) fungicides" (FRAC code 11) inhibit Complex III mitochondrial respiration in fungi by affecting ubiquinol oxidase. Oxidation of ubiquinol is blocked at the "quinone outside" (Q_o) site of the cytochrome bc_1 complex, which is located in the inner mitochondrial membrane of fungi. Inhibiting mitochondrial respiration prevents normal fungal growth and development. Quinone outside inhibitor fungicides (also known as strobilurin fungicides) include methoxyacrylate, methoxycarbamate, oximinoacetate, oximinoacetamide, oxazolidinedione, dihydrodioxazine, imidazolinone and benzylcarbamate fungicides. The methoxyacrylates include azoxystrobin, enestroburin (SYP-Z071) and picoxystrobin. The methoxycarbamates include pyraclostrobin and pyrametostrobin. The oximinoacetates include kresoxim-methyl, pyraoxystrobin and trifloxystrobin. The oximinoacetamides include dimoxystrobin, metominostrobin, orysastrobin, α-[methoxyimino]-*N*-methyl-2-[[[1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethoxy]imino]-methyl]benzeneacetamide and 2-[[[3-(2,6-dichlorophenyl)-1-methyl-2-propen-1-ylidene]-amino]oxy]methyl]-α-(methoxyimino)-*N*-methylbenzeneacetamide. The oxazolidinediones include famoxadone. The dihydrodioxazines include fluoxastrobin. The imidazolinones include fenamidone. The benzylcarbamates include pyribencarb.

(b12) "Phenylpyrrole fungicides" (FRAC code 12) inhibit a MAP protein kinase associated with osmotic signal transduction in fungi. Fenpiclonil and fludioxonil are examples of this fungicide class.

(b13) "Quinoline fungicides" (FRAC code 13) are proposed to inhibit signal transduction by affecting G-proteins in early cell signaling. They have been shown to interfere with germination and/or appressorium formation in fungi that cause powder mildew diseases. Quinoxyfen is an example of this class of fungicide.

(b14) "Lipid peroxidation inhibitor fungicides" (FRAC code 14) are proposed to inhibit lipid peroxidation which affects membrane synthesis in fungi. Members of this class, such as etridiazole, may also affect other biological processes such as respiration and melanin biosynthesis. Lipid peroxidation fungicides include aromatic carbon and 1,2,4-thiadiazole fungicides. The aromatic carbon fungicides include biphenyl, chloroneb, dicloran, quintozene, tecnazene and tolclofos-methyl. The 1,2,4-thiadiazole fungicides include etridiazole.

(b15) "Melanin biosynthesis inhibitors-reductase (MBI-R) fungicides" (FRAC code 16.1) inhibit the naphthal reduction step in melanin biosynthesis. Melanin is required for host plant infection by some fungi. Melanin biosynthesis inhibitors-reductase fungicides include isobenzofuranone, pyrroloquinolinone and triazolobenzothiazole fungicides. The isobenzofuranones include fthalide. The pyrroloquinolinones include pyroquilon. The triazolobenzothiazoles include tricyclazole.

(b16) "Melanin biosynthesis inhibitors-dehydratase (MBI-D) fungicides" (FRAC code 16.2) inhibit scytalone dehydratase in melanin biosynthesis. Melanin in required for host plant infection by some fungi. Melanin biosynthesis inhibitors-dehydratase fungicides include cyclopropanecarboxamide, carboxamide and propionamide fungicides. The cyclopropanecarboxamides include carpropamid. The carboxamides include diclocymet. The propionamides include fenoxanil.

(b17) "Hydroxyanilide fungicides (FRAC code 17) inhibit C4-demethylase which plays a role in sterol production. Examples include fenhexamid.

(b18) "Squalene-epoxidase inhibitor fungicides" (FRAC code 18) inhibit squalene-epoxidase in ergosterol biosynthesis pathway. Sterols such as ergosterol are needed for membrane structure and function, making them essential for the development of functional cell walls. Therefore exposure to these fungicides results in abnormal growth and eventually death of sensitive fungi. Squalene-epoxidase inhibitor fungicides include thiocarbamate and allylamine fungicides. The thiocarbamates include pyributicarb. The allylamines include naftifine and terbinafine.

(b19) "Polyoxin fungicides" (FRAC code 19) inhibit chitin synthase. Examples include polyoxin.

(b20) "Phenylurea fungicides" (FRAC code 20) are proposed to affect cell division. Examples include pencycuron.

(b21) "Quinone inside inhibitor (QiI) fungicides" (FRAC code 21) inhibit Complex III mitochondrial respiration in fungi by affecting ubiquinol reductase. Reduction of ubiquinol is blocked at the "quinone inside" (Q_i) site of the cytochrome bc_1 complex, which is located in the inner mitochondrial membrane of fungi. Inhibiting mitochondrial respiration prevents normal fungal growth and development. Quinone inside inhibitor fungicides include cyanoimidazole and sulfamoyltriazole fungicides. The cyanoimidazoles include cyazofamid. The sulfamoyltriazoles include amisulbrom.

(b22) "Benzamide fungicides" (FRAC code 22) inhibit mitosis by binding to β-tubulin and disrupting microtubule assembly. Inhibition of microtubule assembly can disrupt cell division, transport within the cell and cell structure. Examples include zoxamide.

(b23) "Enopyranuronic acid antibiotic fungicides" (FRAC code 23) inhibit growth of fungi by affecting protein biosynthesis. Examples include blasticidin-S.

(b24) "Hexopyranosyl antibiotic fungicides" (FRAC code 24) inhibit growth of fungi by affecting protein biosynthesis. Examples include kasugamycin.

(b25) "Glucopyranosyl antibiotic: protein synthesis fungicides" (FRAC code 25) inhibit growth of fungi by affecting protein biosynthesis. Examples include streptomycin.

(b26) "Glucopyranosyl antibiotic: trehalase and inositol biosynthesis fungicides" (FRAC code 26) inhibit trehalase in inositol biosynthesis pathway. Examples include validamycin.

(b27) "Cyanoacetamideoxime fungicides (FRAC code 27) include cymoxanil.

(b28) "Carbamate fungicides" (FRAC code 28) are considered multi-site inhibitors of fungal growth. They are proposed to interfere with the synthesis of fatty acids in cell membranes, which then disrupts cell membrane permeability. Propamacarb, propamacarb-hydrochloride, iodocarb, and prothiocarb are examples of this fungicide class.

(b29) "Oxidative phosphorylation uncoupling fungicides" (FRAC code 29) inhibit fungal respiration by uncoupling oxidative phosphorylation. Inhibiting respiration prevents normal fungal growth and development. This class includes 2,6-dinitroanilines such as fluazinam, pyrimidonehydrazones such as ferimzone and dinitrophenyl crotonates such as dinocap, meptyldinocap and binapacryl.

(b30) "Organo tin fungicides" (FRAC code 30) inhibit adenosine triphosphate (ATP) synthase in oxidative phosphorylation pathway. Examples include fentin acetate, fentin chloride and fentin hydroxide.

(b31) "Carboxylic acid fungicides" (FRAC code 31) inhibit growth of fungi by affecting deoxyribonucleic acid (DNA) topoisomerase type II (gyrase). Examples include oxolinic acid.

(b32) "Heteroaromatic fungicides" (FRAC code 32) are proposed to affect DNA/ribonucleic acid (RNA) synthesis. Heteroaromatic fungicides include isoxazole and isothiazolone fungicides. The isoxazoles include hymexazole and the isothiazolones include octhilinone.

(b33) "Phosphonate fungicides" (FRAC code 33) include phosphorous acid and its various salts, including fosetyl-aluminum.

(b34) "Phthalamic acid fungicides" (FRAC code 34) include teclofthalam.

(b35) "Benzotriazine fungicides" (FRAC code 35) include triazoxide.

(b36) "Benzene-sulfonamide fungicides" (FRAC code 36) include flusulfamide.

(b37) "Pyridazinone fungicides" (Fungicide Resistance Action Committee (FRAC) code 37) include diclomezine.

(b38) "Thiophene-carboxamide fungicides" (FRAC code 38) are proposed to affect ATP production. Examples include silthiofam.

(b39) "Pyrimidinamide fungicides" (FRAC code 39) inhibit growth of fungi by affecting phospholipid biosynthesis and include diflumetorim.

(b40) "Carboxylic acid amide (CAA) fungicides" (FRAC code 40) are proposed to inhibit phospholipid biosynthesis and cell wall deposition. Inhibition of these processes prevents growth and leads to death of the target fungus. Carboxylic acid amide fungicides include cinnamic acid amide, valinamide carbamate and mandelic acid amide fungicides. The cinnamic acid amides include dimethomorph and flumorph. The valinamide carbamates include benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, iprovalicarb and valifenalate (valiphenal). The mandelic acid amides include mandipropamid, *N*-[2-[4-[[3-(4-

chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)-amino]butanamide and *N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]-ethyl]-3-methyl-2-[(ethylsulfonyl)amino]butanamide.

(b41) "Tetracycline antibiotic fungicides" (FRAC code 41) inhibit growth of fungi by affecting complex 1 nicotinamide adenine dinucleotide (NADH) oxidoreductase. Examples include oxytetracycline.

(b42) "Thiocarbamate fungicides (b42)" (FRAC code 42) include methasulfocarb.

(b43) "Benzamide fungicides" (FRAC code 43) inhibit growth of fungi by delocalization of spectrin-like proteins. Examples include acylpicolide fungicides such as fluopicolide and fluopyram.

(b44) "Host plant defense induction fungicides" (FRAC code P) induce host plant defense mechanisms. Host plant defense induction fungicides include benzo-thiadiazole, benzisothiazole and thiadiazole-carboxamide fungicides. The benzo-thiadiazoles include acibenzolar-*S*-methyl. The benzisothiazoles include probenazole. The thiadiazole-carboxamides include tiadinil and isotianil.

(b45) "Multi-site contact fungicides" inhibit fungal growth through multiple sites of action and have contact/preventive activity. This class of fungicides includes: (b45.1) "copper fungicides" (FRAC code M1)", (b45.2) "sulfur fungicides" (FRAC code M2), (b45.3) "dithiocarbamate fungicides" (FRAC code M3), (b45.4) "phthalimide fungicides" (FRAC code M4), (b45.5) "chloronitrile fungicides" (FRAC code M5), (b45.6) "sulfamide fungicides" (FRAC code M6), (b45.7) "guanidine fungicides" (FRAC code M7), (b45.8) "triazine fungicides" (FRAC code M8) and (b45.9) "quinone fungicides" (FRAC code M9). "Copper fungicides" are inorganic compounds containing copper, typically in the copper(II) oxidation state; examples include copper oxychloride, copper sulfate and copper hydroxide, including compositions such as Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate). "Sulfur fungicides" are inorganic chemicals containing rings or chains of sulfur atoms; examples include elemental sulfur. "Dithiocarbamate fungicides" contain a dithiocarbamate molecular moiety; examples include mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, thiram, zineb and ziram. "Phthalimide fungicides" contain a phthalimide molecular moiety; examples include folpet, captan and captafol. "Chloronitrile fungicides" contain an aromatic ring substituted with chloro and cyano; examples include chlorothalonil. "Sulfamide fungicides" include dichlofluanid and tolyfluanid. "Guanidine fungicides" include dodine, guazatine and imoctadine, including iminoctadine albesilate and iminoctadine triacetate. "Triazine fungicides" include anilazine. "Quinone fungicides" include dithianon.

(b46) "Fungicides other than fungicides of classes (b1) through (b45)" include certain fungicides whose mode of action may be unknown. These include: (b46.1) "thiazole carboxamide fungicides" (FRAC code U5), (b46.2) "phenyl-acetamide fungicides" (FRAC code U6), (b46.3) "quinazolinone fungicides" (FRAC code U7) and (b46.4) "benzophenone

fungicides" (FRAC code U8). The thiazole carboxamides include ethaboxam. The phenyl-acetamides include cyflufenamid and *N*-[[(cyclopropylmethoxy)amino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]-methylene]benzeneacetamide. The quinazolinones include proquinazid and 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-one. The benzophenones include metrafenone and pyriofenone. The (b46) class also includes bethoxazin, neo-asozin (ferric methanearsonate), fenpyrazamine, pyrrolnitrin, quinomethionate, tebufloquin, *N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxy-phenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]butanamide, *N*-[2-[4-[[3-(4-chloro-phenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(ethylsulfonyl)amino]-butanamide, 2-[[2-fluoro-5-(trifluoromethyl)phenyl]thio]-2-[3-(2-methoxyphenyl)-2-thiazolidinylidene]acetonitrile, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethyl-3-isoxazolidinyl]pyridine, 4-fluorophenyl *N*-[1-[[[1-(4-cyanophenyl)ethyl]sulfonyl]methyl]propyl]carbamate, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidine, *N*-(4-chloro-2-nitrophenyl)-*N*-ethyl-4-methylbenzenesulfonamide, *N*-[[(cyclopropylmethoxy)-amino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methylene]benzeneacetamide, *N'*-[4-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylmethanimid-amide and 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-methylethyl)-4-(2-methylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-one.

Therefore of note is a mixture (i.e. composition) comprising as component (a) a compound of Formula **1** (or an *N*-oxide or salt thereof) and as component (b) at least one fungicidal compound selected from the group consisting of the aforedescribed classes (b1) through (b46). Also of note are embodiments wherein component (b) comprises at least one fungicide from each of two different groups selected from (b1) through (b46). Also of note is a composition comprising said mixture (in fungicidally effective amount) and further comprising at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents. Of particular note is a mixture (i.e. composition) comprising a compound of Formula **1** and at least one fungicidal compound selected from the group of specific compounds listed above in connection with classes (b1) through (b46). Also of particular note is a composition comprising said mixture (in fungicidally effective amount) and further comprising at least one additional surfactant selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

Examples of other biologically active compounds or agents with which compounds of this invention can be formulated are: insecticides such as abamectin, acephate, acetamiprid, acetoprole, aldicarb, amidoflumet (S-1955), amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, buprofezin, carbofuran, cartap, chinomethionat, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorantraniliprole (DPX-E2Y45), chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorobenzilate, chromafenozide, clothianidin, cyantraniliprole (3-bromo-1-(3-chloro-2-pyridinyl)-*N*-[4-cyano-2-methyl-6-[(methylamino)-

carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazole-5-carboxamide), cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyhexatin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienochlor, diflubenzuron, dimefluthrin, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etoxazole, fenamiphos, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenpyroximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenerim (UR-50701), flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imicyafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, metofluthrin, monocrotophos, nitenpyram, nithiazine, novaluron (XDE-007), noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, prothiocarb, protrifenbute, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromesifen (BSN 2060), spirotetramat, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron; nematocides such as aldicarb, imicyafos, oxamyl and fenamiphos; bactericides such as streptomycin; acaricides such as amitraz, chinomethionat, chlorobenzilate, cyenopyrafen, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazole, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben and tebufenpyrad; and biological agents including entomopathogenic bacteria, such as *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, and the encapsulated delta-endotoxins of *Bacillus thuringiensis* (e.g., Cellcap, MPV, MPVII); entomopathogenic fungi, such as green muscardine fungus; and entomopathogenic virus including baculovirus, nucleopolyhedro virus (NPV) such as HzNPV, AfNPV; and granulosis virus (GV) such as CpGV.

General references for agricultural protectants (i.e. insecticides, fungicides, nematocides, acaricides, herbicides and biological agents) include *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

For embodiments where one or more of these various mixing partners are used, the weight ratio of these various mixing partners (in total) to the compound of Formula **1** (or an *N*-oxide or salt thereof) is typically between about 1:3000 and about 3000:1. Of note are weight ratios between about 1:300 and about 300:1 (for example ratios between about 1:30 and about 30:1). One skilled in the art can easily determine through simple experimentation the biologically effective amounts of active ingredients necessary for the desired spectrum of

biological activity. It will be evident that including these additional components may expand the spectrum of diseases controlled beyond the spectrum controlled by the compound of Formula 1 alone.

In certain instances, combinations of a compound of this invention with other biologically active (particularly fungicidal) compounds or agents (i.e. active ingredients) can result in a greater-than-additive (i.e. synergistic) effect. Reducing the quantity of active ingredients released in the environment while ensuring effective pest control is always desirable. When synergism of fungicidal active ingredients occurs at application rates giving agronomically satisfactory levels of fungal control, such combinations can be advantageous for reducing crop production cost and decreasing environmental load.

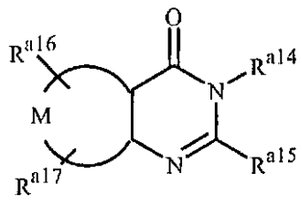
Compounds of this invention and compositions thereof can be applied to plants genetically transformed to express proteins toxic to invertebrate pests (such as *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins). The effect of the exogenously applied fungicidal compounds of this invention may be synergistic with the expressed toxin proteins.

Of note is a combination of a compound of Formula 1 (or an *N*-oxide or salt thereof) with at least one other fungicidal active ingredient. Of particular note is such a combination where the other fungicidal active ingredient has different site of action from the compound of Formula 1. In certain instances, a combination with at least one other fungicidal active ingredient having a similar spectrum of control but a different site of action will be particularly advantageous for resistance management. Thus, a composition of the present invention can further comprise a biologically effective amount of at least one additional fungicidal active ingredient having a similar spectrum of control but a different site of action.

Of particular note are compositions which in addition to a compound of Formula 1 include at least one compound selected from the group consisting of (1) alkylenebis(dithiocarbamate) fungicides; (2) cymoxanil; (3) phenylamide fungicides; (4) pyrimidinone fungicides; (5) chlorothalonil; (6) carboxamides acting at complex II of the fungal mitochondrial respiratory electron transfer site; (7) quinoxyfen; (8) metrafenone or pyriofenone; (9) cyflufenamid; (10) cyprodinil; (11) copper compounds; (12) phthalimide fungicides; (13) fosetyl-aluminum; (14) benzimidazole fungicides; (15) cyazofamid; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomycin; (20) dichlorophenyl dicarboximide fungicides; (21) zoxamide; (22) fluopicolide; (23) mandipropamid; (24) carboxylic acid amides acting on phospholipid biosynthesis and cell wall deposition; (25) dimethomorph; (26) non-DMI sterol biosynthesis inhibitors; (27) inhibitors of demethylase in sterol biosynthesis; (28) bc_1 complex fungicides; and salts of compounds of (1) through (28).

Further descriptions of classes of fungicidal compounds are provided below.

Pyrimidinone fungicides (group (4)) include compounds of Formula **A1**



A1

wherein M forms a fused phenyl, thiophene or pyridine ring; R^{a14} is C_1–C_6 alkyl; R^{a15} is C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 alkoxy; R^{a16} is halogen; and R^{a17} is hydrogen or halogen.

Pyrimidinone fungicides are described in PCT Patent Application Publication WO 94/26722 and U.S. Patents 6,066,638, 6,245,770, 6,262,058 and 6,277,858. Of note are pyrimidinone fungicides selected from the group: 6-bromo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6,8-diiodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone, 6-iodo-3-propyl-2-propyloxy-4(3*H*)-quinazolinone (proquinazid), 6-chloro-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, 6-bromo-2-propoxy-3-propylthieno[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, 7-bromo-2-propoxy-3-propylthieno[3,2-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, 6-bromo-2-propoxy-3-propylpyrido[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, 6,7-dibromo-2-propoxy-3-propylthieno[3,2-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one, and 3-(cyclopropylmethyl)-6-iodo-2-(propylthio)pyrido-[2,3-*d*]pyrimidin-4(3*H*)-one.

Sterol biosynthesis inhibitors (group (27)) control fungi by inhibiting enzymes in the sterol biosynthesis pathway. Demethylase-inhibiting fungicides have a common site of action within the fungal sterol biosynthesis pathway, involving inhibition of demethylation at position 14 of lanosterol or 24-methylene dihydrolanosterol, which are precursors to sterols in fungi. Compounds acting at this site are often referred to as demethylase inhibitors, DMI fungicides, or DMIs. The demethylase enzyme is sometimes referred to by other names in the biochemical literature, including cytochrome P-450 (14DM). The demethylase enzyme is described in, for example, *J. Biol. Chem.* **1992**, *267*, 13175–79 and references cited therein. DMI fungicides are divided between several chemical classes: azoles (including triazoles and imidazoles), pyrimidines, piperazines and pyridines. The triazoles include azaconazole, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole (including diniconazole-M), epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prothioconazole, quinconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole and uniconazole. The imidazoles include clotrimazole, econazole, imazalil, isoconazole, miconazole, oxpoconazole, prochloraz and triflumizole. The pyrimidines include fenarimol, nuarimol and triarimol. The piperazines include triforine. The pyridines include buthiobate and pyrifenox. Biochemical investigations have shown that all of the above mentioned fungicides are DMI

fungicides as described by K. H. Kuck et al. in *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205–258.

bc_1 Complex Fungicides (group 28) have a fungicidal mode of action which inhibits the bc_1 complex in the mitochondrial respiration chain. The bc_1 complex is sometimes referred to by other names in the biochemical literature, including complex III of the electron transfer chain, and ubihydroquinone:cytochrome *c* oxidoreductase. This complex is uniquely identified by Enzyme Commission number EC1.10.2.2. The bc_1 complex is described in, for example, *J. Biol. Chem.* **1989**, *264*, 14543–48; *Methods Enzymol.* **1986**, *126*, 253–71; and references cited therein. Strobilurin fungicides such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin (SYP-Z071), fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin and trifloxystrobin are known to have this mode of action (H. Sauter et al., *Angew. Chem. Int. Ed.* **1999**, *38*, 1328–1349). Other fungicidal compounds that inhibit the bc_1 complex in the mitochondrial respiration chain include famoxadone and fenamidone.

Alkylenebis(dithiocarbamate)s (group (1)) include compounds such as mancozeb, maneb, propineb and zineb. Phenylamides (group (3)) include compounds such as metalaxyl, benalaxyl, furalaxyl and oxadixyl. Carboxamides (group (6)) include compounds such as boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, fluxapyroxad, furametpyr, mepronil, oxycarboxin, thifluzamide, penthiopyrad and penflufen (*N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide (PCT Patent Publication WO 2003/010149)), and are known to inhibit mitochondrial function by disrupting complex II (succinate dehydrogenase) in the respiratory electron transport chain. Copper compounds (group (11)) include compounds such as copper oxychloride, copper sulfate and copper hydroxide, including compositions such as Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate). Phthalimides (group (12)) include compounds such as folpet and captan. Benzimidazole fungicides (group (14)) include benomyl and carbendazim. Dichlorophenyl dicarboximide fungicides (group (20)) include chlozolinate, dichlozoline, iprodione, isovaledione, myclozolin, procymidone and vinclozolin.

Non-DMI sterol biosynthesis inhibitors (group (26)) include morpholine and piperidine fungicides. The morpholines and piperidines are sterol biosynthesis inhibitors that have been shown to inhibit steps in the sterol biosynthesis pathway at a point later than the inhibitions achieved by the DMI sterol biosynthesis (group (27)). The morpholines include aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph and trimorphamide. The piperidines include fenpropidin.

Examples of component (b) fungicides include acibenzolar-*S*-methyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benalaxyl-M, benodanil, benomyl, benthiavalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, bethoxazin, binapacryl,

biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, boscalid, bromuconazole, bupirimate, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chloroneb, chlorothalonil, chlozolinate, clotrimazole, copper salts such as Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate), copper hydroxide and copper oxychloride, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, diflumetorim, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, diniconazole-M, dinocap, dithianon, dodemorph, dodine, edifenphos, enestroburin, epoxiconazole, ethaboxam, ethirimol, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamine, fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluopicolide (also known as picobenzamid), fluopyram, fluoroimide, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutianil (2-[[2-fluoro-5-(trifluoromethyl)phenyl]thio]-2-[3-(2-methoxyphenyl)-2-thiazolidinylidene]acetonitrile), flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fosetyl-aluminum, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, hexaconazole, hymexazol, guazatine, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iodocarb, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-methyl, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl, metalaxyl-M, metconazole, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, mepanipyrim, metrafenone, myclobutanil, naftifine, neo-asozin (ferric methancarsonate), nuarimol, octhilinone, ofurace, orysastrobin, oxadixyl, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, oxytetracycline, penconazole, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, pefurazoate, phosphorous acid and salts, phthalide, picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propamocarb-hydrochloride, propiconazole, propineb, proquinazid, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributicarb, pyrifenox, pyrimethanil, pyriofenone, pyroquilon, pyrrolnitrin, quinomethionate, quinoxyfen, quintozene, sedaxane, silthiofam, simeconazole, spiroxamine, streptomycin, sulfur, tebuconazole, tebufloquin, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, thiophanate, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, tolclofos-methyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazoxide, tricyclazole, tridemorph, triflumizole, tricyclazole, trifloxystrobin, triforine, trimorphamide, triticonazole, uniconazole, validamycin, valifenalate (valiphenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamide, *N*'-[4-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylmethanimidamide, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pyrimidine (BAS600), penflufen (*N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide), *N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]butanamide, *N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(ethylsulfonyl)amino]butanamide, 2-butoxy-6-iodo-3-

propyl-4*H*-1-benzopyran-4-one, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethyl-3-isoxazolidinyl]-pyridine, 4-fluorophenyl *N*-[1-[[[1-(4-cyanophenyl)ethyl]sulfonyl]methyl]propyl]carbamate, *N*-[[(cyclopropylmethoxy)amino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluoro-phenyl]methylene]benzeneacetamide, α-(methoxyimino)-*N*-methyl-2-[[[1-[3-(trifluoro-methyl)phenyl]ethoxy]imino]methyl]benzeneacetamide, *N'*-[4-[4-chloro-3-(trifluoro-methyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylmethanimidamide, *N*-(4-chloro-2-nitrophenyl)-*N*-ethyl-4-methylbenzenesulfonamide, 2-[[[[3-(2,6-dichlorophenyl)-1-methyl-2-propen-1-ylidene]amino]oxy]methyl]-α-(methoxyimino)-*N*-methylbenzeneacetamide, 1-[(2-propenylthio)carbonyl]-2-(1-methylethyl)-4-(2-methylphenyl)-5-amino-1*H*-pyrazol-3-one, ethyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine, pentyl *N*-[4-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmethylene]amino]oxy]methyl]-2-thiazolyl]carbamate and pentyl *N*-[6-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmethylene]amino]oxy]methyl]-2-pyridinyl]carbamate

Of note are combinations of compounds of Formula **1** (or an *N*-oxide or salt thereof) (i.e. Component (a) in compositions) with azoxystrobin, kresoxim-methyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, carbendazim, chlorothalonil, quinoxyfen, metrafenone, cyflufenamid, fenpropidine, fenpropimorph, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, flusilazole, fluxapyroxad, hexaconazole, ipconazole, metconazole, penconazole, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, pyriofenone, tebuconazole, triticonazole, famoxadone, prochloraz, penthiopyrad and boscalid (nicobifen) (i.e. as Component (b) in compositions).

Preferred for better control of plant diseases caused by fungal plant pathogens (e.g., lower use rate or broader spectrum of plant pathogens controlled) or resistance management are mixtures of a compound of this invention with a fungicide selected from the group: azoxystrobin, kresoxim-methyl, trifloxystrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin/fenominostrobin, quinoxyfen, metrafenone, cyflufenamid, fenpropidine, fenpropimorph, cyproconazole, epoxiconazole, flusilazole, metconazole, propiconazole, proquinazid, prothioconazole, pyriofenone, tebuconazole, triticonazole, famoxadone and penthiopyrad.

Tables A1 through A54 list specific combinations of a Component (b) compound with Component (a) (compound numbers refer to compounds in Index Table A) illustrative of the mixtures, compositions and methods of the present invention. In Table A1, each line below the column headings "Component (a)" and "Component (b)" specifically discloses a combination (i.e. mixture) of Component (a), which is Compound 22, with a Component (b) fungicide. The entries under the heading "Illustrative Ratios" disclose three specific weight ratios of Component (b) to Component (a) for the disclosed mixture. For example, the first line of Table A1 discloses a mixture of Compound 22 with acibenzolar-*S*-methyl and lists weight ratios of acibenzolar-*S*-methyl to Compound 22 of 1:1 , 1:4 or 1:17.

Table A1

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	acibenzolar-*S*-methyl	1:1	1:4	1:18
Compound 22	aldimorph	7:1	3:1	1:1
Compound 22	ametoctradin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	amisulbrom	1:1	1:2	1:6
Compound 22	anilazine	22:1	8:1	4:1
Compound 22	azaconazole	2:1	1:2	1:4
Compound 22	azoxystrobin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	benalaxyl	1:1	1:2	1:6
Compound 22	benalaxyl-M	1:1	1:3	1:8
Compound 22	benodanil	4:1	2:1	1:2
Compound 22	benomyl	11:1	4:1	1:1
Compound 22	benthiavalicarb	1:1	1:4	1:12
Compound 22	benthiavalicarb-isopropyl	1:1	1:4	1:12
Compound 22	bethoxazin	15:1	5:1	2:1
Compound 22	binapacryl	15:1	5:1	2:1
Compound 22	biphenyl	15:1	5:1	2:1
Compound 22	bitertanol	3:1	1:1	1:2
Compound 22	bixafen	2:1	1:1	1:3
Compound 22	blasticidin-S	1:4	1:12	1:30
Compound 22	Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate)	45:1	15:1	5:1
Compound 22	boscalid	4:1	2:1	1:2
Compound 22	bromuconazole	3:1	1:1	1:3
Compound 22	bupirimate	1:3	1:10	1:30
Compound 22	captafol	15:1	5:1	2:1
Compound 22	captan	15:1	5:1	2:1
Compound 22	carbendazim	11:1	4:1	2:1
Compound 22	carboxin	4:1	2:1	1:2
Compound 22	carpropamid	3:1	1:1	1:3
Compound 22	chloroneb	100:1	35:1	14:1
Compound 22	chlorothalonil	15:1	5:1	2:1
Compound 22	chlozolinate	11:1	4:1	2:1
Compound 22	clotrimazole	3:1	1:1	1:3
Compound 22	copper hydroxide	45:1	15:1	5:1
Compound 22	copper oxychloride	45:1	15:1	5:1
Compound 22	cyazofamid	1:1	1:2	1:6
Compound 22	cyflufenamid	1:2	1:6	1:24

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	cymoxanil	1:1	1:2	1:5
Compound 22	cyproconazole	1:1	1:2	1:6
Compound 22	cyprodinil	4:1	2:1	1:2
Compound 22	dichlofluanid	15:1	5:1	2:1
Compound 22	diclocymet	15:1	5:1	2:1
Compound 22	diclomezine	3:1	1:1	1:3
Compound 22	dicloran	15:1	5:1	2:1
Compound 22	diethofencarb	7:1	2:1	1:2
Compound 22	difenoconazole	1:1	1:3	1:12
Compound 22	diflumetorim	15:1	5:1	2:1
Compound 22	dimethirimol	1:3	1:8	1:30
Compound 22	dimethomorph	3:1	1:1	1:2
Compound 22	dimoxystrobin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	diniconazole	1:1	1:3	1:8
Compound 22	diniconazole-M	1:1	1:3	1:12
Compound 22	dinocap	2:1	1:1	1:3
Compound 22	dithianon	5:1	2:1	1:2
Compound 22	dodemorph	7:1	3:1	1:1
Compound 22	dodine	10:1	4:1	2:1
Compound 22	edifenphos	3:1	1:1	1:3
Compound 22	enestroburin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	epoxiconazole	1:1	1:3	1:7
Compound 22	ethaboxam	2:1	1:1	1:3
Compound 22	ethirimol	7:1	3:1	1:1
Compound 22	etridiazole	7:1	2:1	1:2
Compound 22	famoxadone	2:1	1:1	1:4
Compound 22	fenamidone	2:1	1:1	1:4
Compound 22	fenarimol	1:2	1:7	1:24
Compound 22	fenbuconazole	1:1	1:3	1:10
Compound 22	fenfuram	4:1	1:1	1:2
Compound 22	fenhexamid	10:1	4:1	2:1
Compound 22	fenoxanil	15:1	4:1	1:1
Compound 22	fenpiclonil	15:1	5:1	2:1
Compound 22	fenpropidin	7:1	2:1	1:1
Compound 22	fenpropimorph	7:1	2:1	1:1
Compound 22	fenpyrazamine	3:1	1:1	1:3
Compound 22	fentin salt such as fentin acetate, fentin chloride or fentin	3:1	1:1	1:3

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
	hydroxide			
Compound 22	ferbam	30:1	10:1	4:1
Compound 22	ferimzone	7:1	2:1	1:2
Compound 22	fluazinam	3:1	1:1	1:2
Compound 22	fludioxonil	2:1	1:1	1:4
Compound 22	flumetover	3:1	1:1	1:2
Compound 22	flumorph	3:1	1:1	1:3
Compound 22	fluopicolide	1:1	1:2	1:6
Compound 22	fluopyram	3:1	1:1	1:3
Compound 22	fluoroimide	37:1	14:1	5:1
Compound 22	fluoxastrobin	1:1	1:2	1:6
Compound 22	fluquinconazole	1:1	1:2	1:4
Compound 22	flusilazole	3:1	1:1	1:3
Compound 22	flusulfamide	15:1	5:1	2:1
Compound 22	flutianil	1:1	1:2	1:6
Compound 22	flutolanil	4:1	1:1	1:2
Compound 22	flutriafol	1:1	1:2	1:4
Compound 22	fluxapyroxad	2:1	1:1	1:3
Compound 22	folpet	15:1	5:1	2:1
Compound 22	fosetyl-aluminum	30:1	12:1	5:1
Compound 22	fuberidazole	11:1	4:1	2:1
Compound 22	furalaxyl	1:1	1:2	1:6
Compound 22	furametpyr	15:1	5:1	2:1
Compound 22	guazatine	15:1	5:1	2:1
Compound 22	hexaconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	hymexazol	75:1	25:1	9:1
Compound 22	imazalil	1:1	1:2	1:5
Compound 22	imibenconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	iminoctadine	15:1	4:1	1:1
Compound 22	iodocarb	15:1	5:1	2:1
Compound 22	ipconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	iprobenfos	15:1	5:1	2:1
Compound 22	iprodione	15:1	5:1	2:1
Compound 22	iprovalicarb	2:1	1:1	1:3
Compound 22	isoprothiolane	45:1	15:1	5:1
Compound 22	isopyrazam	2:1	1:1	1:3
Compound 22	isotianil	2:1	1:1	1:3

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	kasugamycin	1:2	1:7	1:24
Compound 22	kresoxim-methyl	2:1	1:1	1:4
Compound 22	mancozeb	22:1	7:1	3:1
Compound 22	mandipropamid	2:1	1:1	1:4
Compound 22	maneb	22:1	7:1	3:1
Compound 22	mepanipyrim	6:1	2:1	1:1
Compound 22	mepronil	1:1	1:2	1:6
Compound 22	meptyldinocap	2:1	1:1	1:3
Compound 22	metalaxyl	1:1	1:2	1:6
Compound 22	metalaxyl-M	1:1	1:4	1:12
Compound 22	metconazole	1:1	1:2	1:6
Compound 22	methasulfocarb	15:1	5:1	2:1
Compound 22	metiram	15:1	5:1	2:1
Compound 22	metominostrobin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	metrafenone	2:1	1:1	1:4
Compound 22	myclobutanil	1:1	1:3	1:8
Compound 22	naftifine	15:1	5:1	2:1
Compound 22	neo-asozin (ferric methanearsonate)	15:1	5:1	2:1
Compound 22	nuarimol	3:1	1:1	1:3
Compound 22	octhilinone	15:1	4:1	1:1
Compound 22	ofurace	1:1	1:2	1:6
Compound 22	orysastrobin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	oxadixyl	1:1	1:2	1:6
Compound 22	oxolinic acid	7:1	2:1	1:2
Compound 22	oxpoconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	oxycarboxin	4:1	1:1	1:2
Compound 22	oxytetracycline	3:1	1:1	1:3
Compound 22	pefurazoate	15:1	5:1	2:1
Compound 22	penconazole	1:2	1:6	1:15
Compound 22	pencycuron	11:1	4:1	2:1
Compound 22	penthiopyrad	2:1	1:1	1:3
Compound 22	phosphorous acid or a salt thereof	15:1	6:1	2:1
Compound 22	phthalide	15:1	6:1	2:1
Compound 22	picoxystrobin	1:1	1:2	1:5
Compound 22	piperalin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	polyoxin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	probenazole	3:1	1:1	1:3

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	prochloraz	7:1	2:1	1:2
Compound 22	procymidone	11:1	4:1	2:1
Compound 22	propamocarb or propamocarb-hydrochloride	10:1	4:1	2:1
Compound 22	propiconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	propineb	11:1	4:1	2:1
Compound 22	proquinazid	1:1	1:3	1:12
Compound 22	prothiocarb	3:1	1:1	1:3
Compound 22	prothioconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	pyraclostrobin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	pyrametostrobin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	pyraoxystrobin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	pyrazophos	15:1	4:1	1:1
Compound 22	pyribencarb	4:1	1:1	1:2
Compound 22	pyributicarb	15:1	4:1	1:1
Compound 22	pyrifenox	3:1	1:1	1:3
Compound 22	pyrimethanil	3:1	1:1	1:2
Compound 22	pyriofenone	2:1	1:1	1:4
Compound 22	pyroquilon	3:1	1:1	1:3
Compound 22	pyrrolnitrin	15:1	5:1	2:1
Compound 22	quinomethionate	15:1	5:1	2:1
Compound 22	quinoxyfen	1:1	1:2	1:6
Compound 22	quintozene	15:1	5:1	2:1
Compound 22	silthiofam	2:1	1:1	1:4
Compound 22	simeconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	spiroxamine	5:1	2:1	1:2
Compound 22	streptomycin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	sulfur	75:1	25:1	9:1
Compound 22	tebuconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	tebufloquin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	tecloftalam	15:1	5:1	2:1
Compound 22	tecnazene	15:1	5:1	2:1
Compound 22	terbinafine	15:1	5:1	2:1
Compound 22	tetraconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	thiabendazole	11:1	4:1	2:1
Compound 22	thifluzamide	3:1	1:1	1:3
Compound 22	thiophanate	11:1	4:1	2:1
Compound 22	thiophanate-methyl	11:1	4:1	2:1

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	thiram	37:1	14:1	5:1
Compound 22	tiadinil	2:1	1:1	1:3
Compound 22	tolclofos-methyl	37:1	14:1	5:1
Compound 22	tolylfluanid	15:1	5:1	2:1
Compound 22	triadimefon	1:1	1:2	1:5
Compound 22	triadimenol	1:1	1:2	1:5
Compound 22	triazoxide	15:1	5:1	2:1
Compound 22	tricyclazole	3:1	1:1	1:3
Compound 22	tridemorph	7:1	2:1	1:1
Compound 22	trifloxystrobin	2:1	1:1	1:4
Compound 22	triflumizole	3:1	1:1	1:3
Compound 22	triforine	3:1	1:1	1:3
Compound 22	trimorphamide	7:1	2:1	1:2
Compound 22	triticonazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	uniconazole	1:1	1:2	1:5
Compound 22	validamycin	3:1	1:1	1:3
Compound 22	valifenalate (valiphenal)	2:1	1:1	1:4
Compound 22	vinclozolin	15:1	6:1	2:1
Compound 22	zineb	37:1	14:1	5:1
Compound 22	ziram	37:1	14:1	5:1
Compound 22	zoxamide	2:1	1:1	1:4
Compound 22	5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine	1:1	1:2	1:6
Compound 22	Penflufen (*N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide)	2:1	1:1	1:3
Compound 22	*N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]butanamide	2:1	1:1	1:4
Compound 22	*N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(ethylsulfonyl)amino]butanamide	2:1	1:1	1:4
Compound 22	2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-one	1:1	1:3	1:12
Compound 22	3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethyl-3-isoxazolidinyl]pyridine	3:1	1:1	1:3
Compound 22	4-fluorophenyl *N*-[1-[[[1-(4-cyanophenyl)ethyl]sulfonyl]methyl]propyl]carbamate	2:1	1:1	1:4
Compound 22	*N*-[[(cyclopropylmethoxy)amino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methylene]benzeneacetamide	1:2	1:7	1:24

Component (a)	Component (b)	Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	α-[methoxyimino]-*N*-methyl-2-[[[1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethoxy]imino]methyl]-benzeneacetamide	3:1	1:1	1:3
Compound 22	*N*'-[4-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylmethanimidamide	3:1	1:1	1:3
Compound 22	*N*-(4-chloro-2-nitrophenyl)-*N*-ethyl-4-methylbenzenesulfonamide	3:1	1:1	1:3
Compound 22	2-[[[3-(2,6-dichlorophenyl)-1-methyl-2-propen-1-ylidene]amino]oxy]methyl]-α-(methoxyimino)-*N*-methylbenzeneacetamide	3:1	1:1	1:3
Compound 22	pentyl *N*-[4-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenyl-methylene]amino]oxy]methyl]-2-thiazolyl]carbamate	3:1	1:1	1:3
Compound 22	pentyl *N*-[6-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenyl-methylene]amino]oxy]methyl]-2-pyridinyl]carbamate	3:1	1:1	1:3

(*) Ratios of Component (b) relative to Component (a) by weight.

Tables A2 through A54 are each constructed the same as Table A1 above except that entries below the "Component (a)" column heading are replaced with the respective Component (a) Column Entry shown below. Thus, for example, in Table A2 the entries below the "Component (a)" column heading all recite "Compound 18", and the first line below the column headings in Table A2 specifically discloses a mixture of Compound 18 with acibenzolar-*S*-methyl. Tables A3 through A54 are constructed similarly.

Table Number	Component (a) Column Entries	Table Number	Component (a) Column Entries
A2	Compound 18	A29	Compound 351
A3	Compound 23	A30	Compound 352
A4	Compound 24	A31	Compound 357
A5	Compound 36	A32	Compound 358
A6	Compound 41	A33	Compound 360
A7	Compound 45	A34	Compound 361
A8	Compound 87	A35	Compound 364
A9	Compound 91	A36	Compound 365
A10	Compound 118	A37	Compound 367
A11	Compound 139	A38	Compound 368
A12	Compound 148	A39	Compound 369
A13	Compound 172	A40	Compound 372
A14	Compound 175	A41	Compound 373
A15	Compound 193	A42	Compound 374

Table Number	Component (a) Column Entries	Table Number	Component (a) Column Entries
A16	Compound 232	A43	Compound 375
A17	Compound 265	A44	Compound 376
A18	Compound 266	A45	Compound 377
A19	Compound 284	A46	Compound 378
A20	Compound 286	A47	Compound 379
A21	Compound 287	A48	Compound 380
A22	Compound 292	A49	Compound 381
A23	Compound 297	A50	Compound 382
A24	Compound 332	A51	Compound 383
A25	Compound 336	A52	Compound 384
A26	Compound 343	A53	Compound 385
A27	Compound 346	A54	Compound 386
A28	Compound 349		

Table B1 lists specific combinations of a Component (b) compound with Component (a) illustrative of the mixtures, compositions and methods of the present invention. The first column of Table B1 lists the specific Component (b) compound (e.g., "acibenzolar-*S*-methyl" in the first line). The second, third and fourth columns of Table B1 lists ranges of weight ratios for rates at which the Component (b) compound is typically applied to a field-grown crop relative to Component (a) (e.g., "2:1 to 1:180" of acibenzolar-*S*-methyl relative to Component (a) by weight). Thus, for example, the first line of Table B1 specifically discloses the combination of acibenzolar-*S*-methyl with Component (a) is typically applied in a weight ratio between 2:1 to 1:180. The remaining lines of Table B1 are to be construed similarly. Table B1 thus supplements the specific ratios disclosed in Tables A1 through A54 with ranges of ratios for these combinations.

Table B1

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
acibenzolar-*S*-methyl	2:1 to 1:180	1:1 to 1:60	1:1 to 1:18
aldimorph	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
ametoctradin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
amisulbrom	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:6
anilazine	90:1 to 2:1	30:1 to 4:1	22:1 to 4:1
azaconazole	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
azoxystrobin	9:1 to 1:12	3:1 to 1:4	3:1 to 1:3
benalaxyl	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
benalaxyl-M	4:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:8

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
benodanil	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
benomyl	45:1 to 1:4	15:1 to 1:1	11:1 to 1:1
benthiavalicarb or benthiavalicarb-isopropyl	2:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:12
bethoxazin	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
binapacryl	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
biphenyl	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
bitertanol	15:1 to 1:5	5:1 to 1:2	3:1 to 1:2
bixafen	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
blasticidin-S	3:1 to 1:90	1:1 to 1:30	1:4 to 1:30
boscalid	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
bromuconazole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
bupirimate	3:1 to 1:90	1:1 to 1:30	1:3 to 1:30
captafol	90:1 to 1:4	30:1 to 1:2	15:1 to 2:1
captan	90:1 to 1:4	30:1 to 1:2	15:1 to 2:1
carbendazim	45:1 to 1:4	15:1 to 1:2	11:1 to 2:1
carboxin	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
carpropamid	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
chloroneb	300:1 to 2:1	100:1 to 4:1	100:1 to 14:1
chlorothalonil	90:1 to 1:4	30:1 to 1:2	15:1 to 2:1
chlozolinate	45:1 to 1:2	15:1 to 2:1	11:1 to 2:1
clotrimazole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
copper salts such as Bordeaux mixture (tribasic copper sulfate), copper oxychloride, copper sulfate and copper hydroxide	450:1 to 1:1	150:1 to 4:1	45:1 to 5:1
cyazofamid	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
cyflufenamid	1:1 to 1:90	1:2 to 1:30	1:2 to 1:24
cymoxanil	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:5
cyproconazole	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
cyprodinil	22:1 to 1:9	7:1 to 1:3	4:1 to 1:2
dichlofluanid	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
diclocymet	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
diclomezine	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
dicloran	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
diethofencarb	22:1 to 1:9	7:1 to 1:3	7:1 to 1:2
difenoconazole	4:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:12
diflumetorim	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
dimethirimol	3:1 to 1:90	1:1 to 1:30	1:3 to 1:30
dimethomorph	9:1 to 1:6	3:1 to 1:2	3:1 to 1:2
dimoxystrobin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
diniconazole	3:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:8
diniconazole M	3:1 to 1:90	1:1 to 1:30	1:1 to 1:12
dinocap	7:1 to 1:9	2:1 to 1:3	2:1 to 1:3
dithianon	15:1 to 1:4	5:1 to 1:2	5:1 to 1:2
dodemorph	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
dodine	30:1 to 1:2	10:1 to 2:1	10:1 to 2:1
edifenphos	30:1 to 1:9	10:1 to 1:3	3:1 to 1:3
enestroburin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
epoxiconazole	3:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:7
ethaboxam	7:1 to 1:9	2:1 to 1:3	2:1 to 1:3
ethirimol	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
etridiazole	30:1 to 1:9	10:1 to 1:3	7:1 to 1:2
famoxadone	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
fenamidone	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
fenarimol	3:1 to 1:90	1:1 to 1:30	1:2 to 1:24
fenbuconazole	3:1 to 1:30	1:1 to 1:10	1:1 to 1:10
fenfuram	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
fenhexamid	30:1 to 1:2	10:1 to 2:1	10:1 to 2:1
fenoxanil	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 1:1
fenpiclonil	75:1 to 1:9	25:1 to 1:3	15:1 to 2:1
fenpropidin	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
fenpropimorph	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
fenpyrazamine	100:1 to 1:100	10:1 to 1:10	3:1 to 1:3
fentin salt such as the acetate, chloride or hydroxide	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
ferbam	300:1 to 1:2	100:1 to 2:1	30:1 to 4:1
ferimzone	30:1 to 1:5	10:1 to 1:2	7:1 to 1:2
fluazinam	22:1 to 1:5	7:1 to 1:2	3:1 to 1:2
fludioxonil	7:1 to 1:12	2:1 to 1:4	2:1 to 1:4

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
flumetover	9:1 to 1:6	3:1 to 1:2	3:1 to 1:2
flumorph	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
fluopicolide	3:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
fluopyram	15:1 to 1:90	5:1 to 1:30	3:1 to 1:3
fluoromide	150:1 to 2:1	50:1 to 4:1	37:1 to 5:1
fluoxastrobin	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
fluquinconazole	4:1 to 1:12	1:1 to 1:4	1:1 to 1:4
flusilazole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
flusulfamide	90:1 to 1:2	30:1 to 2:1	15:1 to 2:1
flutianil	7:1 to 1:36	2:1 to 1:12	1:1 to 1:6
flutolanil	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
flutriafol	4:1 to 1:12	1:1 to 1:4	1:1 to 1:4
fluxapyroxad	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
folpet	90:1 to 1:4	30:1 to 1:2	15:1 to 2:1
fosetyl-aluminum	225:1 to 2:1	75:1 to 5:1	30:1 to 5:1
fuberidazole	45:1 to 1:4	15:1 to 1:2	11:1 to 2:1
furalaxyl	15:1 to 1:45	5:1 to 1:15	1:1 to 1:6
furametpyr	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
guazatine or iminoctadine	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
hexaconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
hymexazol	225:1 to 2:1	75:1 to 4:1	75:1 to 9:1
imazalil	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:5
imibenconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
iodocarb	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
ipconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
iprobenfos	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
iprodione	120:1 to 1:2	40:1 to 2:1	15:1 to 2:1
iprovalicarb	9:1 to 1:9	3:1 to 1:3	2:1 to 1:3
isoprothiolane	150:1 to 2:1	50:1 to 4:1	45:1 to 5:1
isopyrazam	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
isotianil	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
kasugamycin	7:1 to 1:90	2:1 to 1:30	1:2 to 1:24
kresoxim-methyl	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
mancozeb	180:1 to 1:3	60:1 to 2:1	22:1 to 3:1
mandipropamid	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
maneb	180:1 to 1:3	60:1 to 2:1	22:1 to 3:1
mepanipyrim	18:1 to 1:3	6:1 to 1:1	6:1 to 1:1
mepronil	7:1 to 1:36	2:1 to 1:12	1:1 to 1:6
meptyldinocap	7:1 to 1:9	2:1 to 1:3	2:1 to 1:3
metalaxyl	15:1 to 1:45	5:1 to 1:15	1:1 to 1:6
metalaxyl-M	7:1 to 1:90	2:1 to 1:30	1:1 to 1:12
metconazole	3:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
methasulfocarb	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 1:1
metiram	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 1:1
metominostrobin	9:1 to 1:12	3:1 to 1:4	3:1 to 1:3
metrafenone	6:1 to 1:12	2:1 to 1:4	2:1 to 1:4
myclobutanil	5:1 to 1:26	1:1 to 1:9	1:1 to 1:8
naftifine	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
neo-asozin (ferric methanearsonate)	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
nuarimol	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
octhilinone	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 1:1
ofurace	15:1 to 1:45	5:1 to 1:15	1:1 to 1:6
orysastrobin	9:1 to 1:12	3:1 to 1:4	3:1 to 1:3
oxadixyl	15:1 to 1:45	5:1 to 1:15	1:1 to 1:6
oxolinic acid	30:1 to 1:9	10:1 to 1:3	7:1 to 1:2
oxpoconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
oxycarboxin	18:1 to 1:6	6:1 to 1:2	4:1 to 1:2
oxytetracycline	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
pefurazoate	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
penconazole	1:1 to 1:45	1:2 to 1:15	1:2 to 1:15
pencycuron	150:1 to 1:2	50:1 to 2:1	11:1 to 2:1
penthiopyrad	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
phosphorous acid and salts thereof	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
phthalide	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
picoxystrobin	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:5
piperalin	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
polyoxin	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
probenazole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
prochloraz	22:1 to 1:4	7:1 to 1:1	7:1 to 1:2
procymidone	45:1 to 1:3	15:1 to 1:1	11:1 to 2:1

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
propamocarb or propamocarb-hydrochloride	30:1 to 1:2	10:1 to 2:1	10:1 to 2:1
propiconazole	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:5
propineb	45:1 to 1:2	15:1 to 2:1	11:1 to 2:1
proquinazid	3:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:12
prothiocarb	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
prothioconazole	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:5
pyraclostrobin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
pyrametostrobin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
pyraoxystrobin	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	2:1 to 1:4
pyrazophos	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 1:1
pyribencarb	15:1 to 1:6	5:1 to 1:2	4:1 to 1:2
pyrifenox	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
pyrimethanil	30:1 to 1:6	10:1 to 1:2	3:1 to 1:2
pyriofenone	6:1 to 1:12	2:1 to 1:4	2:1 to 1:4
pyroquilon	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
pyrrolnitrin	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
quinmethionate	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
quinoxyfen	4:1 to 1:18	1:1 to 1:6	1:1 to 1:6
quintozene	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
silthiofam	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
simeconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
spiroxamine	22:1 to 1:4	7:1 to 1:2	5:1 to 1:2
streptomycin	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
sulfur	300:1 to 3:1	100:1 to 9:1	75:1 to 9:1
tebuconazole	7:1 to 1:18	2:1 to 1:6	1:1 to 1:5
tebufloquin	100:1 to 1:100	10:1 to 1:10	3:1 to 1:3
tecloftalam	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
tecnazene	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
terbinafine	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
tetraconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
thiabendazole	45:1 to 1:4	15:1 to 1:2	11:1 to 2:1
thifluzamide	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
thiophanate	45:1 to 1:3	15:1 to 2:1	11:1 to 2:1
thiophanate-methyl	45:1 to 1:3	15:1 to 2:1	11:1 to 2:1

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
thiram	150:1 to 1:2	50:1 to 2:1	37:1 to 5:1
tiadinil	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
tolclofos-methyl	150:1 to 1:2	50:1 to 2:1	37:1 to 5:1
tolylfluanid	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
triadimefon	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
triadimenol	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
triazoxide	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	15:1 to 2:1
tricyclazole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
tridemorph	30:1 to 1:3	10:1 to 1:1	7:1 to 1:1
trifloxystrobin	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
triflumizole	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
triforine	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3
trimorphamide	45:1 to 1:9	15:1 to 1:3	7:1 to 1:2
triticonazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
uniconazole	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:5
validamycin	150:1 to 1:36	50:1 to 1:12	3:1 to 1:3
valifenalate (valiphenal)	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
vinclozolin	120:1 to 1:2	40:1 to 2:1	15:1 to 2:1
zineb	150:1 to 1:2	50:1 to 2:1	37:1 to 5:1
ziram	150:1 to 1:2	50:1 to 2:1	37:1 to 5:1
zoxamide	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-7-(4-methylpiperidin-1-yl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine	15:1 to 1:36	5:1 to 1:12	1:1 to 1:6
penflufen (*N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide)	12:1 to 1:9	4:1 to 1:3	2:1 to 1:3
N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]butanamide	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propyn-1-yl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(ethylsulfonyl)amino]butanamide	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4*H*-1-benzopyran-4-one	3:1 to 1:36	1:1 to 1:12	1:1 to 1:12
3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethyl-3-	15:1 to 1:9	5:1 to 1:3	3:1 to 1:3

Component (b)	Typical Weight Ratio	More Typical Weight Ratio	Most Typical Weight Ratio
isoxazolidinyl]pyridine			
4-fluorophenyl *N*-[1-[[[1-(4-cyanophenyl)ethyl]sulfonyl]methyl]propyl] carbamate	6:1 to 1:18	2:1 to 1:6	2:1 to 1:4
N-[[(cyclopropylmethoxy)amino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methylene]benzene-acetamide	1:1 to 1:90	1:2 to 1:30	1:2 to 1:24
α-[methoxyimino]-*N*-methyl-2-[[[1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethoxy]imino]-methyl]benzeneacetamide	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
N-[4-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-2,5-dimethylphenyl]-*N*-ethyl-*N*-methylmethanimidamide	15:1 to 1:18	5:1 to 1:6	3:1 to 1:3
N-(4-chloro-2-nitrophenyl)-*N*-ethyl-4-methylbenzenesulfonamide	15:1 to 1:18	5:1 to 1:6	3:1 to 1:3
2-[[[3-(2,6-dichlorophenyl)-1-methyl-2-propen-1-ylidene]amino]oxy]methyl]-α-(methoxyimino)-*N*-methylbenzeneacetamide	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
pentyl *N*-[4-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmethylene]amino]oxy]methyl]-2-thiazolyl]carbamate	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3
pentyl *N*-[6-[[[[(1-methyl-1*H*-tetrazol-5-yl)phenylmethylene]amino]oxy]methyl]-2-pyridinyl]carbamate	9:1 to 1:18	3:1 to 1:6	3:1 to 1:3

As already noted, the present invention includes embodiments wherein in the composition comprising components (a) and (b), component (b) comprises at least one fungicide from each of two groups selected from (b1) through (b46). Tables C1 through C54 list specific mixtures (compound numbers refer to compounds in Index Table A) to illustrate embodiments wherein component (b) includes at least one fungicide from each of two groups selected from (b1) through (b46). In Table C1, each line below the column headings "Component (a)" and "Component (b)" specifically discloses a mixture of Component (a), which is Compound 22, with at least two Component (b) fungicides. The entries under the heading "Illustrative Ratios" disclose three specific weight ratios of Component (a) to each Component (b) fungicide in sequence for the disclosed mixture. For example, the first line

discloses a mixture of Compound 22 with cyproconazole and azoxystrobin and lists weight ratios of Compound 22 to cyproconazole to azoxystrobin of 1:1:1 , 2:1:1 or 3:1:1.

Table C1

Component (a)	Component (b)			Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	cyproconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	cyproconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	cyproconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	cyproconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	cyproconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	difenconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	difenconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	difenconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	difenconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

Component (a)	Component (b)			Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	difenconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	epoxiconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	epoxiconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	epoxiconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	epoxiconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	epoxiconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	metconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	metconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	metconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	metconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	metconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	myclobutanil	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1

Component (a)	Component (b)			Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	myclobutanil	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	myclobutanil	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	myclobutanil	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	myclobutanil	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	myclobutanil	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	prothioconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	prothioconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	prothioconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	prothioconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	prothioconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	tebuconazole	azoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	kresoxim-methyl		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	picoxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1

Component (a)	Component (b)			Illustrative Ratios(*)		
Compound 22	tebuconazole	pyraclostrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	trifloxystrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	bixafen		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	cyflufenamid		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compound 22	tebuconazole	fluopyram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	isopyrazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	metrafenone		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	penthiopyrad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	quinoxyfen		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compound 22	tebuconazole	sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compound 22	tebuconazole	picoxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compound 22	tebuconazole	trifloxystrobin	proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

(*) Ratios of Component (a) relative to Component (b) in sequence, by weight.

Tables C2 through C54 are each constructed the same as Table C1 above except that entries below the "Component (a)" column heading are replaced with the respective Component (a) Column Entry shown below. Thus, for example, in Table C2 the entries below the "Component (a)" column heading all recite "Compound 18", and the first line in below the column headings in Table C2 specifically discloses a mixture of Compound 18 with cyproconazole and azoxystrobin, and the illustrative weight ratios of 1:1:1, 2:1:1 and 3:1:1 of Compound 18:cyproconazole:azoxystrobin. Tables C3 through C54 are constructed similarly.

Table Number	Component (a) Column Entries	Table Number	Component (a) Column Entries
C2	Compound 18	C29	Compound 351
C3	Compound 23	C30	Compound 352
C4	Compound 24	C31	Compound 357
C5	Compound 36	C32	Compound 358
C6	Compound 41	C33	Compound 360
C7	Compound 45	C34	Compound 361
C8	Compound 87	C35	Compound 364
C9	Compound 91	C36	Compound 365
C10	Compound 118	C37	Compound 367
C11	Compound 139	C38	Compound 368
C12	Compound 148	C39	Compound 369

C13	Compound 172	C40	Compound 372
C14	Compound 175	C41	Compound 373
C15	Compound 193	C42	Compound 374
C16	Compound 232	C43	Compound 375
C17	Compound 265	C44	Compound 376
C18	Compound 266	C45	Compound 377
C19	Compound 284	C46	Compound 378
C20	Compound 286	C47	Compound 379
C21	Compound 287	C48	Compound 380
C22	Compound 292	C49	Compound 381
C23	Compound 297	C50	Compound 382
C24	Compound 332	C51	Compound 383
C25	Compound 336	C52	Compound 384
C26	Compound 343	C53	Compound 385
C27	Compound 346	C54	Compound 386
C28	Compound 349		

As mentioned in the Summary of the Invention, one aspect of the present invention is a composition comprising (i.e. a mixture or combination of) a compound of Formula **1**, an *N*-oxide, or a salt thereof, and at least one invertebrate pest control compound or agent (e.g., insecticide, acaricide). Of note is a composition comprising component (a) and at least one (i.e. one or more) invertebrate pest control compound or agent, which then can be subsequently combined with component (b) to provide a composition comprising components (a) and (b) and the one or more invertebrate pest control compounds or agents. Alternatively without first mixing with component (b), a biologically effective amount of the composition comprising component (a) with at least one invertebrate pest control agent can be applied to a plant or plant seed (directly or through the environment of the plant or plant seed) to protect the plant or plant seed from diseases caused by fungal pathogens and injury caused by invertebrate pests.

For embodiments where one or more of invertebrate pest control compounds are used, the weight ratio of these compounds (in total) to the component (a) compounds is typically between about 1:3000 and about 3000:1. Of note are weight ratios between about 1:300 and about 300:1 (for example ratios between about 1:30 and about 30:1). One skilled in the art can easily determine through simple experimentation the biologically effective amounts of active ingredients necessary for the desired spectrum of biological activity.

Of note is a composition of the present invention which comprises in addition to a component (a) compound, alone or in combination with fungicidal component (b), at least one invertebrate pest control compound or agent selected from the group consisting of

abamectin, acephate, acetamiprid, acetoprole, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-methyl, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, buprofezin, carbofuran, cartap, chinomethionat, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorantraniliprole, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorobenzilate, chromafenozide, clothianidin, cyantraniliprole, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyhexatin, cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dicofol, dieldrin, dienochlor, diflubenzuron, dimefluthrin, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etoxazole, fenamiphos, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenpyroximate, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamide, flucythrinate, tau-fluvalinate, flufenerim, flufenoxuron, fonophos, halofenozide, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnon, imicyafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, metofluthrin, monocrotophos, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-methyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, spinetoram, spinosad, spiridiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, sulprofos, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethylfluthin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-sodium, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopolyhedro viruses, encapsulated delta-endotoxins of *Bacillus thuringiensis*, baculoviruses, entomopathogenic bacteria, entomopathogenic viruses and entomopathogenic fungi.

In certain instances, combinations of a compound of Formula 1 or an *N*-oxide or salt thereof (i.e. component (a)), alone or in mixture with fungicidal component (b), with other biologically active (particularly invertebrate pest control) compounds or agents (i.e. active ingredients) can result in a greater-than-additive (i.e. synergistic) effect. Reducing the quantity of active ingredients released in the environment while ensuring effective pest control is always desirable. When synergism of invertebrate pest control active ingredients occurs at application rates giving agronomically satisfactory levels of invertebrate pest control, such combinations can be advantageous for reducing crop production cost and decreasing environmental load.

Table D1 lists specific combinations of invertebrate pest control agents with Compound 22 (identified in Index Table A) as a component (a) compound illustrative of mixtures and compositions comprising these active ingredients and methods using them according to the present invention. The second column of Table D1 lists the specific

invertebrate pest control agents (e.g., "Abamectin" in the first line). The third column of Table D1 lists the mode of action (if known) or chemical class of the invertebrate pest control agents. The fourth column of Table D1 lists embodiment(s) of ranges of weight ratios for rates at which the invertebrate pest control agent is typically applied relative to Compound 22 alone or in combination with fungicidal component (b) (e.g., "50:1 to 1:50" of abamectin relative to a Compound 22 by weight). Thus, for example, the first line of Table D1 specifically discloses the combination of Compound 22 with abamectin is typically applied in a weight ratio between 50:1 to 1:50. The remaining lines of Table D1 are to be construed similarly.

Table D1

Component (a)	Invertebrate Pest Control Agent	Mode of Action or Chemical Class	Typical Weight Ratio
Compound 22	Abamectin	macrocyclic lactones	50:1 to 1:50
Compound 22	Acetamiprid	neonicotinoids	150:1 to 1:200
Compound 22	Amitraz	octopamine receptor ligands	200:1 to 1:100
Compound 22	Avermectin	macrocyclic lactones	50:1 to 1:50
Compound 22	Azadirachtin	ecdysone agonists	100:1 to 1:120
Compound 22	Beta-cyfluthrin	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Bifenthrin	sodium channel modulators	100:1 to 1:10
Compound 22	Buprofezin	chitin synthesis inhibitors	500:1 to 1:50
Compound 22	Cartap	nereistoxin analogs	100:1 to 1:200
Compound 22	Chlorantraniliprole	ryanodine receptor ligands	100:1 to 1:120
Compound 22	Chlorfenapyr	mitochondrial electron transport inhibitors	300:1 to 1:200
Compound 22	Chlorpyrifos	cholinesterase inhibitors	500:1 to 1:200
Compound 22	Clothianidin	neonicotinoids	100:1 to 1:400
Compound 22	Cyantraniliprole	ryanodine receptor ligands	100:1 to 1:120
Compound 22	Cyfluthrin	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Cyhalothrin	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Cypermethrin	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Cyromazine	chitin synthesis inhibitors	400:1 to 1:50
Compound 22	Deltamethrin	sodium channel modulators	50:1 to 1:400
Compound 22	Dieldrin	cyclodiene insecticides	200:1 to 1:100
Compound 22	Dinotefuran	neonicotinoids	150:1 to 1:200
Compound 22	Diofenolan	molting inhibitor	150:1 to 1:200
Compound 22	Emamectin	macrocyclic lactones	50:1 to 1:10
Compound 22	Endosulfan	cyclodiene insecticides	200:1 to 1:100

Component (a)	Invertebrate Pest Control Agent	Mode of Action or Chemical Class	Typical Weight Ratio
Compound 22	Esfenvalerate	sodium channel modulators	100:1 to 1:400
Compound 22	Ethiprole	GABA-regulated chloride channel blockers	200:1 to 1:100
Compound 22	Fenothiocarb		150:1 to 1:200
Compound 22	Fenoxycarb	juvenile hormone mimics	500:1 to 1:100
Compound 22	Fenvalerate	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Fipronil	GABA-regulated chloride channel blockers	150:1 to 1:100
Compound 22	Flonicamid		200:1 to 1:100
Compound 22	Flubendiamide	ryanodine receptor ligands	100:1 to 1:120
Compound 22	Flufenoxuron	chitin synthesis inhibitors	200:1 to 1:100
Compound 22	Hexaflumuron	chitin synthesis inhibitors	300:1 to 1:50
Compound 22	Hydramethylnon	mitochondrial electron transport inhibitors	150:1 to 1:250
Compound 22	Imidacloprid	neonicotinoids	1000:1 to 1:1000
Compound 22	Indoxacarb	sodium channel modulators	200:1 to 1:50
Compound 22	Lambda-cyhalothrin	sodium channel modulators	50:1 to 1:250
Compound 22	Lufenuron	chitin synthesis inhibitors	500:1 to 1:250
Compound 22	Meperfluthrin	Sodium channel modulators	100:1 to 1:400
Compound 22	Metaflumizone		200:1 to 1:200
Compound 22	Methomyl	cholinesterase inhibitors	500:1 to 1:100
Compound 22	Methoprene	juvenile hormone mimics	500:1 to 1:100
Compound 22	Methoxyfenozide	ecdysone agonists	50:1 to 1:50
Compound 22	Nitenpyram	neonicotinoids	150:1 to 1:200
Compound 22	Nithiazine	neonicotinoids	150:1 to 1:200
Compound 22	Novaluron	chitin synthesis inhibitors	500:1 to 1:150
Compound 22	Oxamyl	cholinesterase inhibitors	200:1 to 1:200
Compound 22	Pymetrozine		200:1 to 1:100
Compound 22	Pyrethrin	sodium channel modulators	100:1 to 1:10
Compound 22	Pyridaben	mitochondrial electron transport inhibitors	200:1 to 1:100
Compound 22	Pyridalyl		200:1 to 1:100
Compound 22	Pyriproxyfen	juvenile hormone mimics	500:1 to 1:100
Compound 22	Ryanodine	ryanodine receptor ligands	100:1 to 1:120
Compound 22	Spinetoram	macrocyclic lactones	150:1 to 1:100

Component (a)	Invertebrate Pest Control Agent	Mode of Action or Chemical Class	Typical Weight Ratio
Compound 22	Spinosad	macrocyclic lactones	500:1 to 1:10
Compound 22	Spirodiclofen	lipid biosynthesis inhibitors	200:1 to 1:200
Compound 22	Spiromesifen	lipid biosynthesis inhibitors	200:1 to 1:200
Compound 22	Sulfoxaflor		200 : 1 to 1: 200
Compound 22	Tebufenozide	ecdysone agonists	500:1 to 1:250
Compound 22	Tetramethylfluthrin	Sodium channel modulators	100:1 to 1:400
Compound 22	Thiacloprid	neonicotinoids	100:1 to 1:200
Compound 22	Thiamethoxam	neonicotinoids	1250:1 to 1:1000
Compound 22	Thiodicarb	cholinesterase inhibitors	500:1 to 1:400
Compound 22	Thiosultap-sodium		150:1 to 1:100
Compound 22	Tralomethrin	sodium channel modulators	150:1 to 1:200
Compound 22	Triazamate	cholinesterase inhibitors	250:1 to 1:100
Compound 22	Triflumuron	chitin synthesis inhibitors	200:1 to 1:100
Compound 22	*Bacillus thuringiensis*	biological agents	50:1 to 1:10
Compound 22	*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin	biological agents	50:1 to 1:10
Compound 22	NPV (e.g., Gemstar)	biological agents	50:1 to 1:10

Tables D2 through D54 are each constructed the same as Table D1 above except that entries below the "Component (a)" column heading are replaced with the respective Component (a) Column Entry shown below. Thus, for example, in Table D2 the entries below the "Component (a)" column heading all recite "Compound 18", and the first line in below the column headings in Table D2 specifically discloses a mixture of Compound 18 with abamectin. Tables D3 through D54 are constructed similarly.

Table Number	Component (a) Column Entries	Table Number	Component (a) Column Entries
D2	Compound 18	D29	Compound 351
D3	Compound 23	D30	Compound 352
D4	Compound 24	D31	Compound 357
D5	Compound 36	D32	Compound 358
D6	Compound 41	D33	Compound 360
D7	Compound 45	D34	Compound 361
D8	Compound 87	D35	Compound 364
D9	Compound 91	D35	Compound 365
D10	Compound 118	D37	Compound 367
D11	Compound 139	D38	Compound 368
D12	Compound 148	D39	Compound 369

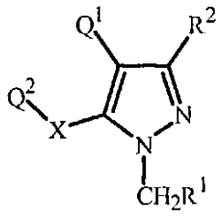
D13	Compound 172	D40	Compound 372
D14	Compound 175	D41	Compound 373
D15	Compound 193	D42	Compound 374
D16	Compound 232	D43	Compound 375
D17	Compound 265	D44	Compound 376
D18	Compound 266	D45	Compound 377
D19	Compound 284	D46	Compound 378
D20	Compound 286	D47	Compound 379
D21	Compound 287	D48	Compound 380
D22	Compound 292	D49	Compound 381
D23	Compound 297	D50	Compound 382
D24	Compound 332	D51	Compound 383
D25	Compound 336	D52	Compound 384
D26	Compound 343	D53	Compound 385
D27	Compound 346	D54	Compound 386
D28	Compound 349		

One embodiment of invertebrate pest control agents (e.g., insecticides and acaricides) for mixing with compounds of Formula 1 (and *N*-oxides and salts thereof) include sodium channel modulators such as bifenthrin, cypermethrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerate, fenvalerate, indoxacarb, metofluthrin, profluthrin, pyrethrin and tralomethrin; cholinesterase inhibitors such as chlorpyrifos, methomyl, oxamyl, thiodicarb and triazamate; neonicotinoids such as acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiacloprid and thiamethoxam; insecticidal macrocyclic lactones such as spinetoram, spinosad, abamectin, avermectin and emamectin; GABA (γ–aminobutyric acid)-regulated chloride channel blockers such as endosulfan, ethiprole and fipronil; chitin synthesis inhibitors such as buprofezin, cyromazine, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron and triflumuron; juvenile hormone mimics such as diofenolan, fenoxycarb, methoprene and pyriproxyfen; octopamine receptor ligands such as amitraz; ecdysone agonists such as azadirachtin, methoxyfenozide and tebufenozide; ryanodine receptor ligands such as ryanodine, anthranilic diamides such as chlorantraniliprole, cyantraniliprole and flubendiamide; nereistoxin analogs such as cartap; mitochondrial electron transport inhibitors such as chlorfenapyr, hydramethylnon and pyridaben; lipid biosynthesis inhibitors such as spirodiclofen and spiromesifen; cyclodiene insecticides such as dieldrin; cyflumetofen; fenothiocarb; flonicamid; metaflumizone; pyrafluprole; pyridalyl; pyriprole; pymetrozine; spirotetramat; and thiosultap-sodium. One embodiment of biological agents for mixing with compounds of component (a) include nucleopolyhedro virus such as HzNPV

and AfNPV; *Bacillus thuringiensis* and encapsulated delta-endotoxins of *Bacillus thuringiensis* such as Cellcap, MPV and MPVII; as well as naturally occurring and genetically modified viral insecticides including members of the family Baculoviridae as well as entomophagous fungi. Of note is a composition comprising component (a) and at least one additional biologically active compound or agent selected from the Invertebrate Pest Control Agents listed in Table D1 above.

The following TESTS demonstrate the control efficacy of compounds of this invention on specific pathogens. The pathogen control protection afforded by the compounds is not limited, however, to these species. See Index Table A for compound descriptions. The following abbreviations are used in the Index Tables which follow: Me is methyl, Ph is phenyl, OMe is methoxy, -CN is cyano, $-NO_2$ is nitro. Also, "pyridin-2-yl" is synonymous with "2-pyridinyl", "pyridin-3-yl" is synonymous with "3-pyridinyl", and "pyrimidin-5-yl" is synonymous with 5-pyrimidinyl". The abbreviation "Ex." stands for "Example" and is followed by a number indicating in which example the compound is prepared. "Cmpd No. " means compound number. Mass spectra (M.S.) are reported as the molecular weight of the highest isotopic abundance parent ion (M+1) formed by addition of H^+ (molecular weight of 1) to the molecule, observed by mass spectrometry using atmospheric pressure chemical ionization (AP^+).

INDEX TABLE A



Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
1 (Ex. 1)	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NH	**
2	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
3	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NMe	*
4	H	Me	4-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
5	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	334
6	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NMe	348
7	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	369
8	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-Ph	NH	334
9	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	352
10	H	Me	4-Cl-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	NH	352

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
11	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	NH	334
12	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-Ph	NH	334
13	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
14	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	370
15	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	347
16	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	359
17 (Ex. 2)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	**
18	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	370
19	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	350
20	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO_2-Ph	O	380
21	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	O	365
22	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	NH	364
23	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366
24 (Ex. 3)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	**
25	H	Me	3-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
26	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-NO_2-Ph	O	364
27	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-Ph	O	353
28	H	Me	4-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	352
29	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
30	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-Cl-4-CF_3-Ph	O	455
31	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	380
32	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	398
33	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
34	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-Cl-pyridin-3-yl	NH	365
35	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
36	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
37	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
38	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	387
39	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-pyridin-2-yl	O	354
40	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	399
41	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
42	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
43	H	Me	3-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	344
44	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	360
45 (Ex. 4)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	**
46	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
47	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Cl-pyridin-2-yl	O	366
48	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	366
49	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	382
50	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Me-Ph	NH	344
51	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	390
52	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	358
53	Ph	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	476
54 (Ex. 8)	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	**
55	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl- 4-OMe-Ph	O	343
56	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	328
57	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	392
58 (Ex. 10)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	O	**
59	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-6-Cl-Ph	NH	424
60	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	362
61	Me	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	348
62	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
63	Me	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	374
64	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	O	388
65	-CO_2Et	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F, 4-NO_2-Ph	O	472
66	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Me-pyridin-2-yl	NH	345
67	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	5-CN-pyridin-2-yl	NH	342
68	-CO_2H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	444
69 (Ex. 5)	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	**
70	Me	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	382
71	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-(NHC(O)Me)-Ph	O	392
72	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	360
73	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	387

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
74	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	392
75	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
76	H	Me	2,4-di-F-Ph	6-Cl-pyridin-3-yl	NH	331
77	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-NH_2-Ph	O	382
78	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	384
79	H	Me	4-Me-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	332
80	H	Me	4-Me-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	344
81	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Cl-2,4-di-OMe-Ph	NH	424
82	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	391
83	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	396
84	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-Ph	O	367
85	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	386
86	H	Me	6-Cl-pyridin-3-yl	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	361
87	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	382
88	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-F-2-Me-Ph	NH	362
89	H	Me	4-F-2-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
90	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	O	447
91	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
92	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	379
93	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	378
94	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	6-OMe-pyridin-3-yl	NH	349
95	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-OMe-pyridin-3-yl	NH	361
96	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	362
97	H	Me	4-F-2-Me-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	358
98	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	378
99	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	380
100	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-2,4-di-OMe-Ph	NH	412
101	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	386
102	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	398
103	H	Me	2,6-di-F-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
104	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	382

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
105	H	Me	2,6-di-F-4-$OS(O)_2CF_3$	2,4-di-F-Ph	NH	484
106	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	361
107	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-pyridin-3-yl	NH	386
108	H	*c*-Pr	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	378
109	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	355
110	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-Ph	NH	***
111	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	NH	***
112	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
113	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-4-OMe-Ph	NH	***
114	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	***
115	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-Ph	NH	***
116	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-5-CN-Ph	O	360
117	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	389
118	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
119	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	396
120	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	361
121	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	398
122	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-NO_2-Ph	O	380
123	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-Cl-Ph	NH	***
124	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Me-Ph	NH	***
125	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-3-F-Ph	NH	***
126	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
127	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-3-OMe-Ph	NH	373
128	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	367
129	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	***
130	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	***
131	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-NO_2-Ph	O	***
132	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4,5-tri-F-Ph	NH	370
133	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
134	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	***
135	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Me-4-NO_2-Ph	O	***

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
136	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-Ph	NH	***
137	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
138	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***
139	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	376
140	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	392
141	H	Me	2,6-di-F-4-OEt-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	380
142	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	5-Cl-2-F-Ph	NH	***
143	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	***
144	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	***
145	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
146	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
147	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
148	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	378
149	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-CN-Ph	O	360
150	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	401
151	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-4-NO_2-Ph	O	***
152	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	383
153	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	429
154	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	353
155	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	390
156	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-4-NO_2-Ph	O	***
157	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	***
158	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NEt	410
159	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	$NCH_2CH{=}CH_2$	422
160	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	364
161	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	364
162	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	375
163	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	403
164	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
165	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
166	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	429

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
167	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	O	373
168	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	367
169	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	369
170	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	362
171	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	370
172	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	352
173	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	352
174	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	382
175	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
176	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	364
177	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
178	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
179	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
180	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***
181	H	Me	2-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	318
182	H	Me	2-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	336
183	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	348
184	H	Me	2-F-Ph	4-F-Ph	NH	300
185	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	379
186	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
187	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Me-Ph	O	***
188	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Me_Ph	O	363
189	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	O	354
190	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	382
191	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	369
192	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
193	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
194	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	***
195	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	***
196	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	343
197	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
198	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
199	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-F-2-OMe-Ph	NH	***
200	H	Me	2,6-di-F-Ph	3-OMe-Ph	NH	***
201	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
202	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
203	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
204	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
205	H	Me	2,3-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	318
206	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	365
207	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
208	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	381
209	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
210	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
211	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
212	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	***
213	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-Ph	O	349
214	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
215	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
216	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
217	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***
218	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***
219	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Me-Ph	O	333
220	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-Me-Ph	O	345
221	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-OMe-Ph	O	361
222	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-Ph	O	344
223	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-CN-Ph	O	356
224	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***
225	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***
226	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
227	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
228	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
229	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***
230	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
231	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
232	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	423
233	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	423
234	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-3-CN-Ph	NH	359
235	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	375
236	H	Me	2-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	384
237	H	Me	2-CF_3-Ph	4-F-Ph	NH	350
238	H	Me	2-CF_3-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
239	H	Me	2-CF_3-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
240	H	Me	2-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
241	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Cl-pyridin-2-yl	NH	353
242	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
243	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
244	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
245	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
246	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	***
247	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
248	H	Me	2-Br-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	398
249	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***
250	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***
251	H	Me	2-CF_3-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	401
252	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	387
253	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	402
254	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	4-F-Ph	NH	368
255	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
256	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
257	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	***
258	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***
259	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
260	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-F-5-CF_3-pyridin-2-yl	O	449
261	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-Cl-5-CF_3-pyridin-2-yl	O	465
262	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	404
263	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	416
264	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	387
265	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	413
266	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	415
267	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	399
268	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-pyrimidin-5-yl	NH	***
269	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Me-pyrimidin-5-yl	NH	***
270	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	pyrimidin-5-yl	NH	***
271	H	Me	2-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
272	H	Me	2-Br-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
273	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
274	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
275	H	Me	2,5-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
276	H	Me	2-Cl-5-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
277	H	Me	2-Cl-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
278	H	Me	2-F-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
279	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	353
280	H	Me	2-CF_3-Ph	3,5-di-F-pyridin-2-yl	NH	369
281	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
282	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	397
283	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	386
284	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	406
285	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	422
286	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	386
287	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386
288	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	346
289	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
290	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
291	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	***
292	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	431
293	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NMe	***
294	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NEt	***
295	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	430
296	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	413
297	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	370
298	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386
299	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	383
300	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
301	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***
302	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
303	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	400
304	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	$NS(O)_2Me$	***
305	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
306	H	Me	2-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
307	H	Me	2-Cl-5-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
308	H	Me	2-Cl-pyridin-3-yl	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
309	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH_2OMe	***
310	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	372
311	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	388
312	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	398
313	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	458
314	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	414
315	H	Me	2-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
316	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	448
317	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	392
318	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	433
319	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	418
320	H	Me	2-Cl-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	368
321	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	369

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
322	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	380
323	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	459
324	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	425
325	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OEt-Ph	NH	394
326	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH_2CN	409
327	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
328	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-Cl-pyridin-2-yl	NH	369
329	H	Me	2,5-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
330	H	Me	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	395
331	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	359
332	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	393
333	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
334	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
335	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	359
336	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	393
337	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-F-Ph	NH	***
338	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	375
339	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
340	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	***
341	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
342	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
343	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	369
344	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO_2-Ph	NH	380
345	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-5-NO_2-Ph	NH	380
346	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	398
347	H	Me	4-Cl-2-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
348	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-6-Cl-4-F-Ph	NH	432
349	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
350	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	CHOH	349
351 (Ex. 6)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	**
352	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	CHOH	383

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
353	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
354	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
355	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
356	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	CHOH	385
357	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
358	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	360
359	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	376
360	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	432
361	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344
362	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	394
363	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
364	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	416
365	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	432
366	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	414
367	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	402
368	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
369	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
370 (Ex. 7)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	C(=O)	**
371 (Ex. 9)	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NH_2-Ph	O	**
372	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-CN-Ph	O	
373	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	
374	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386
375	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
376	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
377	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
378	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	
379	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
380	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
381	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	CHOH	402
382	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	
383	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	NH	

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
384	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	CHOH	
385	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH	
386	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH	
387	H	Me	2-Cl-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	350
388	H	Me	2-Cl-4-OCH_2CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	389
389	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-4-F-Ph	NH	396
390	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	448
391	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	***
392	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	***
393	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OEt	NH	360
394	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F	O	369
395	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344
396	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
397	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386
398	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
399	H	Me	2,6-di-F-4-($OCH_2CH_2CH_2NMe_2$)-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	445
400	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
401	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
402	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	474
403	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	464
404	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
405	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	404
406	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
407	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	414
408	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	508
409	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	458
410	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	420
411	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
412	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	430
413	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	474

Cmpd No.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
414	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	464
415	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-2-I-Ph	NH	444
416	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Me-Ph	NH	342
417	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
418	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
419	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOAc	409
420	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	pyridin-2-yl	CHOH	332
421	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	CHOH	384
422	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	CHOH	385
423	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	CHOH	374
424	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-6-I-Ph	NH	478
425	H	Me	2-Cl-4-($OCH_2CH_2CH_2NHMe$)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	421
426	H	Me	2-Cl-4-($OCH_2CH_2CH_2OMe$)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	422
427	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366
428	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	382

* ^{1}H NMR data found in Index Table B

** AP^+ data or ^{1}H NMR data found in the Synthesis Examples

*** MP data found in Index Table C

INDEX TABLE B

Cmpd No.	^{1}H NMR Data ($CDCl_3$ solution unless indicated otherwise)[a]
3	δ 7.11 (m, 1H), 6.99 (m, 1H), 6.75–6.85 (m, 3H), 6.58 (m, 1H), 6.40 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 2.21 (s, 3H).

[a] ^{1}H NMR data are in ppm downfield from tetramethylsilane. Couplings are designated by (s)-singlet and (m)-multiplet.

INDEX TABLE C

Cmpd No.	Melting Point [b]	Cmpd No.	Melting Point	Cmpd No.	Melting Point
110	85–87	197	115–117	271	132–135
111	165–167	198	106–108	272	132–134

Cmpd No.	Melting Point [b]	Cmpd No.	Melting Point	Cmpd No.	Melting Point
112	80–82	199	134–136	273	152–153
113	135–137	200	139–141	274	141–143
114	147–149	201	109–111	275	168–171
115	168–170	207	57–59	276	115–117
123	171–173	209	92–96	277	131–134
124	135–137	210	73–77	278	112–114
125	138–140	211	110–114	281	49–52
126	142–144	212	130–134	289	148–150
129	127–130	214	105–107	290	181–183
130	129–131	215	90–92	291	146–149
131	129–133	216	152–154	293	116–118
133	160–162	217	72–76	294	113–115
134	228–230	218	112–117	300	178–180
135	112–117	224	132–135	301	168–170
136	152–154	225	123–126	304	186–191
137	165–167	226	139–141	305	101–105
138	171–173	227	99–102	306	134–138
142	186–188	228	133–135	307	161–166
143	93–95	229	144–146	308	142–145
144	176–178	231	108–110	309	118–123
145	142–144	242	91–93	327	118–120
146	145–147	243	82–84	329	98–100
147	60–62	244	95–97	333	177–179
151	150–158	245	73–75	334	117–119
156	107–114	246	182–184	337	186–188
157	96–101	247	156–158	339	135–136
164	106–110	249	83–87	340	137–139
165	111–113	250	126–129	341	151–153
178	110–112	256	171–173	353	169–171
179	105–107	257	172–174	354	111–113
180	130–132	258	121–124	355	90–92
186	78–84	259	97–100	363	229–231
187	107–113	268	178–180	391	181–183
194	133–135	269	80–85	392	155–157
195	98–100	270	172–176		

[b] Melting point data are °C.

BIOLOGICAL EXAMPLES OF THE INVENTION

General protocol for preparing test suspensions for Tests A–J: the test compounds were first dissolved in acetone in an amount equal to 3% of the final volume and then suspended at the desired concentration (in ppm) in acetone and purified water (50/50 mix by volume) containing 250 ppm of the surfactant Trem® 014 (polyhydric alcohol esters). The resulting test suspensions were then used in Tests A–J. Spraying a 200 ppm test suspension to the point of run-off on the test plants was the equivalent of a rate of 500 g/ha. Unless otherwise indicated, the rating values indicate a 200 ppm test suspension was used. (An asterisk "*" next to the rating value indicates a 40 ppm test suspension was used.)

TEST A

Grape seedlings were inoculated with a spore suspension of *Plasmopara viticola* (the causal agent of grape downy mildew) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 h. After a short drying period, the test suspension was sprayed to the point of run-off on the grape seedlings and then moved to a growth chamber at 20 °C for 4 days, after which time the test units were placed back into a saturated atmosphere at 20 °C for 24 h. Upon removal, visual disease ratings were made.

TEST B

The test suspension was sprayed to the point of run-off on tomato seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Botrytis cinerea* (the causal agent of tomato Botrytis) and incubated in saturated atmosphere at 20 °C for 48 h, and then moved to a growth chamber at 24 °C for 3 additional days, after which time visual disease ratings were made.

TEST C

The test suspension was sprayed to the point of run-off on tomato seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Alternaria solani* (the causal agent of tomato early blight) and incubated in a saturated atmosphere at 27 °C for 48 h, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 5 days, after which time visual disease ratings were made.

TEST D

The test suspension was sprayed to the point of run-off on tomato seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Phytophthora infestans* (the causal agent of tomato late blight) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 h, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 5 days, after which time visual disease ratings were made.

TEST E

The test suspension was sprayed to the point of run-off on creeping bent grass (*Agrostis* sp.) seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a bran and mycelial slurry of *Rhizoctonia solani* (the causal agent of turf brown patch) and incubated in a saturated atmosphere at 27 °C for 48 h, and then moved to a growth chamber at 27 °C for 3 days, after which time disease ratings were made.

TEST F

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Septoria nodorum* (the causal agent of *Septoria* glume blotch) and incubated in a saturated atmosphere at 24 °C for 48 h, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 6 days, after which time visual disease ratings were made.

TEST G

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Septoria tritici* (the causal agent of wheat leaf blotch) and incubated in saturated atmosphere at 24 °C for 48 h. and then the seedlings were moved to a growth chamber at 20 °C for 19 additional days, after which time visual disease ratings were made.

TEST H

Wheat seedlings were inoculated with a spore suspension of *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (the causal agent of wheat leaf rust) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 h, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 2 days. At the end of this time the test suspension was sprayed to the point of run-off, and then the seedlings were moved to a growth chamber at 20 °C for 6 days after which time visual disease ratings were made.

TEST I

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore suspension of *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (the causal agent of wheat leaf rust) and incubated in a saturated atmosphere at 20 °C for 24 h, and then moved to a growth chamber at 20 °C for 7 days, after which time visual disease ratings were made

TEST J

The test suspension was sprayed to the point of run-off on wheat seedlings. The following day the seedlings were inoculated with a spore dust of *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, (the causal agent of wheat powdery mildew) and incubated in a growth chamber at 20 °C for 8 days, after which time visual disease ratings were made.

Results for Tests A–J are given in Table A. In the Table, a rating of 100 indicates 100% disease control and a rating of 0 indicates no disease control (relative to the controls). A dash (–) indicates no test results.

TABLE A

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
1	0	99	0	0	47	0	99	-	0	98
2	8	1	0	0	0	0	0	-	0	0
3	6	0	25	9	0	0	13	-	0	99
4	29	87	46	0	0	0	98	-	53	97
5	36	0	25	0	0	0	0	-	0	0
6	65	10	23	0	0	0	0	-	0	93
7	29	99	0	0	63	0	100	-	74	92
8	55	99	54	0	99	0	100	-	97	99
9	-	99	0	0	55	0	100	-	98	97
10	-	47	0	0	0	0	0	-	0	0
11	-	99	99	0	99	0	100	-	99	100
12	-	99	93	0	99	0	100	-	99	100
13	-	99	100	0	98	64	100	-	100	99
14	-	98	0	-	-	0	99	-	99	98
15	-	99	67	-	-	73	99	-	98	99
16	-	60	0	-	-	0	47	48	28	0
17	-	100	100	-	-	93	97	96	100	100
18	-	99	100	-	-	99	95	99	100	100
19	-	100	85	-	-	0	96	0	92	98
20	-	100	99	-	-	100	100	79	100	99
21	-	98	100	-	-	97	-	-	100	99
22	-	90	85	-	-	90	94	9	94	100
23	-	98	100	-	-	99	93	92	100	100
24	-	98	100	-	-	0	94	9	97	100
25	-	100	0	-	-	0	100	0	94	79
26	-	99	83	-	-	0	100	0	99	100
27	-	99	88	-	-	0	95	0	25	87
28	-	99	0	-	-	0	96	7	91	0
29	-	94	0	-	-	0	98	0	46	0
30	-	7	0	-	-	0	41	0	79	0
31	-	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
32	-	99	0	-	-	0	96	0	99	97
33	-	0	0	-	-	0	95	0	18	0

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
34	-	100*	97*	-	-	0*	96*	0*	76*	0*
35	-	100	0	-	-	0	95	0	97	100
36	-	100	0	-	-	0	96	0	96	98
37	0	0	0	0	0	0	3	-	0	0
38	-	99	9	-	-	0	97	0	99	99
39	-	100	99	-	-	0	99	99	99	99
40	-	99	0	-	-	0	94	92	99	99
41	-	100	99	-	-	90	94	0	100	99
42	-	100	0	-	-	0	93	0	94	82
43	-	76	0	-	-	0	97	66	82	99
44	-	82	0	-	-	0	96	7	9	0
45	-	100	100	-	-	100	100	7	100	100
46	-	99	100	-	-	99	100	37	100	99
47	-	100*	87*	-	-	0*	99*	37*	96*	99*
48	-	100	78	-	-	0	99	0	98	98
49	-	100	17	-	-	35	99	0	89	79
50	-	99	57	-	-	0	100	0	98	99
51	-	100	0	-	-	0	100	0	89	78
52	-	54	0	-	-	0	97	0	92	64
53	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
54	-	96	0	-	-	0	41	0	95	95
55	-	6	0	-	-	0	98	0	41	73
56	-	43	0	-	-	0	99	0	28	64
57	-	98	0	-	-	0	94	85	85	0
58	-	98	100	-	-	89	98	82	100	100
59	-	94	0	-	-	0	88	0	68	0
60	-	75	0	-	-	0	97	59	79	0
61	-	97	0	-	-	0	99	0	38	73
62	-	99	98	-	-	84	98	98	99	99
63	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
64	-	97	80	-	-	0	100	0	95	98
65	-	0	0	-	-	0	1	0	58	0
66	-	100	99	-	-	0	100	6	100	99
67	-	95	0	-	-	0	99	24	95	86
68	-	0	0	-	-	0	0	6	0	0
69	-	100	73	-	-	60	99	91	99	100
70	-	99	0	-	-	0	99	41	85	98

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
71	-	93	0	-	-	0	96	0	91	67
72	-	0	0	-	-	0	0	59	0	0
73	-	100	99	-	-	64	100	88	100	99
74	-	0	0	-	-	0	25	4	0	0
75	-	100	98	-	-	98	99	95	99	97
76	-	100	0	-	-	0	98	6	0	0
77	-	99	0	-	-	0	95	6	97	0
78	-	99	82	-	-	0	98	0	89	91
79	-	99	0	-	-	0	99	0	55	0
80	-	100	0	-	-	0	99	18	86	89
81	-	97	0	-	-	0	0	0	27	0
82	-	100	100	-	-	40	99	0	68	13
83	-	100	100	-	-	89	99	99	96	94
84	-	100	100	-	-	78	100	98	100	99
85	-	0	0	-	-	0	17	0	19	0
86	-	0	0	-	-	0	48	0	0	0
87	-	100	100	-	-	95	98	85	99	100
88	-	100	100	-	-	99	98	95	99	100
89	-	99	0	-	-	0	99	0	0	97
90	-	99	95	-	-	84	100	0	98	100
91	-	100	99	-	-	95	99	0	100	100
92	-	100	100	-	-	99	100	41	99	100
93	-	41	0	-	-	0	77	0	9	0
94	-	99	70	-	-	29	98	0	9	0
95	-	99	16	-	-	0	97	0	0	0
96	-	99	99	-	-	99	100	9	99	100
97	-	100	99	-	-	95	100	0	99	99
98	-	100	17	-	-	69	100	26	99	99
99	-	100	99	-	-	100	99	40	100	100
100	-	38	0	-	-	0	48	0	41	0
101	-	100	99	-	-	100	100	99	99	100
102	-	100	100	-	-	98	99	0	100	98
103	-	100	64	-	-	0	95	0	91	0
104	-	100	99	-	-	97	99	99	99	100
105	-	23	0	-	-	0	73	9	0	72
106	-	100	99	-	-	90	100	82	99	100
107	-	99*	0*	-	-	0*	99*	8*	24*	0*

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
108	-	97	0	-	-	0	98	0	16	97
109	-	100	99	-	-	97	100	99	100	100
110	-	99	66	-	-	98	99	0	97	94
111	-	99	75	-	-	90	99	0	97	99
112	-	100	98	-	-	99	99	53	100	100
113	-	99	47	-	-	0	100	8	95	48
114	-	99	24	-	-	69	99	8	99	84
115	-	99	0	-	-	0	100	0	91	0
116	-	100	94	-	-	73	100	16	97	99
117	-	99	97	-	-	82	100	11	98	97
118	-	100	100	-	-	98	100	99	100	99
119	-	100	0	-	-	0	100	16	99	96
120	-	100	99	-	-	94	100	0	99	99
121	-	100	86	-	-	82	99	83	100	97
122	-	0	0	-	-	0	0	11	0	0
123	-	99	0	-	-	40	99	-	80	0
124	-	100	78	-	-	60	99	-	96	94
125	-	100	67	-	-	60	99	-	92	0
126	-	99	96	-	-	60	100	0	94	0
127	-	70	0	-	-	0	99	0	68	0
128	-	100	100	-	-	97	99	66	100	100
129	-	99	0	-	-	0	96	0	0	0
130	-	97	0	-	-	0	99	0	19	0
131	-	99	0	-	-	0	98	0	86	94
132	-	99	0	-	-	0	100	0	94	92
133	-	100	100	-	-	60	99	0	100	94
134	-	99	0	-	-	0	99	0	41	0
135	-	0	0	-	-	0	97	16	74	95
136	-	99	71	-	-	86	99	0	99	100
137	-	96	97	-	-	78	99	8	100	100
138	-	99	96	-	-	84	99	38	100	98
139	-	100	86	-	-	100	100	69	99	100
140	-	99	94	-	-	87	99	0	96	97
141	-	99	99	-	-	98	100	0	99	100
142	-	33	13	-	-	20	99	0	95	90
143	-	99	99	-	-	100	100	63	100	100
144	-	99	9	-	-	40	99	0	98	91

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
145	-	96	98	-	-	100	100	88	100	100
146	-	99	0	-	-	0	99	0	97	56
147	-	99	88	-	-	100	100	0	98	92
148	-	99	99	-	-	100	100	61	100	99
149	-	100	98	-	-	100	100	99	100	100
150	-	19	0	-	-	60	7	0	74	50
151	-	99	9	-	-	0	96	0	54	64
152	-	100	82	-	-	87	99	9	97	99
153	-	100	0	-	-	73	100	0	96	98
154	-	99	99	-	-	97	100	41	100	100
155	-	100	99	-	-	100	100	92	100	99
156	-	94	0	-	-	0	73	0	41	47
157	-	0	0	-	-	0	0	0	54	73
158	-	100	0	-	-	0	99	18	99	98
159	-	99	0	-	-	0	100	74	99	100
160	-	98	99	-	-	0	99	8	100	100
161	-	98	100	-	-	0	100	95	100	98
162	-	99	0	-	-	0	99	8	98	94
163	-	0	9	-	-	0	83	0	88	0
164	-	49	57	-	-	0	99	15	9	97
165	-	0	0	-	-	0	52	8	0	99
166	-	0	0	-	-	0	97	0	68	96
167	-	75	0	-	-	0	0	0	0	0
168	-	14	0	-	-	0	33	0	0	0
169	-	24	0	-	-	0	85	0	0	0
170	-	100	99	-	-	99	98	0	100	99
171	-	100	97	-	-	0	97	68	99	100
172	-	100	100	-	-	87	100	0	99	100
173	-	100	86	-	-	0	98	0	83	100
174	-	100	99	-	-	0	96	0	97	99
175	-	100	99	-	-	82	96	93	99	100
176	-	100	71	-	-	0	96	0	68	100
177	-	100	100	-	-	73	98	0	83	100
178	-	100	100	-	-	80	98	0	83	100
179	-	100	99	-	-	73	95	0	93	100
180	-	100	99	-	-	0	98	0	68	100
181	-	94	44	-	-	0	100	0	60	98

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
182	-	97	99	-	-	87	100	0	95	99
183	-	97	100	-	-	67	99	27	94	99
184	-	97	0	-	-	0	99	0	82	98
185	-	0	0	-	-	0	100	0	74	98
186	-	0	0	-	-	0	99	0	54	93
187	-	33	0	-	-	0	20	0	9	13
188	-	87	0	-	-	0	100	0	97	97
189	-	99	100	-	-	80	100	99	99	98
190	-	99	99	-	-	80	100	94	100	99
191	-	98	100	-	-	0	100	0	97	99
192	-	97	100	-	-	73	100	0	99	99
193	-	99	100	-	-	0	100	32	99	100
194	-	97	86	-	-	0	99	0	91	99
195	-	100	97	-	-	60	100	0	98	97
196	-	99	94	-	-	73	100	9	98	98
197	-	97	0	-	-	95	99	0	79	96
198	-	97	68	-	-	0	100	0	94	97
199	-	99	86	-	-	0	99	0	68	98
200	-	82	0	-	-	0	97	0	0	94
201	-	99	97	-	-	20	100	18	97	99
202	-	99	0	-	-	0	99	0	28	99
203	-	99	0	-	-	0	98	0	96	100
204	-	100*	77*	-	-	0*	99*	0*	86*	99*
205	-	100	17	-	-	0	99	0	91	100
206	-	99	99	-	-	84	99	41	99	100
207	-	100	93	-	-	64	100	0	99	100
208	-	100	100	-	-	99	100	0	99	99
209	-	0	0	-	-	0	0	0	0	97
210	-	0	0	-	-	0	100	99	94	99
211	-	77	0	-	-	0	99	0	17	96
212	-	0	17	-	-	-	98	0	-	-
213	-	97	30	-	-	0	85	94	96	100
214	-	98	51	-	-	0	100	9	99	100
215	-	89	0	-	-	0	98	0	94	99
216	-	96	0	-	-	0	76	0	26	99
217	-	75	0	-	-	0	83	40	79	99
218	-	94	0	-	-	0	99	17	92	87

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
219	-	70	0	-	-	0	0	17	0	0
220	-	98	97	-	-	40	98	40	99	100
221	-	98	94	-	-	82	100	17	99	100
222	-	99	99	-	-	0	100	88	99	100
223	-	96	9	-	-	99	100	0	100	100
224	-	99	51	-	-	0	100	17	91	100
225	-	65	0	-	-	0	99	0	79	98
226	-	99	0	-	-	0	96	28	91	100
227	-	87	0	-	-	0	99	0	74	98
228	-	99	99	-	-	0	99	0	80	99
229	-	99	17	-	-	0	99	0	91	98
230	-	99	99	-	-	0	100	0	97	100
231	-	98	34	-	-	0	100	0	86	100
232	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
233	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
234	-	99	0	-	-	0	99	0	92	84
235	-	84	0	-	-	0	17	0	0	79
236	-	97	0	-	-	0	96	0	68	97
237	-	99	0	-	-	0	97	0	68	97
238	-	99	0	-	-	0	0	53	9	43
239	-	99	95	-	-	0	67	0	68	100
240	-	100	99	-	-	0	99	0	99	100
241	-	99	99	-	-	0	100	97	100	100
242	-	99	37	-	-	0	100	0	91	100
243	-	100	64	-	-	0	100	0	97	100
244	-	82	0	-	-	0	91	0	0	96
245	-	90	0	-	-	0	97	0	68	93
246	-	99	51	-	-	0	100	0	80	100
247	-	100	99	-	-	60	100	0	99	100
248	-	99	26	-	-	73	100	0	99	100
249	-	40	0	-	-	0	99	0	96	100
250	-	98	0	-	-	0	77	0	86	100
251	-	99	0	-	-	0	98	0	86	100
252	-	100	97	-	-	0	100	0	100	100
253	-	99	0	-	-	0	0	0	0	76
254	-	100	0	-	-	0	84	0	0	64
255	-	100	0	-	-	0	0	0	0	39

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
256	-	99	99	-	-	96	100	0	99	100
257	-	100	99	-	-	0	100	0	97	98
258	-	41	9	-	-	0	89	0	68	90
259	-	98	9	-	-	0	100	0	86	97
260	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
261	-	0	0	-	-	0	0	0	0	47
262	-	99	51	-	-	0	0	0	68	99
263	-	100	98	-	-	0	100	0	98	100
264	-	100	98	-	-	0	92	0	99	98
265	-	100	99	-	-	78	100	90	100	100
266	-	100	100	-	-	98	100	0	100	100
267	-	100	79	-	-	60	100	0	96	93
268	-	95	93	-	-	0	99	0	74	0
269	-	80	0	-	-	0	67	8	0	0
270	-	92	86	-	-	0	91	8	0	81
271	-	100	99	-	-	99	100	0	99	98
272	-	100	97	-	-	99	99	0	99	99
273	-	0	0	-	-	0	72	0	27	43
274	-	8	0	-	-	0	96	8	0	69
275	-	97	46	-	-	0	99	8	97	99
276	-	100	99	-	-	98	100	31	100	100
277	-	100	0	-	-	0	100	0	96	98
278	-	99	0	-	-	0	99	0	82	100
279	-	100	99	-	-	0	100	8	98	100
280	-	99	0	-	-	0	96	8	18	87
281	-	98	44	-	-	0	-	0	94	98
282	-	99	98	-	-	0	-	0	99	100
283	-	99	65	-	-	0	-	9	99	100
284	-	99	99	-	-	100	-	28	100	100
285	-	98	0	-	-	60	-	9	99	99
286	-	98*	85*	-	-	60*	-	100*	100*	100*
288	9	99	52	0	92	0	-	-	74	92
289	-	100	0	-	-	0	99	0	96	97
290	-	100	99	-	-	87	100	0	100	100
291	-	99	0	-	-	0	98	0	85	43
292	-	100	99	-	-	96	100	92	100	100
293	0	97	47	0	99	0	-	-	94	99

Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
294	0	98	0	0	80	0	-	-	0	84
296	-	99	0	-	-	0	100	0	99	-
297	-	100	99	-	-	90	100	0	100	100
298	-	100	93	-	-	87	100	0	100	100
299	-	100	95	-	-	51		41	100	100
300	-	100	99	-	-	82	100	9	99	100
301	-	99	87	-	-	87	100	0	98	99
302	-	99*	0*	-	-	0*	99*	0*	18*	97*
303	-	99	0	-	-	0	98	0	92	71
304	-	0	0	-	0	0	16	-	0	0
305	-	99	99	-	-	94	100	0	99	99
306	-	7	0	-	-	0	93	0	28	64
307	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
308	-	81	0	-	-	0	98	9	100	0
309	-	97	61	-	92	60	100	-	0	99
310	-	100	99	-	-	99	100	0	99	96
311	-	100	0	-	-	60	100	0	99	91
313	-	100	97	-	-	51	100	91	100	100
314	-	100	95	-	-	0	100	94	100	100
315	-	99	99	-	-	0	100	0	96	100
316	-	99	0	-	-	0	-	9	99	96
318	-	99	0	-	-	0	100	0	97	89
319	-	92	88	-	-	100	100	0	99	95
320	-	99	67	-	-	0	100	0	99	98
321	-	100	99	-	-	78	100	9	99	100
322	-	100	93	-	-	0	100	99	100	100
323	-	98	0	-	-	0	98	0	94	-
324	-	99	83	-	-	0	100	63	99	99
325	-	100	0	-	-	0	100	0	97	99
326	8	99	99	0	99	73	100	-	99	94
327	-	99	0	-	-	0	100	0	96	99
328	-	100	86	-	-	0	100	0	98	100
329	-	100	99	-	-	69	100	0	100	100
331	-	100	80	-	-	73	100	8	100	97
333	-	100	0	-	-	0	100	9	74	0
334	-	100	0	-	-	0	100	0	97	100
336	-	100	97	-	-	95	100	94	100	99

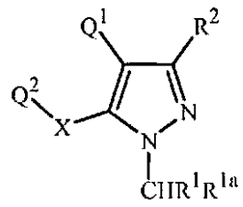
Cmpd No.	Test A	Test B	Test C	Test D	Test E	Test F	Test G	Test H	Test I	Test J
337	-	99	0	-	-	0	99	9	41	98
338	-	100	37	-	-	40	100	8	100	99
339	-	100	0	-	-	0	100	0	98	100
340	-	99	0	-	-	0	100	0	91	100
341	-	99	0	-	-	0	99	0	99	93
342	-	100	33	-	-	99	100	0	100	100
343	-	100	100	-	-	97	100	91	100	100
344	-	100	40	-	-	87	100	62	100	100
345	-	0	0	-	-	0	67	0	9	0
348	-	100	80	-	-	94	100	19	100	100
350	-	99	9	-	-	0	-	9	96	0
351	-	100	99	-	-	92	-	96	100	99
353	-	97	17	-	-	0	99	3	99	99
354	-	99	0	-	-	0	100	82	98	100
355	-	99	0	-	-	0	100	3	91	0
356	-	100	0	-	-	0	-	100	100	0
357	-	100	86	-	-	87	100	0	99	100
358	-	99	0	-	-	0	100	0	97	97
359	-	100	99	-	-	97	100	0	100	99
360	-	100	97	-	-	95	100	79	100	100
361	-	100	90	-	-	0	100	0	100	100
362	-	100	0	-	-	0	100	0	96	96
363	-	65	0	-	-	0	99	0	96	43
364	-	99	97	-	-	88	100	0	99	100
365	-	100	99	-	-	64	100	74	100	100
366	-	100	58	-	-	0	100	9	99	100
367	-	100	100	-	-	100	-	100	100	100
369	-	100	66	-	-	0	-	17	100	99
389	-	100	9	-	-	0	-	68	98	99
391	-	100	99	-	-	73	-	31	99	99
403	-	99	0	-	-	0	-	99	100	99

"Cmpd No." means compound number and refers to the same compound number as in Index Table A.

CLAIMS

What is claimed is:

1. A compound selected from Formula 1, *N*-oxides and salts thereof,



1

wherein

Q^1 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members;

Q^2 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members; or C_1–C_{12} alkyl, C_2–C_{12} alkenyl, C_2–C_{12} alkynyl,

C_3–C_{12} cycloalkyl or C_3–C_{12} cycloalkenyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3;

X is O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) or C(=S);

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl; or

R^1 is phenyl optionally substituted with up to 3 R^8; or a five- or six-membered nitrogen-containing aromatic heterocycle optionally substituted with up to 3 substituents independently selected from R^{9a} on carbon atom ring members and R^{9b} on nitrogen atom ring members;

R^{1a} is H; or

R^{1a} and R^1 are taken together with the carbon atom to which they are attached to form a cyclopropyl ring optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, halogen, cyano, cyanomethyl, halomethyl, hydroxymethyl, methoxy or methylthio; or cyclopropyl optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, formylamino, C_2–C_3 alkylcarbonylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_1–C_2 alkylsulfonyloxy, C_1–C_2 haloalkylsulfonyloxy, C_3–C_4 cycloalkyl, C_3–C_7 cycloalkoxy, C_4–C_6 alkylcycloalkyl, C_4–C_6 cycloalkylalkyl, C_3–C_7 halocycloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, hydroxy, formyl, C_2–C_3 alkylcarbonyl, C_2–C_3 alkylcarbonyloxy, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ or -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_2–C_5 alkenyl, C_3–C_5 alkynyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$, $-S(=O)_tR^{10}$, $-(C=W)R^{11}$, NH_2 or OR^{21}; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

R^6 and R^7 are independently selected from H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_3–C_7 cycloalkyl, C_4–C_8 cycloalkylalkyl and C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting ring nitrogen atom, selected from carbon atoms and optionally up to one ring member selected from O, $S(O)_n$ and NR^{13};

each R^8, R^{9a} and R^{9b} is independently selected from halogen, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy, C_1–C_2 haloalkoxy, cyano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ and $S(O)_2CH_3$;

R^{10} is C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl;

each R^{11} is independently C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_7 alkoxyalkyl, C_2–C_7 alkylaminoalkyl, C_2–C_8 dialkylaminoalkyl, C_1–C_6 alkylthio or C_2–C_7 alkylthioalkyl;

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy, C_1–C_4 haloalkoxy, C_1–C_4 alkylthio, C_1–C_4 alkylsulfinyl, C_1–C_4 alkylsulfonyl or cyano;

R^{13} is H, C_1–C_3 alkyl or C_2–C_3 haloalkyl;

each R^{14} is independently H, cyano, C_1–C_3 alkyl or C_1–C_3 haloalkyl;

R^{15} is H, C_1–C_4 alkyl or OR^{18};

R^{16} is C_1–C_4 alkyl or OR^{18}; or

R^{15} and R^{16} are taken together as $-OCH_2CH_2O-$;

each R^{18} is independently H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$ or $-(C=W)R^{11}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

each R^{19} and R^{20} is independently H or CH_3;

R^{21} is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl, $-SO_3^-M^+$ or $-(C=W)R^{11}$; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

each U is independently O, $S(=O)_w$, NR^{22} or a direct bond;

each V is independently C_1–C_6 alkylene, C_2–C_6 alkenylene, C_3–C_6 alkynylene, C_3–C_6 cycloalkylene or C_3–C_6 cycloalkenylene, wherein up to 3 carbon atoms are independently selected from C(=O), each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from halogen, cyano, nitro, hydroxy, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_1–C_6 alkoxy and C_1–C_6 haloalkoxy;

each T is independently cyano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} or $S(=O)_yR^{25}$

each R^{22} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl); or

a pair of R^{23a} and R^{23b} attached to the same nitrogen atom are taken together with the nitrogen atom to form a 3- to 6-membered heterocyclic ring, the ring optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^{26};

each R^{24} and R^{25} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{26} is independently halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_1–C_6 alkoxy;

each W is independently O or S;

each M^+ is independently a cation;

m is 0, 1 or 2;

n is 0, 1 or 2;

t is 0, 1 or 2;

each u and v are independently 0, 1 or 2 in each instance of $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, provided that the sum of u and v is 0, 1 or 2;

each w is independently 0, 1 or 2; and

each y is independently 0, 1 or 2;

provided that:

when Q^2 is a phenyl ring substituted on at least one ortho position with a substituent selected from -U-V-T wherein U is a direct bond, V is C(=O) and T is $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24}, then X is other than NR^4.

2. A compound of Claim 1 wherein:

Q^1 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with from 1 to 4 substituents independently selected from R^3; provided that when an R^3 substituent is located at a meta position, then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano;

Q^2 is phenyl, pyridinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or pyridazinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3, provided that when an R^3 substituent is located at a meta position, then said R^3 substituent is selected from F, Cl, Br and cyano;

X is O, NR^4, C(=O) or $CR^{15}R^{16}$;

R^1 is H, halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, cyano, C_1–C_6 alkoxy, C_1–C_6 haloalkoxy or C_2–C_5 alkoxyalkyl;

R^{1a} is H;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, Cl or Br;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_3–C_4 cycloalkyl, $C(=S)NH_2$ and -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl, each optionally substituted with up to 2 R^{12};

R^5 is C_1–C_6 alkyl;

R^6 is H or C_1–C_6 alkyl;

R^7 is H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_4–C_8 alkylcycloalkyl; or

R^6 and R^7 are taken together with the nitrogen atom to which they are connected to form a four- to seven-membered nonaromatic heterocyclic ring containing ring members, in addition to the connecting nitrogen atom, selected from carbon atoms and up to one ring member selected from O and NR^{13};

each R^{12} is independently C_3–C_7 cycloalkyl, C_1–C_4 alkoxy or cyano;

R^{13} is H or CH_3;

R^{15} is H or CH_3; and

R^{16} is OR^{18}.

3. A compound of Claim 2 wherein

Q^1 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl or pyridinyl, each substituted with 1, 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

R^1 is H, halogen or C_1–C_6 alkyl;

R^2 is CH_3, Cl or Br;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy and -U-V-T;

R^4 is H, formyl, C_3–C_7 cycloalkyl or -SR^{10}; or C_1–C_6 alkyl substituted with one R^{12};

each R^{12} is independently cyclopropyl, -OCH_3 or cyano;

R^{15} is H;

each U is independently O or NH;

each V is C_2–C_4 alkylene;

each T is independently $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24};

each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl; and

each R^{24} is independently H, C_1–C_6 alkyl or C_1–C_6 haloalkyl.

4. A compound of Claim 3 wherein

at least one of Q^1 and Q^2 is phenyl substituted with 2 or 3 substituents independently selected from R^3;

R^1 is H or CH_3;

R^2 is CH_3;

R^4 is H;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, C_1–C_3 alkyl, C_1–C_3 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy and C_1–C_3 haloalkoxy; and

R^{18} is H.

5. A compound of Claim 4 wherein

Q^1 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

Q^2 is phenyl substituted at the 2-, 4- and 6-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 4-positions with substituents independently selected from R^3; or phenyl substituted at the 2- and 6-positions with substituents independently selected from R^3;

X is O, NR^4 or $CR^{15}R^{16}$;

R^1 is H;

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, C_1–C_2 alkyl, C_1–C_2 haloalkyl, C_1–C_2 alkoxy and C_1–C_2 haloalkoxy; and

R^4 is H.

6. A compound of Claim 5 wherein

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano, methyl, C_1–C_2 alkoxy and fluoromethoxy.

7. A compound of Claim 6 wherein

X is O or NH; and

each R^3 is independently selected from F, Cl, Br, cyano and methoxy.

8. A compound of Claim 1 which is selected from the group:

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-*N*-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-4-(3,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzonitrile,

4-[[4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile,
4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile,
3-chloro-4-[[4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile,
4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-α-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol,
N,4-bis(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(2-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
3-chloro-4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile,
4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]amino]-3,5-difluorobenzonitrile,
4-[[4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-2,5-difluorobenzonitrile,
N-(2-chloro-4-fluorophenyl)-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
α,4-bis(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol,
N-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-amine,
N-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
N-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,
3-chloro-4-[5-[(2-chloro-4,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitrile,
3-chloro-4-[5-[(4-chloro-2,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-benzonitrile,

N-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,4-dichloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-*N*-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-[[4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3-fluorobenzonitrile,

N-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-[[4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]-3,5-difluorobenzonitrile,

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-*N*-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

4-(2-bromo-4-fluorophenyl)-*N*-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile,

3-chloro-4-[[4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-yl]oxy]benzonitrile,

N-(2,4-dichloro-6-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2,6-dichloro-4-fluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(4-bromo-2,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

N-(2-bromo-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-6-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-5-amine,

α-(4-chloro-2,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol,

4-[5-[(2-chloro-4,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-fluorobenzonitrile,

4-[5-[(4-chloro-2,6-difluorophenyl)amino]-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazol-4-yl]-3-fluorobenzonitrile,

α-(2-chloro-4,6-difluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol,

α-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2,4-difluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol, and

α-(2-bromo-4-fluorophenyl)-4-(2-chloro-4-fluorophenyl)-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-5-methanol.

9. The compound of Claim 1 which is 4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-1,3-dimethyl-*N*-(2,4,6-trifluorophenyl)-1*H*-pyrazol-5-amine.

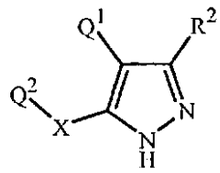
10. A fungicidal composition comprising (a) a compound of Claim 1; and (b) at least one other fungicide.

11. A fungicidal composition comprising: (a) a compound of Claim 1; and (b) at least one additional component selected from the group consisting of surfactants, solid diluents and liquid diluents.

12. A method for controlling plant diseases caused by fungal plant pathogens comprising applying to the plant or portion thereof, or to the plant seed, a fungicidally effective amount of a compound of Claim 1.

13. A composition comprising a compound of Claim 1, and at least one invertebrate pest control compound or agent.

14. A compound of Formula **2** or a salt thereof



2

wherein

Q^1 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring

members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members;

Q^2 is a phenyl ring or a naphthalenyl ring system, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3; or a 5- to 6-membered saturated, partially unsaturated or fully unsaturated heterocyclic ring or an 8- to 10-membered heteroaromatic bicyclic ring system, each ring or ring system containing ring members selected from carbon atoms and up to 4 heteroatoms independently selected from up to 2 O, up to 2 S and up to 4 N atoms, wherein up to 3 carbon ring members are independently selected from C(=O) and C(=S), and the sulfur atom ring members are independently selected from $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, each ring or ring system optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3 on carbon atom ring members and selected from cyano, C_1–C_6 alkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_2–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_1–C_6 alkoxy, C_2–C_6 alkoxyalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 alkylaminoalkyl and C_3–C_6 dialkylaminoalkyl on nitrogen atom ring members; or C_1–C_{12} alkyl, C_2–C_{12} alkenyl, C_2–C_{12} alkynyl, C_3–C_{12} cycloalkyl or C_3–C_{12} cycloalkenyl, each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^3;

X is NH;

R^2 is CH_3, CH_2CH_3, halogen, cyano, cyanomethyl, halomethyl, hydroxymethyl, methoxy or methylthio; or cyclopropyl optionally substituted with up to 2 substituents independently selected from halogen and methyl;

each R^3 is independently selected from halogen, cyano, nitro, amino, methylamino, dimethylamino, formylamino, C_2–C_3 alkylcarbonylamino, C_1–C_4 alkyl, C_1–C_4 haloalkyl, C_1–C_3 alkoxy, C_1–C_3 haloalkoxy, C_1–C_3 alkylthio, C_1–C_3 haloalkylthio, C_1–C_3 alkylsulfinyl, C_1–C_3 haloalkylsulfinyl, C_1–C_3 alkylsulfonyl, C_1–C_3 haloalkylsulfonyl, C_1–C_2 alkylsulfonyloxy, C_1–C_2 haloalkylsulfonyloxy, C_3–C_4 cycloalkyl, C_3–C_7 cycloalkoxy, C_4–C_6 alkylcycloalkyl, C_4–C_6 cycloalkylalkyl, C_3–C_7 halocycloalkyl, C_2–C_4 alkenyl, C_2–C_4 alkynyl, hydroxy, formyl, C_2–C_3 alkylcarbonyl, C_2–C_3 alkylcarbonyloxy, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ or -U-V-T;

each R^{14} is independently H, cyano, C_1–C_3 alkyl or C_1–C_3 haloalkyl;

each R^{19} and R^{20} is independently H or CH_3;

each U is independently O, $S(=O)_w$, NR^{22} or a direct bond;

each V is independently C_1–C_6 alkylene, C_2–C_6 alkenylene, C_3–C_6 alkynylene, C_3–C_6 cycloalkylene or C_3–C_6 cycloalkenylene, wherein up to 3 carbon atoms are independently selected from C(=O), each optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from halogen, cyano, nitro, hydroxy, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_1–C_6 alkoxy and C_1–C_6 haloalkoxy;

each T is independently cyano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} or $S(=O)_yR^{25}$

each R^{22} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{23a} and R^{23b} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

or a pair of R^{23a} and R^{23b} attached to the same nitrogen atom are taken together with the nitrogen atom to form a 3- to 6-membered heterocyclic ring, the ring optionally substituted with up to 5 substituents independently selected from R^{26};

each R^{24} and R^{25} is independently H, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl, C_2–C_6 alkenyl, C_3–C_6 alkynyl, C_3–C_6 cycloalkyl, C_3–C_6 halocycloalkyl, C_2–C_6 alkylcarbonyl, C_2–C_6 alkoxycarbonyl, C_2–C_6 (alkylthio)carbonyl, C_2–C_6 alkoxy(thiocarbonyl), C_4–C_8 cycloalkylcarbonyl, C_4–C_8 cycloalkoxycarbonyl, C_4–C_8 (cycloalkylthio)carbonyl or C_4–C_8 cycloalkoxy(thiocarbonyl);

each R^{26} is independently halogen, C_1–C_6 alkyl, C_1–C_6 haloalkyl or C_1–C_6 alkoxy;

each u and v are independently 0, 1 or 2 in each instance of $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, provided that the sum of u and v is 0, 1 or 2;

each w is independently 0, 1 or 2; and

each y is independently 0, 1 or 2;

provided that:

(a) when Q^2 is a phenyl ring substituted on at least one ortho position with a substituent selected from -U-V-T wherein U is a direct bond and T is $NR^{23a}R^{23b}$ or OR^{24}, then V is other than C(=O); and

(b) when Q^1 is phenyl and Q^2 is 4-(trifluoromethyl)phenyl, then R^2 is other than methyl.

TRADUCCIÓN

PIRAZOLES FUNGICIDAS

CAMPO DE LA INVENCIÓN

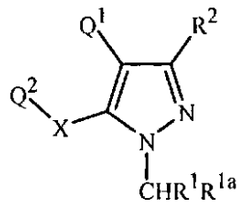
La presente invención se relaciona con ciertos pirazoles, sus *N*-óxidos, sales y composiciones, y los métodos para su uso como fungicidas.

ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

El control de las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas es extremadamente importante para alcanzar una alta eficacia de cultivo. El daño causado por las enfermedades de las plantas a cultivos ornamentales, extensivos, frutales, vegetales y cerealeros puede reducir significativamente la productividad y, por lo tanto, generar mayores costos al consumidor. Existe un gran número de productos que están comercialmente disponibles para estos fines, pero persiste la necesidad de contar con nuevos compuestos que sean más eficaces, de menor costo y toxicidad, más seguros para el medio ambiente o que tengan distintos sitios de acción. La patente núm. JP09208620 describe derivados de *N*-fenilpirazolilamina y N-piridilpirazolilamina como insecticidas, herbicidas y fungicidas; sin embargo, los fungicidas de la presente invención no se exponen en la presente publicación.

BREVE DESCRIPCIÓN DE LA INVENCIÓN

La presente invención está dirigida a compuestos de la Fórmula **1** (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos, y sales de estos, composiciones agrícolas que los contienen y su uso como fungicidas:



1

en donde

Q^1 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los

miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de átomos de nitrógeno; Q^2 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema

anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno; o alquilo de C_1-C_{12}, alquenilo de C_2-C_{12}, alquinilo de C_2-C_{12}, cicloalquilo de C_3-C_{12} o cicloalquenilo de C_3-C_{12}; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S);

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, cicloalquilo de C_3-C_7, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5; o

R^1 es fenilo sustituido opcionalmente con hasta 3 R^8; o un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

R^{1a} es H; o

R^{1a} y R^1 se toman junto con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo de ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, halógeno, ciano, cianometilo, halometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, formilamino, alquilcarbonilamino de C_2-C_3, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, alquilsulfoniloxi de C_1-C_2, haloalquilsulfoniloxi de C_1-C_2, cicloalquilo de C_3-C_4, cicloalcoxi de C_3-C_7, alquilcicloalquilo de C_4-C_6, cicloalquilalquilo de C_4-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_7, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, hidroxi, formilo, alquilcarbonilo de C_2-C_3, alquilcarboniloxi de C_2-C_3, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR_{19}R_{20}$ o -U-V-T;

R^4 es H, formilo, alquenilo de C_2-C_5, alquinilo de C_3-C_5, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3^-M^+$, $-S(=O)_tR^{10}$, $-(C=W)R^{11}$, NH_2

u OR^{21}; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

R^5 es H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

R^6 y R^7 se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, cicloalquilo de C_3-C_7, cicloalquilalquilo de C_4-C_8 y alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno del anillo conector, seleccionados de átomos de carbono y, opcionalmente, hasta un miembro de anillo seleccionado de O, $S(O)_n$ y NR^{13};

cada R^8, R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ y $S(O)_2CH_3$;

R^{10} es alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

cada R^{11} es independientemente alquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_7, alquilaminoalquilo de C_2-C_7, dialquilaminoalquilo de C_2-C_8, alquiltio de C_1-C_6 o alquiltioalquilo de C_2-C_7;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4, haloalcoxi de C_1-C_4, alquiltio de C_1-C_4, alquilsulfinilo de C_1-C_4, alquilsulfonilo de C_1-C_4 o ciano;

R^{13} es H, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_2-C_3;

cada R^{14} es independientemente H, ciano, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_1-C_3;

R^{15} es H, alquilo de C_1-C_4 u OR^{18};

R^{16} es alquilo de C_1-C_4 u OR^{18}; o

R^{15} y R^{16} se toman juntos como $-OCH_2CH_2O-$;

cada R^{18} es independientemente H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3$-M+ o $-(C=W)R^{11}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

cada R^{19} y R^{20} es independientemente H o CH_3;

R_{21} es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3$-M+ o $-(C=W)R^{11}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R_{12};

cada U es independientemente O, $S(=O)_w$, NR^{22} o un enlace directo;

cada V es independientemente alquileno de C_1-C_6, alquenileno de C_2-C_6, alquinileno de C_3-C_6, cicloalquileno de C_3-C_6 o cicloalquenileno de C_3-C_6, en donde hasta 3 átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O); cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados

independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxi, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6 y haloalcoxi de C_1-C_6;

cada T es independientemente ciano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} o $S(=O)_yR^{25}$

cada R^{22} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8; o un par de R^{23a} y R^{23b} unidos al mismo átomo de nitrógeno se toman junto con el átomo de nitrógeno para formar un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros; el anillo está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{26};

cada R^{24} y R^{25} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{26} es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alcoxi de C_1-C_6;

cada W es independientemente O o S;

cada M^+ es independientemente un catión;

m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1 o 2;

t es 0, 1 o 2;

cada u y v es independientemente 0, 1 o 2 en cada instancia de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, siempre que la suma de u y v sea 0, 1 o 2;

cada w es independientemente 0, 1 o 2; y

cada y es independientemente 0, 1 o 2;

siempre que:

cuando Q^2 es un anillo de fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de -U-V-T, en donde U es un enlace directo, V es C(=O) y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24}, entonces X es distinto de NR^4.

Más particularmente, esta invención se relaciona con un compuesto de la Fórmula **1** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), un *N*-óxido o una sal de estos.

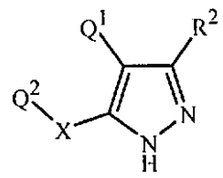
La presente invención se relaciona, además, con una composición fungicida que comprende un compuesto de la Fórmula **1**, un N-óxido o una sal de estos, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

La presente invención se relaciona, además, con una composición fungicida que comprende: (a) un compuesto de la Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal de estos, y (b) al menos otro fungicida (por ejemplo, al menos otro fungicida que tiene un sitio de acción diferente).

La presente invención se relaciona, además, con un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas; el método comprende aplicar a la planta o a una porción de esta, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la invención (por ejemplo, como una composición descrita en la presente).

La presente invención se relaciona, además, con una composición que comprende un compuesto de la Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal de estos, y al menos un compuesto o agente para controlar la plaga de invertebrados.

La presente invención se relaciona, además, con compuestos de la Fórmula **2** (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros) y sales de estos



2

en donde

X es NH; y

Q^1, Q^2 y R^2 son como los definidos anteriormente para la Fórmula **1**;

siempre que:

(a) cuando Q^2 es un anillo de fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de -U-V-T, en donde U es un enlace directo y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24}, entonces V es distinto de C(=O); y

(b) cuando Q^1 es fenilo y Q^2 es 4-(trifluorometil)fenilo, entonces R^2 es distinto de metilo;

y con el uso de esos compuestos como intermedios para preparar compuestos de la Fórmula **1**. Más

particularmente, la presente invención se relaciona con un compuesto de la Fórmula **2** o una sal de este.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCIÓN

Como se usa en la presente descripción, los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene", "que contiene", "caracterizado por", o cualquier otra variación de estos, pretenden abarcar una inclusión no exclusiva sujeta a cualquier limitación explícitamente indicada. Por ejemplo, una composición, una mezcla, un proceso o método que comprenda una lista de elementos no se limita necesariamente sólo a esos elementos, sino que puede incluir otros que no estén expresamente enumerados o sean inherentes a tal composición, mezcla, proceso o método.

La frase transicional "consistente de" excluye cualquier elemento, etapa, o ingrediente no especificado. Si aparece en la reivindicación, esa frase cierra la reivindicación para incluir materiales diferentes a los que se mencionaron excepto por las impurezas asociadas a ellos. Cuando la frase "consistente de" aparece en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de inmediatamente a continuación del preámbulo, esta limita solamente el elemento que se expone en esa cláusula; no se excluyen de la reivindicación otros elementos en su totalidad.

La frase transicional "que consiste prácticamente en" se usa para definir una composición o un método que incluye

materiales, etapas, características, componentes, o elementos, además de aquellos descritos literalmente, siempre que esos materiales, etapas, características, componentes, o elementos adicionales no afectan materialmente la o las características básicas y novedosas de la invención reivindicada. El término "consistente esencialmente de" ocupa un punto medio entre "que comprende" y "consistente de".

Cuando los solicitantes han definido una invención o una entidad de esta con un término abierto, tal como "que comprende", se debe comprender inmediatamente que (a menos que se declare de cualquier otra forma) se debe interpretar que la descripción también describe tal invención con los términos "consistente esencialmente de" o "consistente de".

Además, a menos que se especifique expresamente lo contrario, la disyunción se relaciona con un "o" incluyente y no con un "o" excluyente. Por ejemplo, una condición A o B se satisface mediante cualquiera de los siguientes criterios: A es verdadero (o actual) y B es falso (o no actual), A es falso (o no actual) y B es verdadero (o actual), y tanto A como B son verdaderos (o actuales).

Además, los artículos indefinidos "un(a)" y "unos(as)" que preceden un elemento o componente de la invención están previstos para ser no limitantes con respecto a la cantidad de instancias (es decir, incidencias) del elemento o componente.

Por consiguiente, "un(a)" o "unos(as)" deben interpretarse para incluir uno o al menos uno, y la forma singular de la palabra del elemento o componente incluye, además, el plural, a menos que el número obviamente indique que es singular.

Como se usa en la presente descripción y en las reivindicaciones, el término "planta" incluye miembros del Reino Plantae, particularmente plantas de semillas (Spermatopsida), en todas las etapas de la vida, que incluyen plantas jóvenes (por ejemplo, semillas germinantes que desarrollan en plántulas) y etapas maduras reproductivas (por ejemplo, plantas que producen flores y semillas). Las porciones de las plantas incluyen miembros geotrópicos que crecen, típicamente, de la superficie del medio de crecimiento (por ejemplo, suelo), tales como raíces, tubérculos, bulbos y cormos, y también miembros que crecen por encima del medio de crecimiento, tales como follaje (que incluye tallos y hojas), flores, frutos y semillas.

Tal como se usa en la presente descripción, el término "plántula", usado solo o en una combinación de palabras, significa una planta joven que se está desarrollando a partir del embrión de una semilla.

Como se usa en la presente descripción, el término "agente alquilatante" se refiere a un compuesto químico en el cual un radical que contiene carbono se une a través de un átomo de

carbono al grupo saliente tal como haluros o sulfonato, el cual es desplazable por unión de un nucleófilo a dicho átomo de carbono. A menos que se indique de cualquier otra forma, el término "alquilatante" no limita el radical que contiene carbono a alquilo; los radicales que contienen carbono en los agentes alquilantes incluyen la variedad de radicales sustituyentes unidos al carbono especificados para R^1.

Generalmente, cuando un fragmento molecular (es decir, radical) se designa por medio de una serie de símbolos atómicos (por ejemplo, C, H, N, O, S), aquellos con experiencia en la técnica reconocerán fácilmente el o los puntos de unión implícitos. En algunos casos de la presente descripción, particularmente cuando los puntos de unión alternativos son posibles, el o los puntos de unión podrían indicarse explícitamente por medio de un guión ("-"). Por ejemplo, "-SCN" indica que el punto de unión es el átomo de azufre (es decir, tiocianato y no isotiocianato).

En las menciones anteriores, el término "alquilo", usado solo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilos de cadena recta o ramificada, tales como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo o los diferentes isómeros butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena recta o ramificada, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y los diferentes isómeros butenilo. "Alquenilo"

incluye, además, polienos, tales como 1,2-propadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena recta o ramificada, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros butinilo. "Alquenileno" designa un alquenodiilo de cadena recta o ramificada que contiene un enlace olefínico. Los ejemplos de "alquenileno" incluyen CH=CH, $CH_2CH=CH$, $CH=C(CH_3)$. "Alquinileno" designa un alquinodiilo de cadena recta o ramificada que contiene un enlace triple. Los ejemplos de "alquinileno" incluyen $CH_2C\equiv C$, $C\equiv CCH_2$ y los diferentes isómeros butinileno, pentinileno y hexinileno.

"Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" designa la sustitución alcoxi en el alquilo. Los ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2, $CH_3OCH_2CH_2$, $CH_3CH_2OCH_2$, $CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$ y $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. "Alquiltio" incluye porciones alquiltio de cadena recta o ramificada, tales como metiltio, etiltio y los diferentes isómeros propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfinilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinilo. Los ejemplos de "alquilsulfinilo" incluyen $CH_3S(O)-$, $CH_3CH_2S(O)-$, $CH_3CH_2CH_2S(O)-$, $(CH_3)_2CHS(O)-$ y los diferentes isómeros butilsulfinilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $CH_3S(O)_2-$, $CH_3CH_2S(O)_2-$, $CH_3CH_2CH_2S(O)_2-$, $(CH_3)_2CHS(O)_2-$ y los diferentes isómeros

butilsulfonilo. "Alquiltioalquilo" designa una sustitución alquiltio en alquilo. Los ejemplos de "alquiltioalquilo" incluyen CH_3SCH_2, $CH_3SCH_2CH_2$, $CH_3CH_2SCH_2$, $CH_3CH_2CH_2CH_2SCH_2$ y $CH_3CH_2SCH_2CH_2$. "(Alquiltio)carbonilo" designa un grupo alquiltio de cadena recta o ramificada unido a una porción C(=O). Los ejemplos de "(alquiltio)carbonilo" incluyen $CH_3SC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2SC(=O)$ y $(CH_3)_2CHSC(=O)$. "Alcoxi(tiocarbonilo)" designa un grupo alcoxi de cadena recta o ramificada unido a una porción C(=S). Los ejemplos de "alcoxi(tiocarbonilo)" incluyen $CH_3OC(=S)$, $CH_3CH_2CH_2OC(=S)$ y $(CH_3)_2CHOC(=S)$. "Alquilaminoalquilo" designa porciones alquilo de cadena recta o ramificada unidas a un átomo de nitrógeno de una porción amino alquilo (de cadena recta o ramificada). Los ejemplos de "alquilaminoalquilo" incluyen CH_3NHCH_2-, $(CH_3)_2CHNHCH_2$- y $CH_3NHCH(CH_3)$-. "Dialquilaminoalquilo" designa dos porciones alquilo de cadena recta o ramificada independientes unidas a un átomo de nitrógeno de una porción amino alquilo(de cadena recta o ramificada). Los ejemplos de "dialquilaminoalquilo" incluyen $(CH_3)_2NCH_2$-, $(CH_3)_2CH(CH_3)NCH_2$- y $(CH_3)_2NCH(CH_3)$-. El término "alquilcarbonilamino" designa alquilo unido a una porción C(=O)NH. Los ejemplos de "alquilcarbonilamino" incluyen $CH_3CH_2C(=O)NH$ y $CH_3CH_2CH_2C(=O)NH$.

"Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término

"alquilcicloalquilo" indica una sustitución alquilo en una porción cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, *i*-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" designa una sustitución cicloalquilo en una entidad alquilo. Ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otras porciones cicloalquilo enlazadas a grupos alquilo de cadena recta o ramificada. El término "cicloalcoxi" designa cicloalquilo unido a través de un átomo de oxígeno, tales como ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. "Cicloalquenilo" incluye anillos carbocíclicos que contienen solamente un enlace doble, tales como ciclopentenilo y ciclohexenilo, además de anillos carbocíclicos con más de un enlace doble tal como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo, pero no son aromáticos. "Cicloalquilcarbonilo" designa cicloalquilo unido a un grupo C(=O) que incluye, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo y ciclopentilcarbonilo. El término "cicloalcoxicarbonilo" significa cicloalcoxi unido a un grupo C(=O), por ejemplo, ciclopropiloxicarbonilo y ciclopentiloxicarbonilo. El término"cicloalquileno" designa un anillo cicloalcanodiilo. Los ejemplos de "cicloalquileno" incluyen ciclopropileno, ciclobutileno, ciclopentileno y ciclohexileno. El término "cicloalquenileno" designa un anillo cicloalquenodiilo que contiene un enlace olefínico.

Los ejemplos de "cicloalquenileno" incluyen ciclopropenodiilo y ciclopentenodiilo.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas, tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", el alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen F_3C-, $ClCH_2$-, CF_3CH_2- y CF_3CCl_2-. Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio" y similares se definen análogamente al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CH_2FO-, CHF_2O-, CF_3O-, CCl_3CH_2O-, $HCF_2CH_2CH_2O$- y CF_3CH_2O-. Los ejemplos de "fluoroalcoxi" incluyen CH_2FO-, CHF_2O-, CF_3O- $HCF_2CH_2CH_2O$- y CF_3CH_2O-. Los ejemplos de "fluorometoxi" incluyen CH_2FO-, CHF_2O- y CF_3O-. Los ejemplos de "haloalquiltio" incluyen CCl_3S-, CF_3S-, CCl_3CH_2S- y $ClCH_2CH_2CH_2S$-. Los ejemplos de "haloalquilsulfinilo" incluyen $CF_3S(O)$-, $CCl_3S(O)$-, $CF_3CH_2S(O)$- y $CF_3CF_2S(O)$-. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $CF_3S(O)_2$-, $CCl_3S(O)_2$-, $CF_3CH_2S(O)_2$- y $CF_3CF_2S(O)_2$-.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica por medio de "C_i-C_j", en donde i y j son números del 1 al 12. Por ejemplo, alquilsulfonilo de C_1-C_4 designa desde metilsulfonilo hasta butilsulfonilo incluso; alcoxialquilo de C_2 designa CH_3OCH_2-; alcoxialquilo de C_3 designa, por ejemplo, $CH_3CH(OCH_3)$-, $CH_3OCH_2CH_2$- o $CH_3CH_2OCH_2$-; y alcoxialquilo de C_4 designa los diferentes isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono; los ejemplos incluyen $CH_3CH_2CH_2OCH_2$- y $CH_3CH_2OCH_2CH_2$-.

Tal como se usa en la presente descripción, se aplicarán las siguientes definiciones a menos que se indique de cualquier otra forma. El término "opcionalmente sustituido" se usa intercambiablemente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no)sustituido". A menos que se indique de cualquier otra forma, un grupo sustituido opcionalmente puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independiente de la otra.

El término "no sustituido" en relación con un grupo, tal como un anillo o sistema anular, significa que el grupo no tiene sustituyentes distintos a su unión o uniones al resto de la Fórmula **1**. El término "sustituido opcionalmente" significa que el número de sustituyentes puede ser cero. A menos que se indique de cualquier otra forma, los grupos

opcionalmente sustituidos pueden estar sustituidos con tantos sustituyentes opcionales como se puedan adaptar mediante el reemplazo de un átomo de hidrógeno con un sustituyente no hidrógeno en cualquier átomo de carbono o nitrógeno disponible. La cantidad de sustituyentes opcionales puede estar restringida por una limitación expresa Por ejemplo, la frase "sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R^{9a} en miembros de anillo de carbono" significa que pueden estar presentes 0, 1, 2 o 3 sustituyentes (si lo permite la cantidad de puntos de conexión potenciales). De manera similar, la frase "sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados de R^3 en miembros de anillo de carbono" significa que pueden estar presentes 0, 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes si lo permite la cantidad de puntos de conexión potenciales. Se reconoce que, cuando un intervalo especificado para el número de sustituyentes (por ejemplo, r es un entero de 0 a 4 o de 0 a 3 para los heterociclos de 5 y 6 miembros que contienen nitrógeno en la Exhibición A) excede el número de posiciones disponibles para los sustituyentes en un anillo (por ejemplo, 2 posiciones disponibles para $(R^a)_r$ en U-27 en la Exhibición A), el extremo real más alto del intervalo es el número de posiciones disponibles.

Cuando un compuesto se sustituye con un sustituyente que contiene un subíndice que indica que el número de sustituyentes puede exceder 1, dichos sustituyentes (cuando exceden 1) se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, por ejemplo, $(R^3)_p$ en la Tabla 1, en donde p es 0, 1, 2, 3, 4 o 5. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo, R^1, R^4, R^5, R^6, R^7 o R^{13}, si este sustituyente se toma como hidrógeno, se considera que es como si ese grupo fuera no sustituido. Cuando se muestra que un grupo variable está unido opcionalmente a una posición, por ejemplo, $(R^a)_r$ en H-23 de la Exhibición 1, en donde r podría ser 0, entonces el hidrógeno podría estar en la posición aun si no se enumera en la definición del grupo variable. Cuando se dice que una o más posiciones en un grupo "no están sustituidas" o son "no sustituidas", entonces los átomos de hidrógeno se unen para ocupar cualquier valencia libre.

Las variables "m", "n", "t", "u", "v", "w" y "y" en la Breve descripción de la invención y las partes correspondientes de la especificación de la patente se relacionan con los subíndices incluidos a la derecha de los átomos u otros fragmentos moleculares dentro de los paréntesis y designan el número entero de instancias presentes de los átomos u otros fragmentos moleculares dentro de los paréntesis. "m" se relaciona con "$S(O)_m$", "n" se

relaciona con "$S(O)_n$", "t" se relaciona con "$-S(=O)_tR^{10}$", "u" y "v" se relacionan con "$S(=O)_u(=NR^{14})_v$", "w" se relaciona con "$S(=O)_w$" y "y" se relaciona con "$S(=O)_yR^{25}$. Por ejemplo, "m" es 0, 1 o 2 significa que "$S(O)_m$" puede ser "S", "S(O)" o "$S(O)_2$".

A menos que se indique de cualquier otra forma, un "anillo" como un componente de la Fórmula 1 es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema anular" como un componente de la Fórmula 1 designa dos anillos fundidos (por ejemplo, un anillo de fenilo fundido a un anillo de piridinilo para formar quinolinilo). El término "miembro anular" se refiere a un átomo u otra porción (por ejemplo, O, S(O), $S(O)_2$ o $S(=O)_u(=NR^{14})_v$) que forma la cadena principal de un anillo o sistema anular.

El término "anillo carbocíclico" designa un anillo en donde los átomos que forman la cadena principal se seleccionan sólo del carbono. A menos que se indique de cualquier otra forma, un anillo carbocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. "Carbocíclico saturado" se refiere a un anillo cuya cadena principal consiste de átomos de carbono unidos entre sí por enlaces simples; a menos que se especifique lo contrario, las valencias de los carbonos restantes están ocupadas por átomos de hidrógeno.

Los términos "anillo heterocíclico" o "heterociclo" indican un anillo o sistema anular en el cual por lo menos un átomo que forma la cadena principal del anillo no es carbono,

por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique de cualquier otra forma, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. El término "anillo heterocíclico saturado" se refiere a un anillo heterocíclico que contiene solamente enlaces simples entre los miembros de anillo. Con respecto al grado de saturación, "un anillo heterocíclico parcialmente insaturado" es intermedio entre un anillo heterocíclico saturado y un anillo heterocíclico totalmente insaturado (que podría ser aromático). Por lo tanto, tal como se menciona en la presente descripción y reivindicaciones, el término "anillo heterocíclico parcialmente insaturado" designa un anillo heterocíclico que comprende al menos un miembro anular unido a un miembro anular adyacente a través de un enlace doble y que, conceptualmente, aloja potencialmente una cantidad de enlaces dobles no acumulados entre miembros de anillo adyacentes (es decir, en su homólogo totalmente insaturado) mayor que la cantidad de enlaces dobles presentes (es decir, en su forma parcialmente insaturada). Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado cumple la regla de Hückel, entonces ese anillo se denomina, además, "anillo heteroaromático" o "anillo heterocíclico aromático". Los términos "sistema anular

heteroaromático" y "sistema anular bicíclico heteroaromático" designan un sistema anular en el cual al menos un átomo que forma la cadena principal del anillo no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxigeno o azufre y al menos un anillo es aromático. A menos que se indique de otra manera, los anillos heterocíclicos y los sistemas de anillos pueden estar unidos mediante cualquier carbono o nitrógeno disponible mediante el reemplazo de un hidrógeno en el carbono o nitrógeno.

"Aromático" indica que cada átomo del anillo está básicamente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y que los (4n + 2) electrones π, en donde n es un entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir la regla de Hückel. El término "sistema anular heterocíclico aromático" indica un sistema anular heterocíclico en el cual al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término "sistema anular no aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico que puede estar totalmente saturado y también parcial o totalmente insaturado, siempre que ninguno de los anillos del sistema anular sea aromático. El término "anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros" se refiere a anillos que contienen de cuatro a siete miembros de anillo y que no cumplen la regla de Hückel. Este término (tal como se usa cuando R^6 y R^7 se toman juntos) no se limita

solamente a átomos de carbono y puede incluir miembros de anillo seleccionados de O, $S(O)_n$ y NR^{13}.

En el contexto de la presente invención, cuando una instancia de Q^1, Q^2 o R^1 comprende un anillo de fenilo o un anillo heterocíclico de 6 miembros totalmente insaturado, las posiciones orto, meta y para de cada anillo se consideran con respecto a la conexión del anillo con el resto de la Fórmula **1**.

Como se indicó anteriormente, Q^1, Q^2 y R^1 pueden ser (entre otros) fenilo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes definido anteriormente en la Breve descripción de la invención. Un ejemplo de fenilo sustituido opcionalmente con uno a cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-57 en la Exhibición A, en donde R^8 es tal como se definió en la Breve descripción de la invención para R^8 y q es un entero de 0 a 5.

Como se indicó anteriormente, Q^1 es, *entre otros*, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de los átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S); los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan

independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de cualquier sustituyente definido en la Breve descripción de la invención para Q^1 (por ejemplo, un anillo o sistema anular de Q^1 está sustituido opcionalmente con R^3 en miembros de anillo de carbono y ciano; alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno). De manera similar, Q^2 es, entre otros, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de los átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S); los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de cualquier sustituyente definido en la Breve descripción de la invención para Q^2. Dado

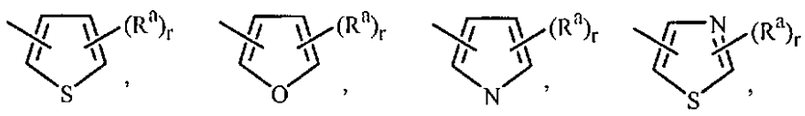
que los sustituyentes en el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 son opcionales, podrían estar presentes de 0 a 5 sustituyentes, limitados solamente por el número de puntos de conexión disponibles. En estas definiciones del anillo heterocíclico y sistema anular heteroaromático, los miembros de anillo seleccionados de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N son opcionales, siempre que al menos un miembro anular no sea carbono (por ejemplo, N, O o S). La definición de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ permite que los hasta 2 miembros del anillo de azufre sean porciones de azufre oxidadas (por ejemplo, S(=O) o $S(=O)_2$) o átomos de azufre no oxidados (es decir, cuando u y v son cero). Los miembros de anillo de los átomos de nitrógeno podrían estar oxidados como *N*-óxidos porque los compuestos relacionados con la Fórmula **1** incluyen, además, derivados de *N*-óxido. Los miembros del anillo de hasta 3 átomos de carbono seleccionados de C(=O) y C(=S) están de forma adicional a los hasta 4 heteroátomos seleccionados de hasta 2 O, hasta 2 S y hasta 4 N átomos.

Además, tal como se indicó anteriormente, R^1 puede ser (entre otros) un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno y que podría estar sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes tal como se definió en la Breve descripción de la invención.

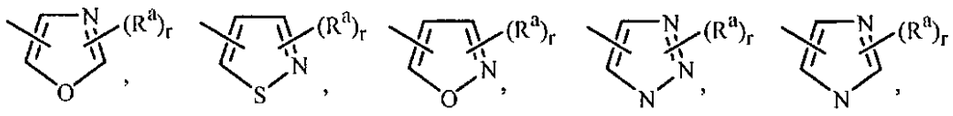
Cuando R^1 es fenilo o un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno, este podría estar unido al resto de la Fórmula 1 mediante cualquier átomo del anillo de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se indique de cualquier otra forma. De manera similar, el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 podría estar unido al resto de la Fórmula 1 a través de cualquiera átomo del anillo de nitrógeno o carbono disponible, a menos que se indique de cualquier otra forma.

Los ejemplos de un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado incluyen los anillos H-1 a H-39 ilustrados en la Exhibición 1, y los ejemplos de un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros incluyen los sistemas anulares B-1 a B-39 ilustrados en la Exhibición 2. En las Exhibiciones 1 y 2, la variable R^a es cualquier sustituyente tal como se definió en la Breve descripción de la invención para Q^1, Q^2 o R^1 (por ejemplo, un anillo o sistema anular de Q^1 está sustituido opcionalmente con R^3 en miembros de anillo de carbono y ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno) y R es un entero de 0 a 5 para Q^1 y Q^2 o de 0 a 3 para R^1, limitados por la cantidad de posiciones disponibles en cada anillo o sistema anular representado.

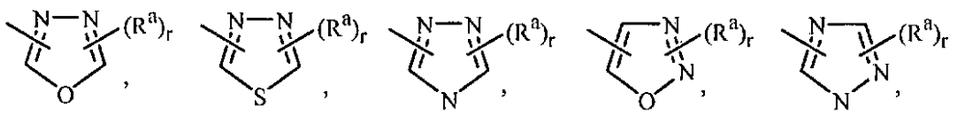
Exhibición 1



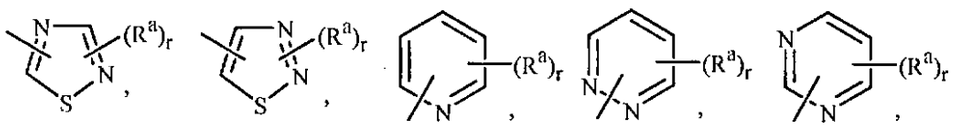
H-1 H-2 H-3 H-4



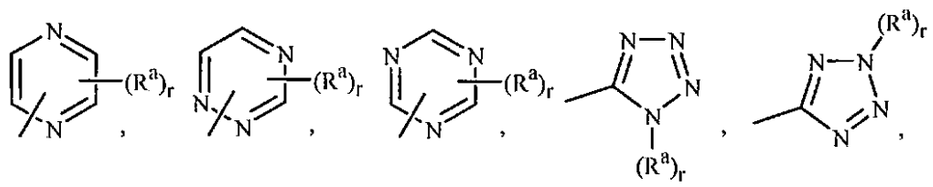
H-5 H-6 H-7 H-8 H-9



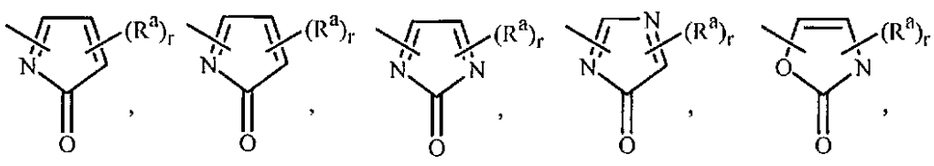
H-10 H-11 H-12 H-13 H-14



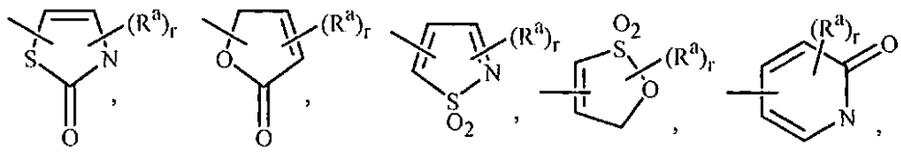
H-15 H-16 H-17 H-18 H-19



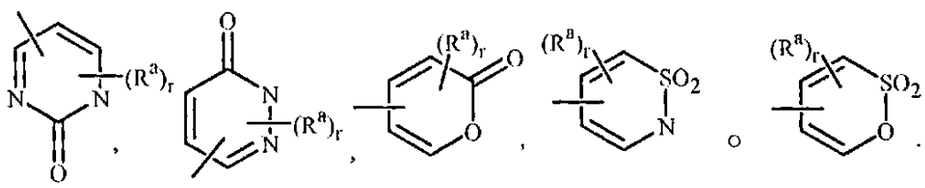
H-20 H-21 H-22 H-23 H-24



H-25 H-26 H-27 H-28 H-29

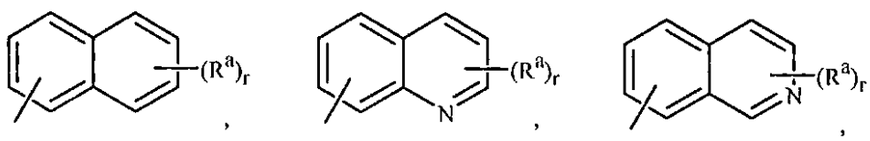


H-30 H-31 H-32 H-33 H-34

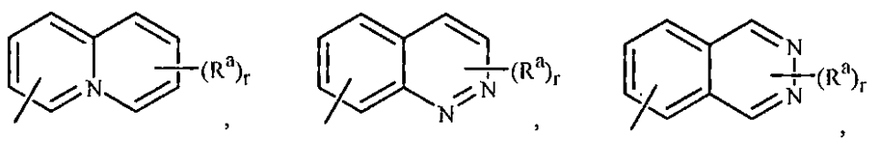


H-35 H-36 H-37 H-38 H-39

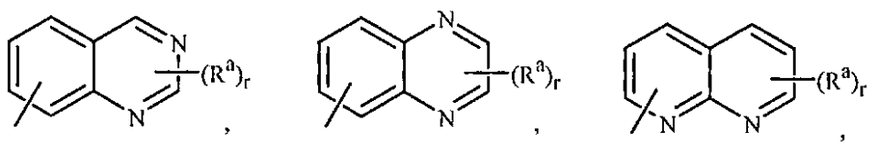
Exhibición 2



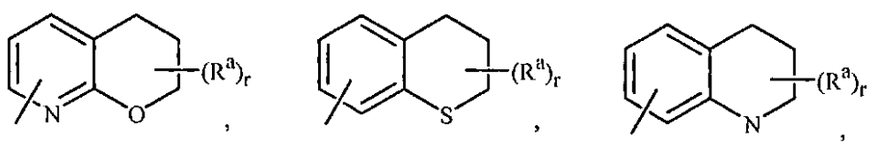
B-1 B-2 B-3



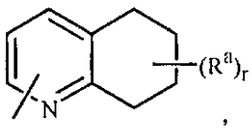
B-4 B-5 B-6



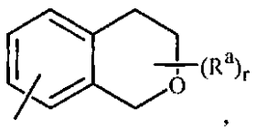
B-7 B-8 B-9



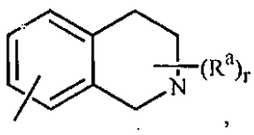
B-10 B-11 B-12



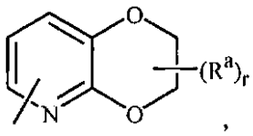
B-13



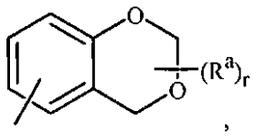
B-14



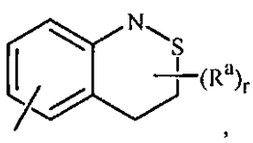
B-15



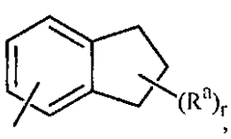
B-16



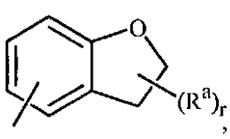
B-17



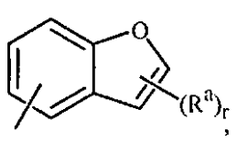
B-18



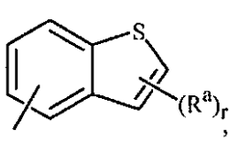
B-19



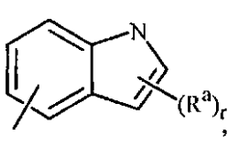
B-20



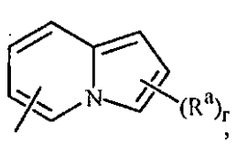
B-21



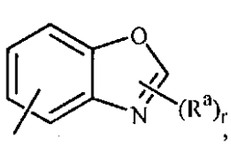
B-22



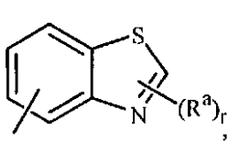
B-23



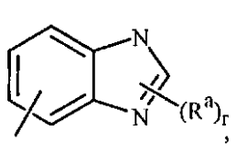
B-24



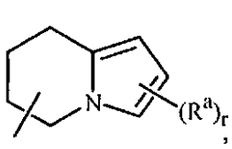
B-25



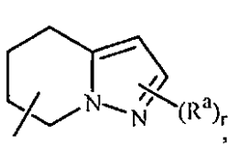
B-26



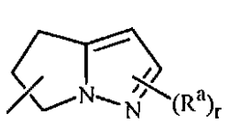
B-27



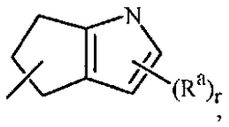
B-28



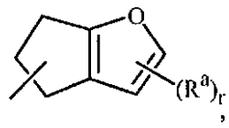
B-29



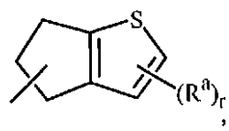
B-30



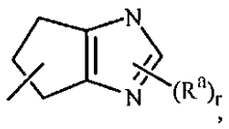
B-31



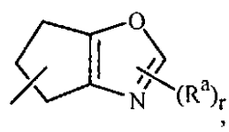
B-32



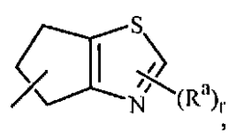
B-33



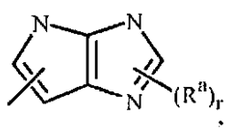
B-34



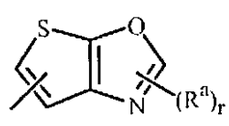
B-35



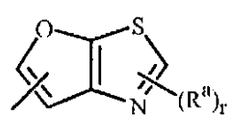
B-36



B-37



B-38

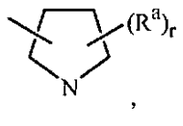


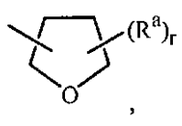
B-39

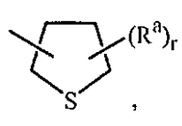
Los ejemplos de un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 a 6 miembros saturado o parcialmente insaturado incluyen los anillos P-1 a P-40 ilustrados en la Exhibición 3. En la Exhibición 3, la variable R^a es cualquier sustituyente tal como se definió en la Breve descripción de la invención para Q^2 (por ejemplo, un anillo de Q^2 está sustituido opcionalmente con R^3 en miembros de anillo de carbono y ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los

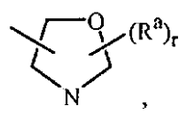
átomos de nitrógeno) y R es un entero de 0 a 5, limitados por la cantidad de posiciones disponibles en cada anillo o sistema anular representado.

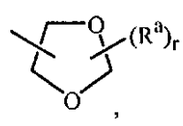
Exhibición 3

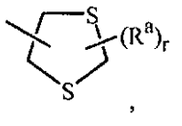

P-1

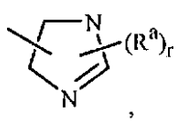

P-2

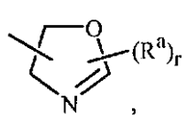

P-3

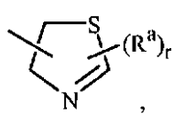

P-4

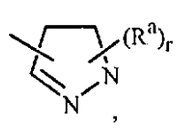

P-5

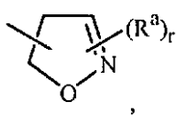

P-6

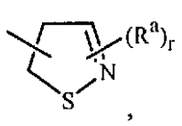

P-7

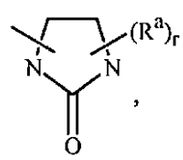

P-8

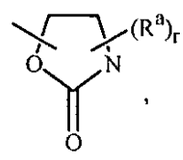

P-9

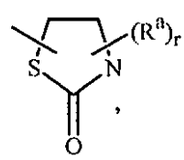

P-10

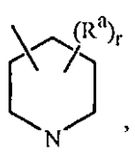

P-11

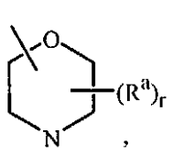

P-12

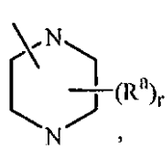

P-13

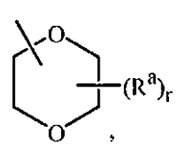

P-14

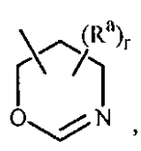

P-15

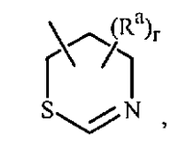

P-16


P-17

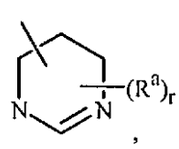

P-18


P-19

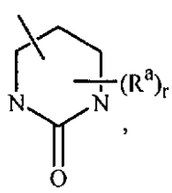

P-20



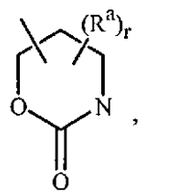
P-21



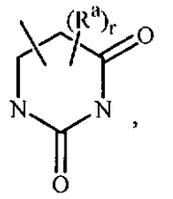
P-22



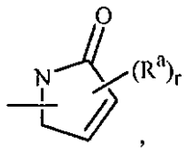
P-23



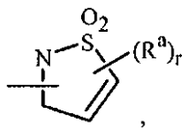
P-24



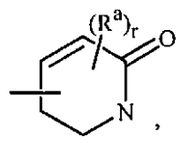
P-25



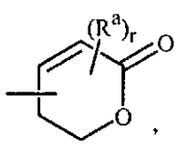
P-26



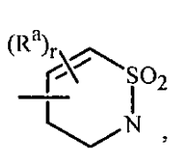
P-27



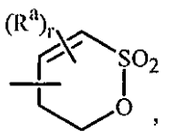
P-28



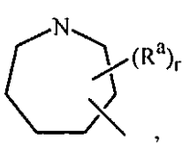
P-29



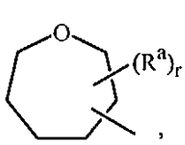
P-30



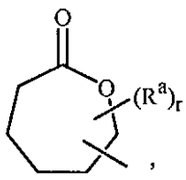
P-31



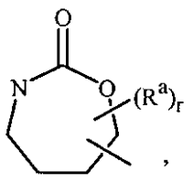
P-32



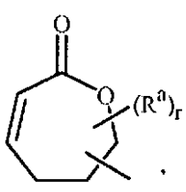
P-33



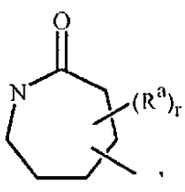
P-34



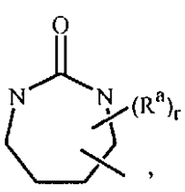
P-35



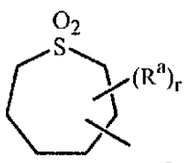
P-36



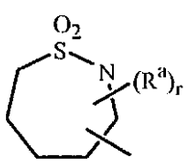
P-37



P-38



P-39

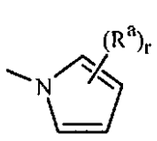


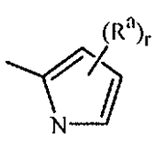
P-40

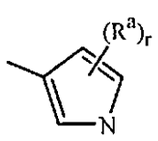
Los ejemplos de un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes de particular interés para Q^1, Q^2 y R^1 incluyen los anillos U-1 a U-56 ilustrados en la Exhibición A, en donde R^a es cualquier sustituyente tal como se definió en la Breve descripción de la invención para Q^1 Q^2 y R^1,

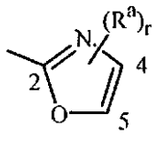
respectivamente (es decir, para Q^1 y Q^2: R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono, y la lista enumerada de sustituyentes posibles en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno; y para R^1, R^{9a} en miembros de anillo de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de nitrógeno) y R es un entero de 0 a 4 para Q^1 y Q^2 y de 0 a 3 para R^1, limitados por la cantidad de posiciones disponibles en cada grupo U. Debe mencionarse que algunos grupos U pueden sustituirse solamente con menos de 4 grupos R^a (por ejemplo, U-4 a U-43 y U-47 a U-56). Dado que U-24, U-25, U-31, U-32, U-33, U-34, U-35, U-36, U-37 y U-38 tienen solamente una posición disponible, para estos grupos U, r está limitado a los enteros 0 o 1, y R es 0 significa que el grupo U no está sustituido y que un hidrógeno está presente en la posición indicada por $(R^a)_r$.

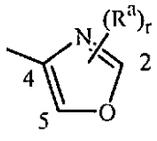
Exhibición A

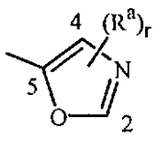

U-1

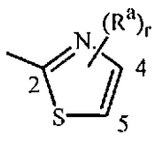

U-2

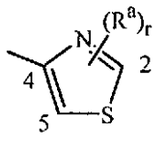

U-3

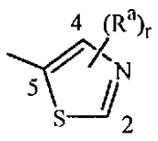

U-4

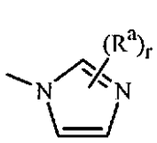

U-5

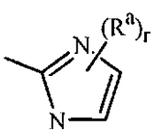

U-6

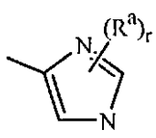

U-7

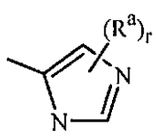

U-8

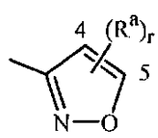

U-9

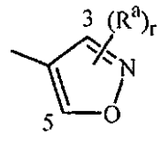

U-10

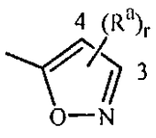

U-11 ,

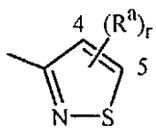

U-12 ,

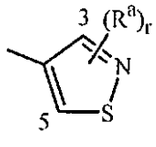

U-13 ,

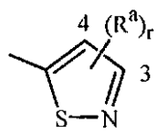

U-14 ,

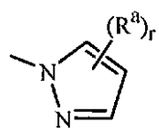

U-15 ,

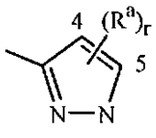

U-16 ,

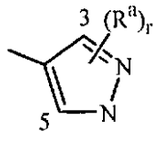

U-17 ,

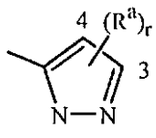

U-18 ,

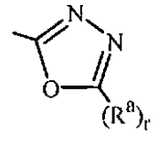

U-19 ,

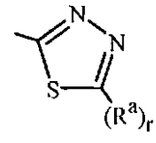

U-20 ,

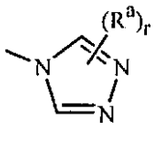

U-21 ,

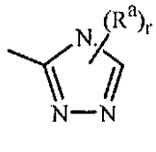

U-22 ,

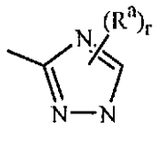

U-23 ,

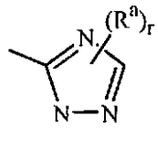

U-24 ,

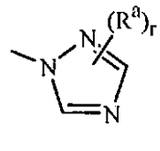

U-25 ,

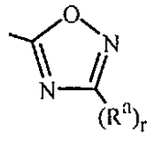

U-26 ,

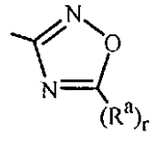

U-27 ,

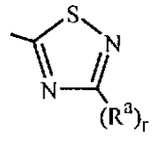

U-28 ,

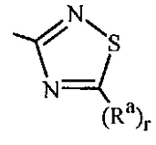

U-29 ,

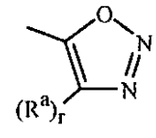

U-30 ,

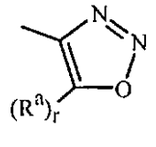

U-31 ,

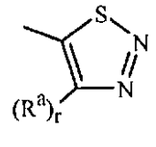

U-32 ,

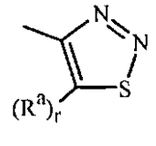

U-33 ,

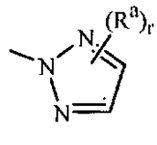

U-34 ,

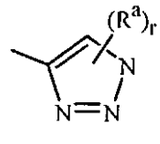

U-35 ,

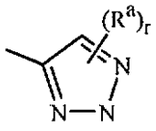

U-36 ,

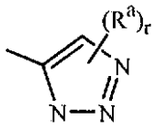

U-37 ,

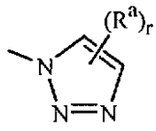

U-38 ,

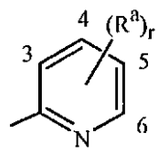

U-39 ,

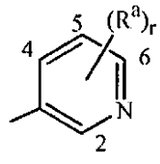

U-40 ,

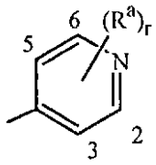

U-41

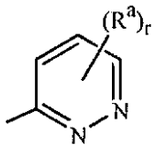

U-42

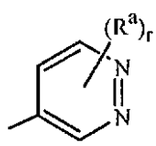

U-43

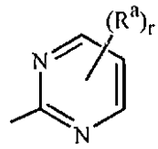

U-44

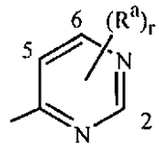

U-45

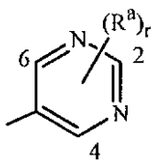

U-46

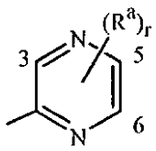

U-47

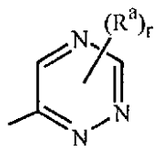

U-48

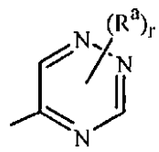

U-49

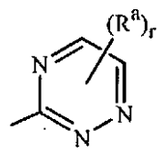

U-50

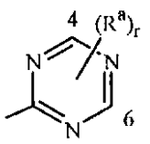

U-51

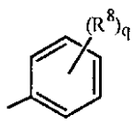

U-52


U-53


U-54


U-55


y


U-56 U-57

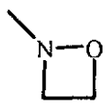
Si bien los grupos R^a se muestran en las estructuras H-1 a H-39, B-1 a B-39, P-1 a P-40 y U-1 a U-57 en las Exhibiciones 1 a 3 y en la Exhibición A, debe mencionarse que no es necesario que estén presentes ya que son sustituyentes opcionales. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para completar su valencia están sustituidos con H o R^a. Debe mencionarse que cuando el punto de unión entre $(R^a)_r$ y el grupo H, B, P o U en las Exhibiciones 1 a 3 y en la Exhibición

A se ilustra como flotante, $(R^a)_r$ puede unirse a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo H, B, P o U. Debe mencionarse que cuando el punto de unión en el grupo H, B o P de las Exhibiciones 1 a 3 se ilustra como flotante, el grupo H, B o P puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo H, B o P mediante el reemplazo de un átomo de hidrógeno. Destacan las representaciones alternativas de las estructuras químicas ilustradas en las Exhibiciones 1 a 3 y en la Exhibición A, en donde el sustituyente de la variable "R^a" se reemplaza por "R^v", en donde el superíndice "v" en "R^v" no se refiere al subíndice de la variable "v" definida en la Breve descripción de la invención pero, en lugar de ello, diferencia "R^v" de otras variables sustituyentes que comienzan con "R".

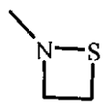
Los ejemplos en los cuales R^6 y R^7 se toman juntos para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros incluyen los anillos G-1 a G-28 tal como se ilustran en la Exhibición 4. Debe mencionarse que cuando R^6 y R^7 se toman juntos para formar un anillo que comprende un anillo seleccionado de G-25 a G-28, G^2 se selecciona de O, $S(O)_n$ o NR^{13}. Debe mencionarse que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por medio de sustitución con H o con los sustituyentes que corresponden a R^{13} tal como se definió en la Breve descripción de la invención.

Exhibición 4

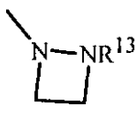

G-1

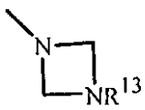

G-2

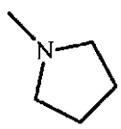

G-3

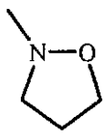

G-4

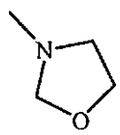

G-5

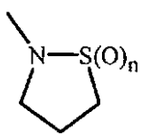

G-6

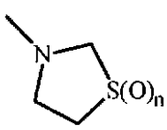

G-7

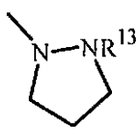

G-8

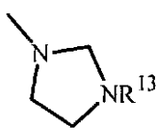

G-9

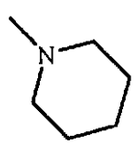

G-10

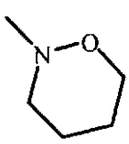

G-11

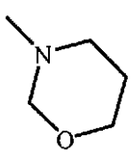

G-12

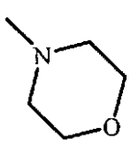

G-13

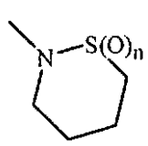

G-14

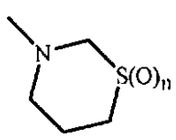

G-15

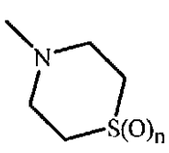

G-16

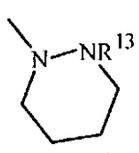

G-17

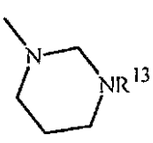

G-18

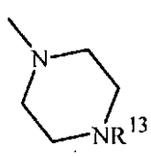

G-19

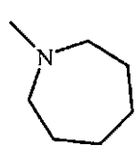

G-20

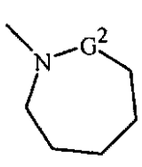

G-21

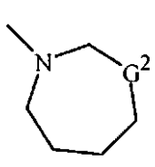

G-22


G-23

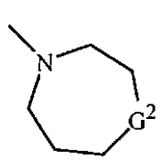

G-24


G-25


G-26


G-27

y


G-28

En la técnica se conoce una amplia variedad de métodos sintéticos para la preparación de anillos y sistemas anulares

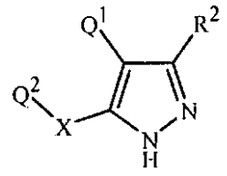
heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; un análisis detallado se encuentra en la serie de ocho volúmenes de *Comprehensive Heterociclic Chemistry*, A. R. Katritzky y C. W. Rees editores en jefe, Pergamon Press, Oxford, 1984 y la serie de doce volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven, editores en jefe, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de la presente invención pueden estar en la forma de uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen isómeros enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros y geométricos. Una persona con experiencia en la técnica comprenderá que un estereoisómero puede ser más activo o puede exhibir efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al (a los) otro(s) estereoisómero(s) o cuando está separado del (de los) otro(s) estereoisómero(s). Además, el experimentado en la técnica sabrá cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente tales estereoisómeros. Los compuestos de la presente invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, como estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

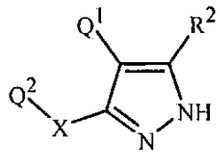
Una persona con experiencia en la técnica comprenderá que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos, ya que el nitrógeno requiere un par aislado disponible para oxidación con el óxido; una persona con experiencia en la técnica reconocerá los heterociclos que

contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Una persona con experiencia en la técnica reconocerá, además, que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos de síntesis para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy conocidos para una persona con experiencia en la técnica e incluyen la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos, tales como ácido peracético y ácido *m*-cloroperbenzoico (AMCPB), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo, tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato de sodio, y dioxiranos, tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos han sido descritos y analizados extensamente en la literatura. Véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, págs. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik *in Comprehensive Heterociclic Chemistry*, vol. 3, págs. 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene *in Advances in Heterociclic Chemistry*, vol. 43, págs. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. *Stanovnik in Advances in Heterociclic Chemistry*, vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk *in Advances in Heterociclic Chemistry*, vol. 22, págs. 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Una persona con experiencia en la técnica reconoce que algunos de los compuestos descritos en la presente invención pueden existir en equilibrio con uno o más de sus homólogos tautoméricos respectivos. A menos que se indique de cualquier otra forma, se considerará que la referencia a un compuesto por medio de la descripción de un tautómero incluye todos los tautómeros. Por ejemplo, la referencia a la forma tautomérica representada por la Fórmula **2**^{1} incluye, además, la forma tautomérica representada por la Fórmula **2**^{2}.



2^1



2^2

Una persona con experiencia en la técnica reconoce que dado que en el medio ambiente y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas que no son sales, las sales comparten la utilidad biológica de las formas que no son sales. Por lo tanto, una amplia variedad de sales de los compuestos de la Fórmula **1** son útiles para el control de enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas (es decir, adecuadas para usos agrícolas). Las sales de los

compuestos de la Fórmula **1** incluyen sales ácidas de adición con ácidos orgánicos e inorgánicos, tales como ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico.

Los compuestos seleccionados de la Fórmula **1**, los isómeros geométricos y estereoisómeros, tautómeros, N-óxidos, y las sales de estos existen, típicamente, en más de una forma y, por lo tanto, la Fórmula **1** incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que la Fórmula **1** representa. Las formas no cristalinas incluyen modalidades sólidas como ceras y gomas, así como también modalidades líquidas como soluciones y fusiones. Las formas cristalinas incluyen modalidades que representan, prácticamente, un tipo de cristal único y modalidades que representan un mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina específica de un compuesto químico que puede cristalizarse en diferentes formas cristalinas, y estas formas poseen diferentes arreglos y/o configuraciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en la composición debido a la presencia o ausencia de agua co-cristalizada u otras moléculas, que pueden estar unidas débil o fuertemente en la red cristalina. Los polimorfos pueden

diferir en la propiedades químicas, físicas y biológicas según la forma del cristal, la densidad, la dureza, el color, la estabilidad química, la temperatura de fusión, la higroscopicidad, la suspensibilidad, la velocidad de disolución y la disponibilidad biológica. Una persona con experiencia en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula **1** puede exhibir efectos beneficiosos (por ejemplo, aptitud para la preparación de formulaciones útiles, desempeño biológico mejorado) comparado con otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la Fórmula **1**. La preparación y el aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula **1** pueden lograrse mediante métodos conocidos para aquellas personas con experiencia en la técnica que incluyen, por ejemplo, la cristalización mediante el uso de temperaturas y solventes seleccionados.

Algunas modalidades de la presente invención, tal como se describen en la Breve descripción de la invención incluyen (en las cuales la Fórmula **1** tal como se usa en las siguientes Modalidades incluye *N*-óxidos y sales, isómeros geométricos, estereoisómeros y atropisómeros de estos):

Modalidad 1. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$ o C(=O).

Modalidad 2. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O, $S(O)_m$, NR^4 o $CR^{15}R^{16}$.

Modalidad 3. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O, NR^4, $CR^{15}R^{16}$ o C(=O).

Modalidad 4. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O, NR^4 o $CR^{15}R^{16}$.

Modalidad 5. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O, $S(O)_m$ o NR^4.

Modalidad 6. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O o $S(O)_m$.

Modalidad 7. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O.

Modalidad 8. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es NR^4.

Modalidad 9. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es O o NR^4.

Modalidad 10. Un compuesto de la Fórmula **1**, en donde X es $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S).

Modalidad 11. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 10, en donde cuando Q^1 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) y un sustituyente R^3 está ubicado en una posición meta (en relación con la conexión del anillo Q^1 al resto de la Fórmula **1**), entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano (-CN).

Modalidad 11A. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 11, en donde cuando Q^1 es un anillo de seis miembros y un sustituyente R^3 está ubicado en una posición meta (en relación con la conexión del anillo Q^1 al resto de la Fórmula **1**), entonces ese sustituyente R^3 es F.

Modalidad 12. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 11a, en donde cuando Q^1 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) sustituido con un solo sustituyente R^3, entonces ese sustituyente R^3 está unido en una posición orto (en relación con la conexión del anillo Q^1 al resto de la Fórmula **1**).

Modalidad 13. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 12, en donde Q^1 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo, pirimidinilo, naftalenilo, quinolinilo, isoquinolinilo o quinoxalinilo; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 14. Un compuesto de la Modalidad 13, en donde Q^1 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo; cada uno está sustituido

opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 15. Un compuesto de la Modalidad 14, en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 16. Un compuesto de la Modalidad 15, en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 17. Un compuesto de la Modalidad 16, en donde los sustituyentes están ubicados en las posiciones orto y/o para (en relación con la conexión del anillo Q^1 al resto de la Fórmula **1**) del fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^1.

Modalidad 18. Un compuesto de la Modalidad 16 o 17, en donde Q^1 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 19. Un compuesto de la Modalidad 18, en donde Q^1 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 20. Un compuesto de la Modalidad 19, en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o

fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 21. Un compuesto de la Modalidad 20, en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 22. Un compuesto de la Modalidad 21, en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 23. Un compuesto de la Modalidad 21, en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 24. Un compuesto de la Modalidad 21, en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 25. Un compuesto de la Modalidad 18, en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 26. Un compuesto de la Modalidad 25, en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 27. Un compuesto de la Modalidad 26, en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1 sustituyente seleccionado independientemente de R^3.

Modalidad 28. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 27, en donde cuando Q^2 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) y un sustituyente R^3 está ubicado en una posición meta (en relación con la conexión del anillo Q^2 al resto de la Fórmula **1**), entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano (-CN).

Modalidad 29. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 28, en donde cuando Q^2 es un anillo de seis miembros y un sustituyente R^3 está ubicado en una posición meta (en relación con la conexión del anillo Q^2 al resto de la Fórmula **1**), entonces ese sustituyente R^3 es F.

Modalidad 30. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 29, en donde Q^2 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) sustituido con un solo sustituyente R^3, entonces ese sustituyente R^3 está unido en una posición orto (en relación con la conexión del anillo Q^2 al resto de la Fórmula **1**).

Modalidad 31. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 30, en donde Q^2 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo, pirimidinilo, naftalenilo, quinolinilo, isoquinolinilo o quinoxalinilo; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 32. Un compuesto de la Modalidad 31, en donde Q^2 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 33. Un compuesto de la Modalidad 32, en donde Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 34. Un compuesto de cualquiera de las Modalidades 31 a 33, en donde Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 35. Un compuesto de la Modalidad 34, en donde los sustituyentes están ubicados en las posiciones orto y/o para (en relación con la conexión del anillo Q^2 al

resto de la Fórmula **1**) del fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^2.

Modalidad 36. Un compuesto de cualquiera de las Modalidades 34 o 35, en donde Q^2 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 37. Un compuesto de la Modalidad 36, en donde Q^2 es fenilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 38. Un compuesto de la Modalidad 37, en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 39. Un compuesto de la Modalidad 38, en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 40. Un compuesto de la Modalidad 38, en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 41. Un compuesto de la Modalidad 38, en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 42. Un compuesto de la Modalidad 36, en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 43. Un compuesto de la Modalidad 42, en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 44. Un compuesto de la Modalidad 43, en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^3.

Modalidad 45. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 44, en donde al menos Q^1 o Q^2 es fenilo sustituido opcionalmente con R^3 (por ejemplo, sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3).

Modalidad 46. Un compuesto de la Modalidad 45, en donde al menos Q^1 o Q^2 es fenilo sustituido con 2, 3 o 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 47. Un compuesto de la Modalidad 46, en donde al menos Q^1 o Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 48. Un compuesto de la Modalidad 47, en donde cada Q^1 y Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3.

Modalidad 49. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 48, en donde R^1 es H,

halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5; o

R^1 es un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno.

Modalidad 50. Un compuesto de la Modalidad 49, en donde R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, ciano, alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6; o

R^1 es piridinilo, pirimidinilo, pirazolilo u oxazolilo; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno.

Modalidad 51. Un compuesto de la Modalidad 50, en donde R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5.

Modalidad 52. Un compuesto de la Modalidad 51, en donde R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5.

Modalidad 53. Un compuesto de la Modalidad 52, en donde R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5.

Modalidad 54. Un compuesto de la Modalidad 53, en donde R^1 es H, halógeno o alquilo de C_1-C_6.

Modalidad 55. Un compuesto de la Modalidad 54, en donde R^1 es H o CH_3.

Modalidad 56. Un compuesto de la Modalidad 55, en donde R^1 es H.

Modalidad 57. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 56, en donde R^1 es distinto de un fenilo sustituido opcionalmente o de un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente.

Modalidad 58. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 50, en donde R^1 es distinto de H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, cicloalquilo de C_3-C_7, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5.

Modalidad 59. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 58, en donde R^{1a} es H.

Modalidad 60. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 59, en donde R^2 es CH_3,

CH_2CH_3, halógeno, ciano, cianometilo, monohalometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo.

Modalidad 61. Un compuesto de la Modalidad 60, en donde R^2 es CH_3, CH_2CH_3, Cl, Br o I.

Modalidad 62. Un compuesto de la Modalidad 61, en donde R^2 es CH_3, CH_2CH_3, Cl o Br.

Modalidad 63. Un compuesto de la Modalidad 62, en donde R^2 es CH_3, Cl o Br.

Modalidad 64. Un compuesto de la Modalidad 63, en donde R^2 es CH_3 o Cl.

Modalidad 65. Un compuesto de la Modalidad 64, en donde R^2 es CH_3.

Modalidad 66. Un compuesto de la Modalidad 62, en donde R^2 es Cl o Br.

Modalidad 67. Un compuesto de la Modalidad 66, en donde R^2 es Cl.

Modalidad 68. Un compuesto de la Fórmula **1** o cualquiera de las Modalidades 1 a 67, en donde R^5 es H o alquilo de C_1-C_6.

Modalidad 69. Un compuesto de la Modalidad 68, en donde R^5 es H, CH_3 o CH_2CH_3.

Modalidad 70. Un compuesto de la Modalidad 68, en donde R^5 es alquilo de C_1-C_6.

Modalidad 71. Un compuesto de la Modalidad 69 o 70, en donde R^5 es CH_3 o CH_2CH_3.

Modalidad 72. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 71, en donde cuando R^6 está separado (es decir, no se toma junto con R^7 para formar un anillo), entonces R^6 es H o alquilo de C_1-C_6.

Modalidad 73. Un compuesto de la Modalidad 72, en donde R^6 es H.

Modalidad 74. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 73, en donde cuando R^7 está separado (es decir, no se toma junto con R^6 para formar un anillo), entonces R^7 es H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alquilcicloalquilo de C_4-C_8.

Modalidad 75. Un compuesto de la Modalidad 74, en donde R^7 es H o alquilo de C_1-C_7.

Modalidad 76. Un compuesto de la Modalidad 75, en donde R^7 es H.

Modalidad 77. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 76, en donde cuando R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático, el anillo contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno conector, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13}.

Modalidad 78. Un compuesto de la Modalidad 77, en donde cuando R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático, el anillo tiene seis miembros y contiene un miembro anular seleccionado de O y NR^{13}, además, del átomo de nitrógeno conector, y miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono.

Modalidad 79. Un compuesto de la Modalidad 77, en donde R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo de piperidina.

Modalidad 80. Un compuesto de la Modalidad 78, en donde R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo de piperazina o morfolina.

Modalidad 81. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 80, en donde cada R^8 se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro.

Modalidad 82. Un compuesto de la Modalidad 81, en donde cada R^8 se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro.

Modalidad 83. Un compuesto de la Modalidad 82, en donde cada R^8 es independientemente Cl o F.

Modalidad 84. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 83, en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro.

Modalidad 85. Un compuesto de la Modalidad 84, en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro.

Modalidad 86. Un compuesto de la Modalidad 85, en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de Cl, F, CH_3, $-OCH_3$ y ciano.

Modalidad 87. Un compuesto de la Modalidad 86, en donde cada R^{9a} es independientemente Cl o F.

Modalidad 88. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 87, en donde cada R^{9b} es independientemente alquilo de C_1-C_2.

Modalidad 89. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 88, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, cicloalquilo de C_3-C_4, $C(=S)NH_2$ y -U-V-T.

Modalidad 90. Un compuesto de la Modalidad 89, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3 y -U-V-T.

Modalidad 91. Un compuesto de la Modalidad 90, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, nitro, CH_3, CF_3, $-OCH_3$, $-OCHF_2$ y -U-V-T.

Modalidad 92. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 91, en donde al menos un sustituyente R^3 en el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 es -U-V-T.

Modalidad 93. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 91, en donde cada R^3 es distinto de -U-V-T.

Modalidad 94. Un compuesto de la Modalidad 89, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3 y cicloalquilo de C_3-C_4.

Modalidad 95. Un compuesto de la Modalidad 94, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno,

ciano, nitro, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3 y haloalcoxi de C_1-C_3.

Modalidad 96. Un compuesto de la Modalidad 95, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo de C_1-C_3, haloalquilo de C_1-C_3, alcoxi de C_1-C_3 y haloalcoxi de C_1-C_3.

Modalidad 97. Un compuesto de la Modalidad 96, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2 y haloalcoxi de C_1-C_2.

Modalidad 98. Un compuesto de la Modalidad 97, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi de C_1-C_2 y fluorometoxi.

Modalidad 99. Un compuesto de la Modalidad 98, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, ciano, metilo, alcoxi de C_1-C_2 y fluorometoxi.

Modalidad 100. Un compuesto de la Modalidad 95, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, nitro, CH_3, CF_3, $-OCH_3$ y $-OCHF_2$.

Modalidad 101. Un compuesto de cualquiera de las Modalidades 89 a 98 o 100, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi.

Modalidad 102. Un compuesto de la Modalidad 101, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br y ciano.

Modalidad 103. Un compuesto de la Modalidad 101, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, ciano y $-OCH_3$.

Modalidad 104. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 92, en donde cada U es independientemente O o NR^{22}.

Modalidad 105. Un compuesto de la Modalidad 104, en donde cada U es independientemente O o NH.

Modalidad 106. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 92 y 104 a 105, en donde cada V es alquileno de C_2-C_4.

Modalidad 107. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 92 y 104 a 106, en donde cada T es independientemente $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24}.

Modalidad 108. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 92 y 104 a 107, en donde cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6.

Modalidad 109. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 92 y 104 a 108, en donde cada R^{24} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6.

Modalidad 110. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 109, en donde cuando un sustituyente R^3 unido a fenilo, piridinilo,

pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^1o Q^2 es distinto de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi de C_1-C_2 y fluorometoxi, entonces ese sustituyente R^3 está unido en la posición para (del anillo de fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo).

Modalidad 111. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 110, en donde R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12}.

Modalidad 112. Un compuesto de la Modalidad 111, en donde R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 sustituido con un R^{12}.

Modalidad 113. Un compuesto de la Modalidad 112, en donde R^4 es H, formilo, $-CH_2OCH_3$, ciclopropilo, $-SCH_3$, $-SCF_3$ o $-CH_2CN$.

Modalidad 114. Un compuesto de la Modalidad 113, en donde R^4 es H, formilo, ciclopropilo o $-CH_2CN$.

Modalidad 115. Un compuesto de la Modalidad 113, en donde R^4 es H, formilo, $-CH_2OCH_3$, ciclopropilo, $-SCH_3$ o $-SCF_3$.

Modalidad 116. Un compuesto de la Modalidad 115, en donde R^4 es H, formilo o ciclopropilo.

Modalidad 117. Un compuesto de la Modalidad 114 o 116, en donde R^4 es H.

Modalidad 118. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 117, en donde R^{13} es H o CH_3.

Modalidad 119. Un compuesto de la Modalidad 118, en donde R^{13} es CH_3.

Modalidad 120. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 119, en donde cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4 o ciano.

Modalidad 121. Un compuesto de la Modalidad 120, en donde cada R^{12} es independientemente ciclopropilo, $-OCH_3$ o ciano.

Modalidad 122. Un compuesto de la Modalidad 120, en donde cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7 o alcoxi de C_1-C_4.

Modalidad 123. Un compuesto de la Modalidad 122, en donde cada R^{12} es independientemente ciclopropilo u $-OCH_3$.

Modalidad 124. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 123, en donde R^{10} es CH_3, CH_2CH_3, CF_3 o CF_2CF_3.

Modalidad 125. Un compuesto de la Modalidad 124, en donde R^{10} es CH_3.

Modalidad 126. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 125, en donde R^{11} es alquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6 o alquiltio de C_1-C_6.

Modalidad 127. Un compuesto de la Modalidad 126, en donde R^{11} es CH_3, CH_2CH_3, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-SCH_3$ o $-SCH_2CH_3$.

Modalidad 128. Un compuesto de la Modalidad 127, en donde R^{11} es CH_3, $-OCH_3$ o $-SCH_3$.

Modalidad 129. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 128, en donde R^{15} es H o CH_3.

Modalidad 130. Un compuesto de la Modalidad 129, en donde R^{15} es H.

Modalidad 131. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 130, en donde R^{16} es CH_3 u OR^{18}.

Modalidad 132. Un compuesto de la Modalidad 131, en donde R^{16} es OR^{18}.

Modalidad 133. Un compuesto de la Fórmula **1** o cualquiera de las Modalidades 1 a 132, en donde R^{18} es H.

Modalidad 134. Una compuesto de la Fórmula **1** o cualquiera de las Modalidades 1 a 133, en donde W es O.

Modalidad 135. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 134, en donde M^+ es un catión seleccionado de iones sodio, potasio y litio.

Modalidad 136. Un compuesto de la Modalidad 135, en donde M^+ es un catión seleccionado de iones sodio y potasio.

Modalidad 137. Un compuesto de la Modalidad 136, en donde M^+ es un ion sodio.

Modalidad 138. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 137, en donde m es 0.

Modalidad 139. Un compuesto de la Fórmula **1** o de cualquiera de las Modalidades 1 a 138, en donde n es 0.

Las modalidades de la presente invención, que incluyen las Modalidades 1-139 descritas anteriormente así como cualquier otra modalidad descrita en la presente invención, pueden combinarse de cualquier manera, y las descripciones de variables en las modalidades corresponden no sólo a los compuestos de la Fórmula 1 sino, además, a los compuestos de partida y compuestos intermedios (por ejemplo compuestos de la Fórmula **2**) útiles para preparar los compuestos de la Fórmula **1**. Adicionalmente, las modalidades de la presente invención, que incluyen las Modalidades 1-139 descritas anteriormente además de cualquier otra modalidad descrita en la presente invención, y cualquier combinación de estas, corresponden a las composiciones y métodos de la presente invención.

Las combinaciones de las Modalidades 1-139 se ilustran mediante lo siguiente:

Modalidad A. Un compuesto de la Fórmula 1, en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; siempre que cuando un sustituyente R^3 esté ubicado en

una posición meta, entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3, siempre que cuando un sustituyente R^3 esté ubicado en una posición meta, entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

X es O, NR^4, C(=O) o $CR^{15}R^{16}$;

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5;

R^{1a} es H;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, cicloalquilo de C_3-C_4, $C(=S)NH_2$ y -U-V-T;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

R^5 es alquilo de C_1-C_6;

R^6 es H o alquilo de C_1-C_6;

R^7 es H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno conector, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13};

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4 o ciano;

R^{13} es H o CH_3;

R^{15} es H o CH_3; y

R^{16} es OR^{18}.

Modalidad B. Un compuesto de la Modalidad A, en donde

Q^1 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

R^1 es H, halógeno o alquilo de C_1-C_6;

R^2 es CH_3, Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3 y -U-V-T;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 sustituido con un R^{12};

cada R^{12} es independientemente ciclopropilo, $-OCH_3$ o ciano;

R^{15} es H;

cada U es independientemente O o NH;

cada V es alquileno de C_2-C_4;

cada T es independientemente $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24};

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; y

cada R^{24} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6.

Modalidad C. Un compuesto de la Modalidad B, en donde al menos Q^1 o Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

R^1 es H o CH_3;

R^2 es CH^1;

R^4 es H;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo de C_1-C_3, haloalquilo de C_1-C_3, alcoxi de C_1-C_3 y haloalcoxi de C_1-C_3; y

R^{18} es H.

Modalidad D. Un compuesto de la Modalidad C, en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O, NR^4 o $CR^{15}R^{16}$;

R^1 es H;

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2 y haloalcoxi de C_1-C_2; y

R^4 es H.

Modalidad E. Un compuesto de la Modalidad D, en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi de C_1-C_2 y fluorometoxi.

Modalidad F. Un compuesto de la Modalidad E, en donde X es O o NH; y

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi.

Las modalidades específicas incluyen compuestos de Fórmula **1** seleccionados del grupo que consiste de:

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 18),

N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 22),

4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 23),

4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 24),

N-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-(3,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 36),

4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 41),

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 45),

4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (Compuesto 361),

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 172),

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (Compuesto 118),

3-cloro-4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (Compuesto 358),

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-α-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 351),

N,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 175),

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 193),

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 297),

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 343),

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 349),

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 357),

3-cloro-4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (Compuesto 139),

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]amino]-3,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 91),

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-2,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 148),

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 87),

α,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 352),

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 286),

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 287),

N-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 368),

3-cloro-4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]benzonitrilo (Compuesto 332),

3-cloro-4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]benzonitrilo (Compuesto 336),

N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 346),

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 367),

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 369),

4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (Compuesto 284),

N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 265),

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 266),

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 364),

4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 232),

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 292),

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 360),

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 365),

3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (Compuesto 372),

3-cloro-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (Compuesto 373),

N-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 374),

N-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 375),

N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 376),

N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 377),

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 378),

N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 379), *N*-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 380), α-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 381), 4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo (Compuesto 382), 4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo (Compuesto 383), α-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 384), α-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 385), y α-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 386).

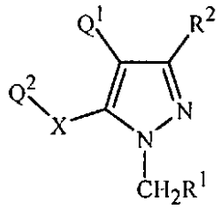
La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de la Fórmula **1** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos, y sales de estos), y al menos otro fungicida. Destacan como modalidades de las composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las modalidades de compuestos descritas anteriormente.

La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz como fungicida

de un compuesto de la Fórmula **1** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos, y sales de estos), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Destacan como modalidades de las composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las modalidades de compuestos descritas anteriormente.

La presente invención proporciona un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas; el método comprende aplicar a la planta, a una parte de esta o a una semilla de la planta una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la Fórmula **1** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos, y sales de estos). Destacan como modalidades de estos métodos los métodos que comprenden aplicar una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto que corresponde a cualquiera de las modalidades de compuestos descritas anteriormente. Destacan, particularmente, las modalidades en donde los compuestos se aplican como composiciones de la presente invención.

Destacan los compuestos de la Fórmula **1** que son compuestos de la Fórmula **1P** (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos, y sales de estos, además de las composiciones agrícolas que los contienen y su uso como fungicidas:



1P

en donde

Q^1 y Q^2 son independientemente fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O, $S(O)_m$ o NR^4;

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, cicloalquilo de C_3-C_7, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5; o

R^1 es fenilo sustituido opcionalmente con hasta 3 R^8; o un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, ciclopropilo o halógeno;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo

de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, cicloalquilo de C_3-C_4, cicloalcoxi de C_3-C_7, alquilcicloalquilo de C_4-C_6, cicloalquilalquilo de C_4-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_7, alquenilo de C_2-C_4 y alquinilo de C_2-C_4;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3^-M^+$, $-SR^{10}$ o $-(C=W)R^{11}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

R^5 es H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

R^6 y R^7 se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, cicloalquilo de C_3-C_7, cicloalquilalquilo de C_4-C_8 y alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno del anillo conector, seleccionados de átomos de carbono y, opcionalmente, hasta un miembro de anillo seleccionado de O, $S(O)_n$ y NR^{13};

cada R^8, R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi

de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ y $S(O)_2CH_3$;

R^{10} es alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

R^{11} es alquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_7, alquilaminoalquilo de C_2-C_7, dialquilaminoalquilo de C_2-C_8, alquiltio de C_1-C_6 o alquiltioalquilo de C_2-C_7;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4, haloalcoxi de C_1-C_4, alquiltio de C_1-C_4, alquilsulfinilo de C_1-C_4 o alquilsulfonilo de C_1-C_4;

R^{13} es H, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_2-C_3;

W es O o S;

M^+ es un catión;

m es 0, 1 o 2; y

n es 0, 1 o 2.

En consecuencia, destaca un compuesto seleccionado de la Fórmula **1P** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos, y sales de estos, tal como se definieron anteriormente. Además, destacan las modalidades homólogas que son modalidades homólogas a las Modalidades 1 a 139 y Modalidades A a F, en donde en esas modalidades homólogas la "Fórmula 1" se reemplaza con la "Fórmula **1P**" y el alcance de esas modalidades homólogas no excede el alcance definido anteriormente para la Fórmula **1P**. Los ejemplos de combinaciones de las Modalidades 1 a 139, tal como se aplican a la Fórmula **1P**, son las Modalidades AP, BP, CP, DP y EP:

Modalidad AP. Un compuesto de la Fórmula **1P**, en donde

Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3

X es O o NR^4;

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5; o

R^1 es un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3 y cicloalquilo de C_3-C_4;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o -SR^{10}; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12};

R^5 es H o alquilo de C_1-C_6;

R^6 es H o alquilo de C_1-C_6;

R^7 es H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno conector, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13};

cada R^8 se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro;

cada R^{9a}se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano y nitro;

cada R^{9b} es alquilo de C_1-C_2;

R^{10} es CH_3, CH_2CH_3, CF_3 o CF_2CF_3;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7 o alcoxi de C_1-C_4; y

R^{13} es H o CH_3.

Modalidad BP. Un compuesto de la Modalidad AP, en donde

Q^1 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es NR^4;

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, ciano, alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6;

R^2 es CH^3;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3 y haloalcoxi de C_1-C_3;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 sustituido con un R^{12};

R^{10} es CH_3; y

cada R^{12} es independientemente ciclopropilo u $-OCH_3$.

Modalidad CP. Un compuesto de la Modalidad AP, en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O;

R^2 es CH_3;

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, nitro, CH_3, CF_3, $-OCH_3$ y $-OCHF_2$; y

R^4 es H, formilo o ciclopropilo.

Modalidad DP. Un compuesto de la Modalidad CP, en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, ciano y $-OCH_3$; y

R^4 es H.

Modalidad EP. Un compuesto de la Modalidad BP, en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, CN y $-OCH_3$; y

R^4 es H.

Destaca, además, una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la Fórmula **1P** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos, y sales de estos) o cualquiera de las modalidades homólogas que son homólogas a las Modalidades

1 a 139 y Modalidades A a F (por ejemplo, Modalidades AP, BP, CP, DP o EP), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Destaca, además, un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas; el método comprende aplicar a la planta, a una parte de esta o a una semilla de la planta una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la Fórmula **1P** (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos, y sales de estos) o cualquiera de las modalidades homólogas. Destacan, particularmente, las modalidades, en donde los compuestos de la Fórmula **1P** se aplican como composiciones de la presente invención.

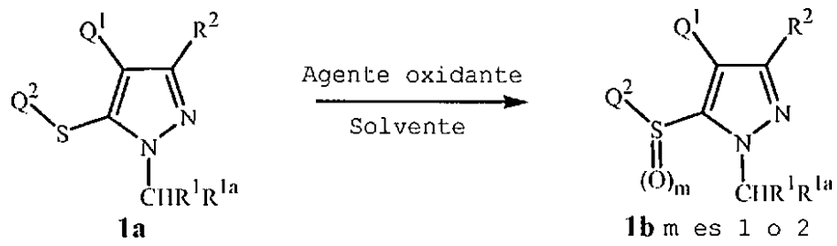
Uno o más de los siguientes métodos y variantes según se describe en los Esquemas 1-24 pueden usarse para preparar los compuestos de la Fórmula **1** (que incluye la Fórmula **1P**). Las definiciones de Q^1, Q^2, R^1, R^2 y m en los compuestos de las Fórmulas **1-33** siguientes son como los definidos anteriormente en la Breve descripción de la invención, a menos que se especifique de cualquier otra forma. Las Fórmulas **1a**, **1b**, **1c**, **1d**, **1e**, **1f**, **1g** y **1h** son diversos subconjuntos de la Fórmula **1**; las Fórmulas **4a**, **4b** y **4c** son diversos subconjuntos de la Fórmula **4**; las Fórmulas **6a** y **6b** son diversos subconjuntos de la Fórmula **6**; la Fórmula **11a** es un subconjunto de la Fórmula **11**; la Fórmula **13a** es un subconjunto o análogo de la Fórmula

13; y la Fórmula **17a** es un subconjunto de la Fórmula **17**. Los sustituyentes para cada fórmula del subconjunto son tal como se definieron para su fórmula principal, a menos que se especifique de cualquier otra forma.

Como se muestra en el Esquema 1, los sulfóxidos y sulfonas de la Fórmula **1b** (es decir, la Fórmula **1**, en donde X es $S(O)_m$ y m es 1 o 2) se pueden preparar mediante la oxidación del átomo de azufre enlazante en los sulfuros de la Fórmula **1a** (es decir, la Fórmula **1**, en donde X es $S(O)_m$ y m es 0). En este método, un compuesto de la Fórmula **1b**, en donde m es 1 (es decir, sulfóxidos) o m es 2 (es decir, sulfonas) se prepara mediante la oxidación de un sulfuro correspondiente de la Fórmula 1a con un agente oxidante adecuado. En un procedimiento típico se añade un agente oxidante en una cantidad de 1 a 4 equivalentes, dependiendo del estado de oxidación del producto deseado, a una solución del compuesto de la Fórmula **1a** en un solvente. Los agentes oxidantes útiles incluyen Oxone® (peroximonosulfato potásico), peróxido de hidrógeno, peryodato sódico, ácido peracético y ácido 3-cloroperbenzoico. El solvente se selecciona en función del agente oxidante usado. El etanol acuoso o acetona acuosa se usa, preferentemente, con peroximonosulfato potásico, y el diclorometano se prefiere, generalmente, con el ácido 3-cloroperbenzoico. Las temperaturas de reacción útiles varían, típicamente, de -78 a 90 °C. Los procedimientos particulares útiles para oxidar sulfuros a

sulfóxidos y sulfonas se describen en Brand et al., J. *Agric. Food Chem.* **1984**, 32, 221-226 y las referencias citadas en ella.

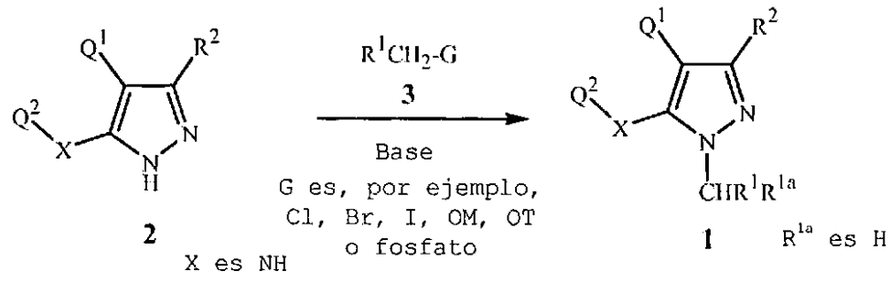
Esquema 1



1a **1b** m es 1 o 2

Como se muestra en el Esquema 2, los compuestos de la Fórmula **1** en los cuales X es NH y R^{1a} es H se pueden preparar mediante la reacción de compuestos de 1*H*-pirazol de la Fórmula 2 con varios agentes alquilantes (por ejemplo, Fórmula **3**), tales como yodoalcanos, alquilsulfonatos (por ejemplo, mesilato (OM) o tosilato (OT)) o fosfatos de trialquilo, preferentemente, en presencia de una base orgánica o inorgánica, tal como 1,8-diazabiciclo[5.4.0]undec-7-eno, carbonato potásico o hidróxido de potasio, y en un solvente, tal como *N*,*N*-dimetilformamida, tetrahidrofurano, tolueno o agua.

Esquema 2

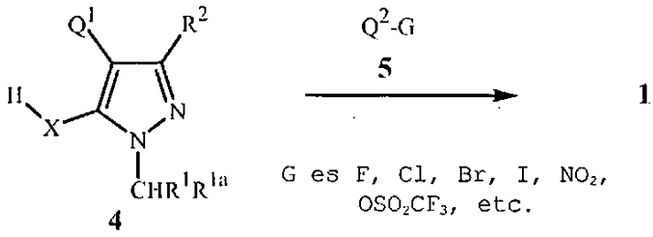


Los compuestos de la Fórmula **1**, en donde CHR^1R^{1a} forma un anillo de ciclopropilo sustituido opcionalmente pueden prepararse, de igual modo, por medio de la reacción de un pirazol de la Fórmula **2** con un reactivo organometálico, tal como tricicloprópilbismuto, en presencia de un catalizador, tal como acetato de cobre, en condiciones conocidas en la técnica. Véase, por ejemplo, *J. Am. Chem. Soc.* **2007**, *129*(1), 44-45. Destacan como materiales de partida en el método del Esquema 2 los compuestos de la Fórmula 2 descritos específicamente en las Tablas 588 a 671 siguientes.

Tal como se muestra en el Esquema **3**, los compuestos de la Fórmula **1** pueden prepararse por medio de la reacción de compuestos de la Fórmula **4** (es decir, 5-aminopirazoles, en donde X es NR^4, 5-hidroxipirazoles (5-pirazolonas), en donde X es O o 5-mercaptopirazoles, en donde X es S) con compuestos aromáticos de la Fórmula 5 que contienen un grupo saliente G (es decir, halógeno o (halo)alquilsulfonato), opcionalmente, en presencia de un catalizador de metales y, generalmente, en

presencia de una base y un solvente aprótico polar, tal como *N,N*-dimetilformamida o sulfóxido de dimetilo. Por ejemplo, los compuestos de la Fórmula **5**, en donde Q^2 es un anillo heteroaromático con deficiencia de electrones o un anillo de benceno con sustituyentes tomadores de electrones, se hacen reaccionar por desplazamiento directo del grupo saliente G del anillo para proporcionar compuestos de la Fórmula **1**. Para los compuestos de la Fórmula 5, en donde Q^2 se une a través de un átomo de carbono hibridado sp^3, G es, típicamente, Cl, Br, I o un sulfonato (por ejemplo, $OS(O)_2CH_3$). Los compuestos de la Fórmula **5** están disponibles comercialmente o su preparación se conoce en la técnica. Destacan las modalidades del método del Esquema 3, en donde un compuesto de la Fórmula **4** se usa para preparar un compuesto de la Fórmula **1** correspondiente descrito específicamente en las Tablas 85 a 252 siguientes.

Esquema 3

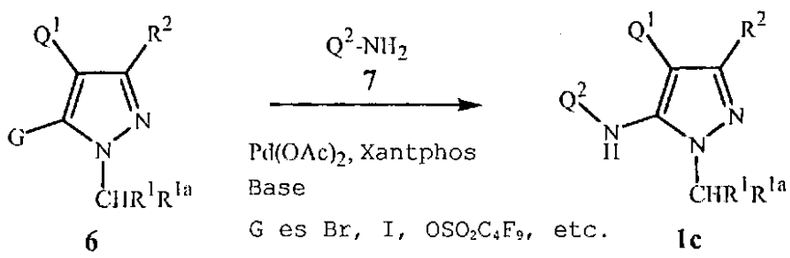


En el caso de las reacciones de conformidad con el método del Esquema 3 de un compuesto de la Fórmula **4**, en donde X es O

o NR^4 con un compuesto de la Fórmula **5** (Q^2-G), en donde Q es un anillo Q aromático o heteroaromático que no tiene una cantidad suficiente de sustituyentes tomadores de electrones o para mejorar la velocidad de reacción, el rendimiento o la pureza del producto, el uso de un catalizador de metal (por ejemplo, metal o sal de metal) en cantidades que varían desde una cantidad catalítica hasta una cantidad mayor que la estequiométrica puede facilitar la reacción deseada. Típicamente, para estas condiciones, G es Br o I o un sulfonato, tal como $OS(O)_2CF_3$ u $OS(O)_2(CF_2)_3CF_3$. Por ejemplo, pueden usarse complejos de sal de cobre (por ejemplo, CuI con *N,N'*-dimetiletilendiamina, prolina o bipiridilo), complejos de paladio (por ejemplo, tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0)) o sales de paladio (por ejemplo, acetato de paladio) con ligandos tales como 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (es decir, "Xantphos"), 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo (es decir, "Xphos") o 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (es decir, "BINAP") en presencia de una base, tal como carbonato potásico, carbonato de cesio, fenóxido de sodio o *terc*-butóxido de sodio, en un solvente tal como *N,N*-dimetilformamida, 1,2-dimetoxietano, sulfóxido de dimetilo, 1,4-dioxano o tolueno mezclado opcionalmente con alcoholes, tal como etanol. Alternativamente, tal como se ilustra en el Esquema 4, los compuestos de la

Fórmula **1c** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es NR^4 y R^4 es H) pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos de la Fórmula **6** (es decir, 5-bromopirazoles u otros pirazoles sustituidos en la posición 5 con un grupo saliente) con compuestos de la Fórmula 7 en condiciones catalizadas con metal similares a las descritas anteriormente para el Esquema 3. Los compuestos de la Fórmula 7 están disponibles comercialmente o su preparación se conoce en la técnica.

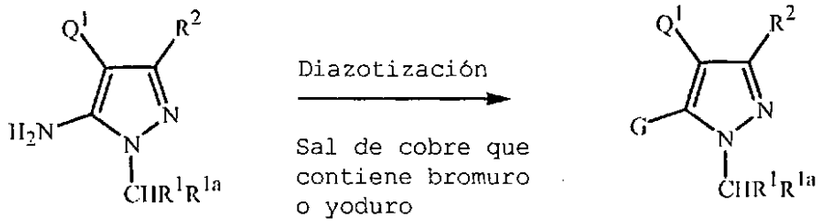
Esquema 4



Tal como se muestra en el Esquema 5, los compuestos de la Fórmula **6**, en donde G es Br o I se pueden preparar mediante la reacción de 5-aminopirazoles de la Fórmula **4a** (es decir, Fórmula **4**, en donde X es NH) en condiciones de diazotización en presencia de o seguido de la combinación con sales de cobre que contienen bromuro o yoduro. Por ejemplo, la adición de nitrito de *n*-butilo a una solución de un 5-aminopirazol de la Fórmula **4a** en presencia de $CuBr_2$ en un solvente, tal como acetonitrilo, proporciona el 5-bromopirazol correspondiente de

la Fórmula 6. Del mismo modo, un 5-aminopirazol de la Fórmula **4a** puede convertirse a sal de diazonio y, después, a un 5-halopirazol correspondiente de la Fórmula **6** mediante el tratamiento con nitrito sódico en solventes tales como agua, ácido acético o ácido trifluoacético en presencia de un ácido mineral, típicamente, que contiene el mismo átomo de haluro (tal como solución de HI acuosa para G es I) seguido del tratamiento con la sal de cobre(I) o cobre(II) correspondiente de conformidad con los procedimientos generales conocidos para aquellos con experiencia en la técnica.

Esquema 5

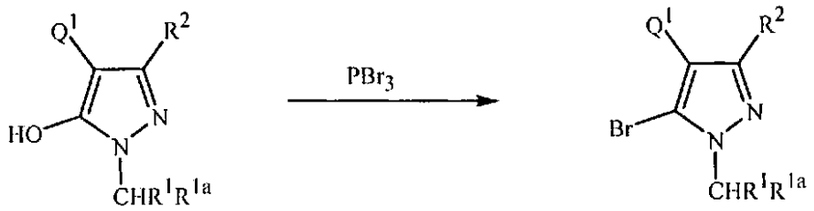


4a **6**

G es Br o I.

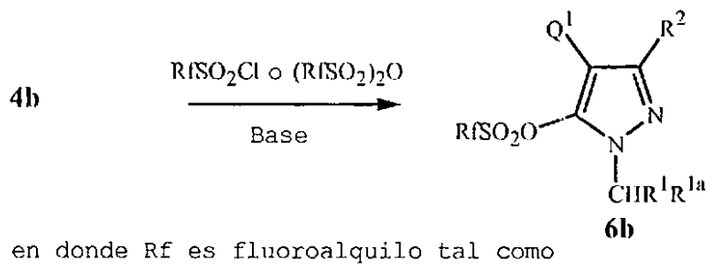
Como se muestra en el Esquema **6**, los 5-bromopirazoles de la Fórmula 6a (es decir, Fórmula **6**, en donde G es Br) pueden prepararse por medio de la reacción de 5-hidroxipirazoles de la Fórmula **4b** (es decir, Fórmula **4**, en donde X es O) con tribromuro de fósforo, tal como se describe en *Tetrahedron Lett.* **2000**, *41*(24), 4713.

Esquema 6



Como se muestra en el Esquema 7, los 5-hidroxipirazoles de la Fórmula **4b** pueden usarse, además, para preparar 5-fluoroalquilsulfonil (por ejemplo, 5-trifluorometanosulfonil, 5-nonafluorobutilsulfonil) pirazoles de la Fórmula **6b** (es decir, Fórmula **6**, en donde G es fluoroalquilsulfonilo), tal como se describe en *Synlett* **2004**, 5, 795.

Esquema 7

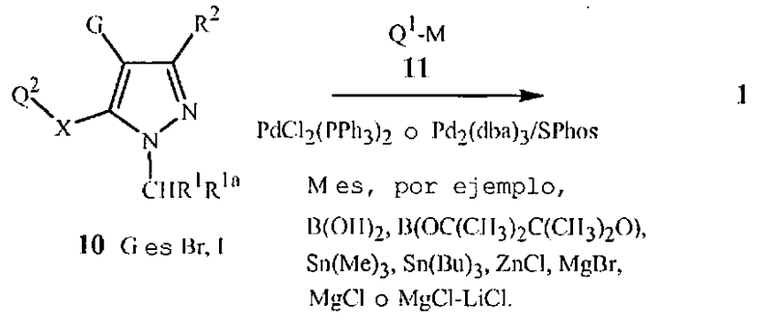


en donde Rf es fluoroalquilo tal como CF_3 o $(CF_2)_2CF_3$

Como se muestra en el Esquema 8, los compuestos de la Fórmula **1** pueden prepararse por medio de la reacción de 4-bromo o yodo pirazoles de la Fórmula **10**, en donde X es O, NR^4, C(=O) o $S(O)_m$, en donde m es 2 con compuestos

organometálicos de la fórmula Q^1-M (Fórmula **11**) en condiciones de reacción de acoplamiento cruzado catalizada con metales de transición. La reacción de un 4-bromo o yodo pirazol de la Fórmula **10** con un ácido borónico, trialquiltina, zinc o reactivo de organomagnesio de la Fórmula **11** en presencia de un catalizador de paladio o níquel que tiene los ligandos apropiados (por ejemplo, trifenilfosfina (PPh_3), dibencilidenacetona (dba), diciclohexil(2',6'-dimetoxi[1,1'-bifenil]-2-il)fosfina (SPhos)) y una base, de ser necesaria, produce el compuesto de la Fórmula 1 correspondiente. Por ejemplo, un ácido aril borónico sustituido o derivado (por ejemplo, Fórmula 11, en donde Q^1 es fenilo o heterociclo sustituido opcionalmente y M es $B(OH)_2$, $B(OC(CH_3)_2C(CH_3)_2O)$) o $B(O\text{-}i\text{-}Pr)_3 \cdot Li$ reacciona con un 4-bromo- o 4-yodopirazol de la Fórmula **10** en presencia de diclorobis(trifenilfosfina) paladio(II) y una base acuosa, tal como carbonato sódico o hidróxido de potasio, en solventes tales como 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, tolueno o alcohol etílico o en condiciones anhidras con un ligando, tal como óxido de fosfina o ligando de fosfito (por ejemplo, óxido de difenilfosfina) y fluoruro de potasio en un solvente tal como 1,4-dioxano (véase *Angewandte Chemie, International Edition* **2008**, *47*(25), 4695-4698) para proporcionar el compuesto correspondiente de la Fórmula 1.

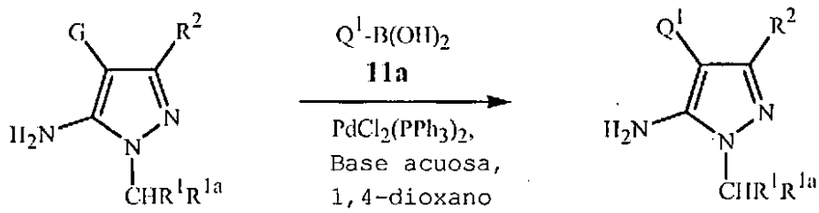
Esquema 8



10 G es Br, I

Como se ilustra en el Esquema 9, los compuestos de la Fórmula **4a** (es decir, Fórmula **4**, en donde X es NH) pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos de la Fórmula **12** con compuestos de la Fórmula **11** (tales como Q^1-$B(OH)_2$ (Fórmula **11a**)) en condiciones de reacción de acoplamiento cruzado catalizada con metales de transición, tal como se describió para el método del Esquema 8.

Esquema 9



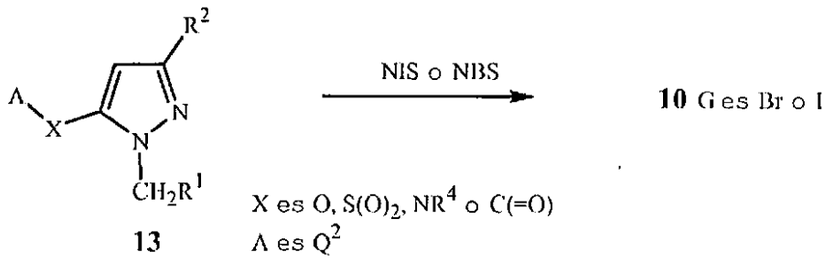
12 G es Br, I

4a

Como se ilustra en el Esquema 10, los pirazoles de la Fórmula **10**, en donde X es O, $S(O)_2$, NR^4 o C(=O) y G es Br o I

se preparan fácilmente mediante la reacción de pirazoles no sustituidos en la posición 4 (Fórmula **13**) con reactivos halogenantes, tales como bromo, bromito de sodio, *N*-bromosuccinimida (NBS) o *N*-yodosuccinimida (NIS), en solventes tales como ácido acético, acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida o 1,4-dioxano, o una mezcla de agua con los solventes mencionados anteriormente, a temperaturas que varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente.

Esquema 10



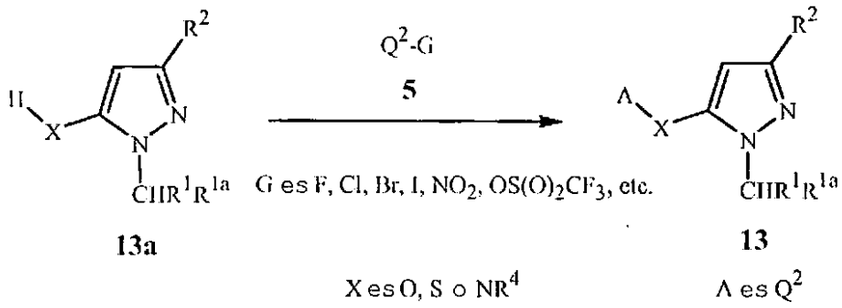
13

Además, si se usan condiciones de reacción similares a las del método del Esquema 10, los compuestos de la Fórmula **13**, en donde A es H o un grupo protector pueden convertirse en intermedios que corresponden a la Fórmula **10**, en donde Q^2 se reemplaza con A o un grupo protector, respectivamente, y que son útiles para preparar los compuestos de la Fórmula **1**. Los compuestos de la Fórmula **13**, en donde A es H pueden prepararse por medio de métodos conocidos en la técnica;

véase, por ejemplo, *Synlett* **2004**, 5, 795-798, la patente de los Estados Unidos núm. 4256902 y las referencias citadas en ellas. Además, algunos compuestos de la Fórmula **13**, en donde A es H, particularmente aquellos en los cuales R^2 es metilo, etilo o halógeno, están disponibles comercialmente.

Como se muestra en el Esquema 11, los compuestos de la Fórmula **13**, en donde X es O, $S(O)_m$ o NR^4, m es 0 y A es Q^2 pueden prepararse a partir de los compuestos correspondientes de la Fórmula **13a** (es decir, Fórmula **13**, en donde A es H) mediante procedimientos análogos a los usados para el método del Esquema 3. Después, los compuestos de la Fórmula **13**, en donde X es S (es decir, $S(O)_m$, en donde m es 0) pueden oxidarse por medio de procedimientos tales como los usados para el método del Esquema 1 para proporcionar los compuestos correspondientes de la Fórmula **13**, en donde X es $S(O)_2$ útiles para el método del Esquema 10. Los compuestos de la Fórmula **13a** están disponibles comercialmente o pueden prepararse por medio de métodos conocidos en la técnica.

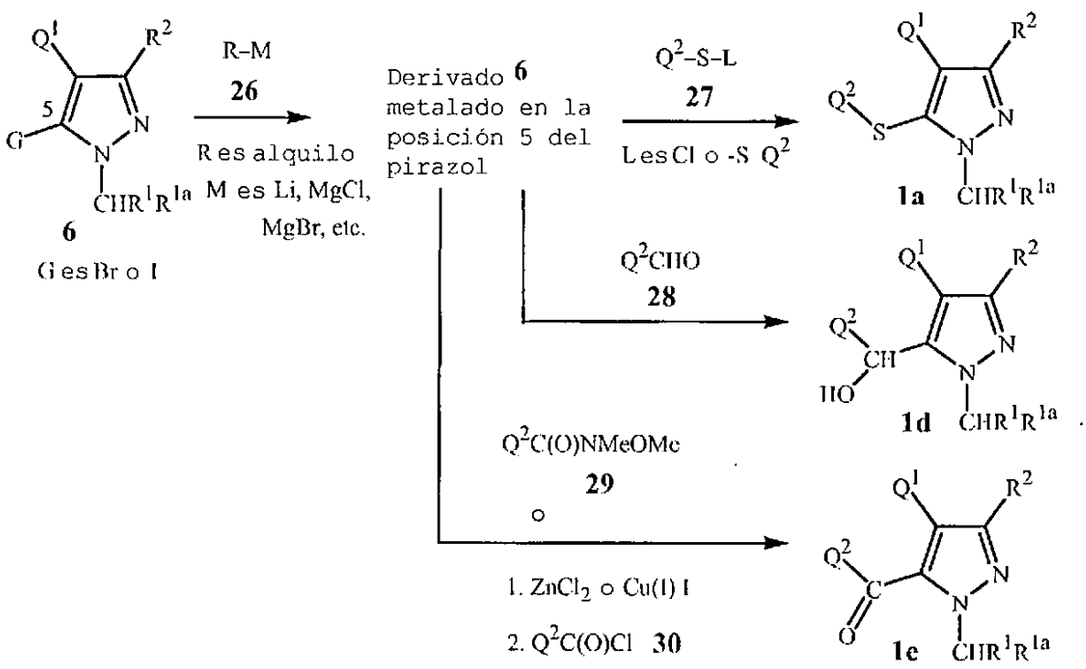
Esquema 11



Como se muestra en el Esquema 12, los compuestos de la Fórmula **1a** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es $S(O)_m$ y m es 0), Fórmula **1d** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es $CR^{15}R^{16}$, R^{15} es H, R^{16} es OR^{18} y R^{18} es H) y Fórmula **1e** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es C(=O)) pueden prepararse por medio del tratamiento de los compuestos de la Fórmula **6** con un reactivo organometálico (es decir, Fórmula **26**), tal como alquil-litio, preferentemente, *n*-butil-litio o un reactivo de alquilmagnesio, preferentemente, cloruro de isopropilmagnesio (opcionalmente, en un complejo con cloruro de litio), seguido por la adición de un azufre electrofílico (es decir, Fórmula **27**) o carbonilo electrofílico (es decir, Fórmula **28**, **29** o **30**). Las temperaturas de reacción pueden ser de -90 °C hasta el punto de ebullición del solvente de reacción; generalmente, se prefieren las temperaturas de -78 °C a la temperatura ambiente, entre las cuales se prefieren las temperaturas de -78 a -10 °C cuando se usa un reactivo de alquil-litio y, preferentemente, de -20 °C a

la temperatura ambiente cuando se usan reactivos de alquilmagnesio. Son útiles varios solventes, tales como tolueno, éter etílico, tetrahidrofurano o dimetoximetano; preferentemente, el tetrahidrofurano anhidro. Ventajosamente, puede añadirse un segundo componente metálico, tal como cloruro de zinc, bromuro de zinc o una sal de cobre monovalente, tal como yoduro de cobre(I) o cianuro de cobre(I) antes del electrófilo en los casos en los cuales el electrófilo es $Q^2C(O)Cl$ (es decir, Fórmula **30**). Los intermedios de azufre y carbonilo que contienen Q^2 de las Fórmulas **27**, **28**, **29** y **30** están disponibles comercialmente o pueden prepararse por medio de métodos conocidos en la técnica.

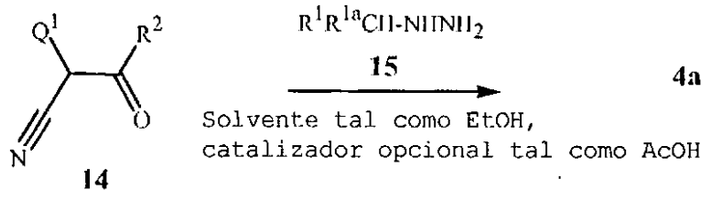
Esquema 12



Una persona con experiencia en la técnica reconocerá que las reacciones análogas a las que se muestran en el Esquema 12 pueden usarse, además, con pirazoles que no tienen un sustituyente Q^1 y, de ese modo, producen ciertos compuestos de la Fórmula **13** que son útiles en el método descrito en el Esquema 10.

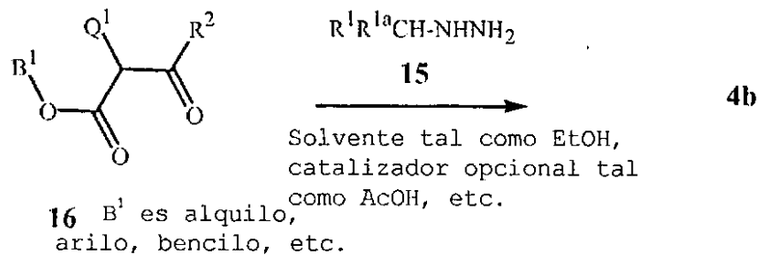
Los métodos generales útiles para preparar los 5-aminopirazoles de la Fórmula **4a** son bien conocidos en la técnica; véase, por ejemplo, *Journal für Praktische Chemie (Leipzig)* **1911**, *83*, 171 y *J. Am. Chem. Soc.* **1954**, 76, 501. Dicho método se ilustra en el Esquema 13 en el cual R^2 es alquilo o cicloalquilo.

Esquema 13



De manera similar, los métodos generales útiles para preparar los 5-hidroxipirazoles de la Fórmula **4b** son bien conocidos en la técnica; véase, por ejemplo, *Annalen der Chemie* **1924**, *436*, 88. Dicho método se ilustra en el Esquema 14 en el cual R^2 es alquilo o cicloalquilo.

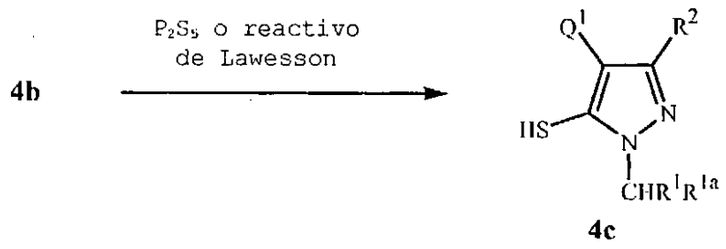
Esquema 14



16 B^1 es alquilo, arilo, bencilo, etc.

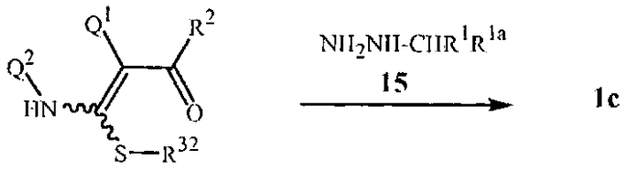
Como se muestra en el Esquema 15, los compuestos de 5-tiopirazol de la Fórmula **4c** (es decir, Fórmula **4**, en donde X es S) pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos de 5-hidroxipirazol correspondientes de la Fórmula **4b** con P_2S_5 (véase, por ejemplo, *Justus Liebigs Annalen der Chemie* **1908**, *361*, 251) o con el reactivo de Lawesson 2,4-disulfuro de (2,4-bis-(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano; véase, por ejemplo, la publicación de patente internacional núm. WO 2005/118575) en solventes tales como tolueno, xileno o tetrahidrofurano.

Esquema 15



Como se muestra en Esquema 16, los compuestos de la Fórmula **1c** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es NR^4 y R^4 es H) pueden prepararse por medio de la condensación de los compuestos de la Fórmula **17** con alquilhidrazinas de la Fórmula **15** en un solvente, tal como etanol o metanol y, opcionalmente, en presencia de un catalizador de ácidos o bases, tal como ácido acético, piperidina o metóxido de sodio, de conformidad con los procedimientos generales conocidos en la técnica.

Esquema 16



17

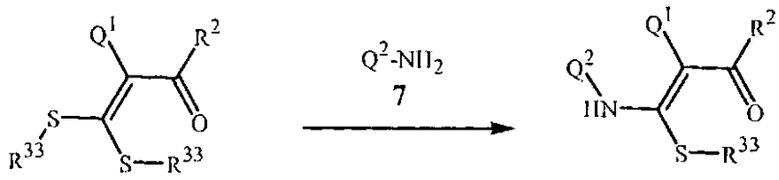
en donde R^{32} es H o alquilo inferior (por ejemplo, CH_3, CH_2CH_3 o $(CH_2)_2CH_3$)

De manera análoga al método del Esquema 16, los compuestos de la Fórmula 2, en donde X es NH pueden prepararse de manera similar por medio de la condensación de los compuestos de la Fórmula **17** con hidrazina. Este método se describe en *Chemistry of Heterocyclic Compounds 2005, 41*(1), 105-110.

Como se muestra en el Esquema 17, los compuestos de la Fórmula 17 (en donde, por ejemplo, R^2 es metilo, etilo o ciclopropilo sustituido opcionalmente y R^{33} es H o alquilo

inferior tal como CH_3, CH_2CH_3 o $(CH_2)_2CH_3$) pueden prepararse por medio de la reacción de compuestos de ditioacetal de cetena correspondientes de la Fórmula 18 con compuestos de la Fórmula Q^2-NH_2 (es decir, Fórmula 7), opcionalmente, en presencia de una base, tal como hidruro sódico o cloruro de etil-magnesio, en solventes tales como tolueno, tetrahidrofurano o dimetoximetano, a temperaturas de -10 °C al punto de ebullición del solvente. Véase, por ejemplo, J. Heterocycl. Chem. 1975, 12(1), 139. Los métodos útiles para preparar los compuestos de la Fórmula 18 son conocidos en la técnica.

Esquema 17



18 17

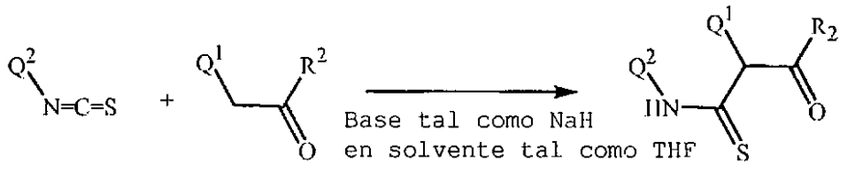
en donde R^{33} es H o alquilo inferior (por ejemplo, CH_3, CH_2CH_3 o $(CH_2)_2CH_3$)

En la técnica se conoce (véase, por ejemplo, Synthesis **1989**, 398), además, que los compuestos de la Fórmula **18** en los cuales los dos grupos R^{33} se toman juntos como un solo grupo CH_2 (y, de ese modo, forman un anillo de ditietano) reaccionan con una cantidad estequiométrica excedente de hidrazinas de la

Fórmula **15** para producir compuestos de la Fórmula **4c** que son útiles para preparar los compuestos de la Fórmula **1** en los cuales X es S de conformidad con el método del Esquema 3.

Como se muestra en el Esquema 18, los compuestos de la Fórmula **17a** (es decir, el tautómero de la Fórmula **17**, en donde R^{33} es H) pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos de isotiocianato correspondientes de la Fórmula **19** con compuestos de arilacetona de la Fórmula **20**, en donde R^2 es metilo, etilo o ciclopropilo sustituido opcionalmente; véase, por ejemplo, *Zhurnal Organicheskoi Khimii 1982, 18*(12), 2501. Las bases útiles para esta reacción incluyen hidruro sódico, bases de alcóxido (por ejemplo, *terc*-butóxido potásico o etóxido sódico), hidróxido de potasio, hidróxido de sodio, carbonato potásico o bases de amina (por ejemplo, trietilamina o *N,N*-diisopropiletilamina). Son útiles diversos solventes, tales como tetrahidrofurano, éter, tolueno, *N,N*-dimetilformamida, alcoholes (por ejemplo, etanol), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo o acetato de isopropilo) o mezclas de estos. Los solventes se eligen de modo que sean compatibles con la base seleccionada, tal como se conoce en la técnica. Las temperaturas de reacción pueden ser de -78 °C hasta el punto de ebullición del solvente. Una mezcla útil de base y solvente es el terc-butóxido potásico en tetrahidrofurano, en el cual se añade, a -70 a 0 °C, una solución combinada de un isotiocianato de la Fórmula **19** y un compuesto de carbonilo de la Fórmula **20**.

Esquema 18

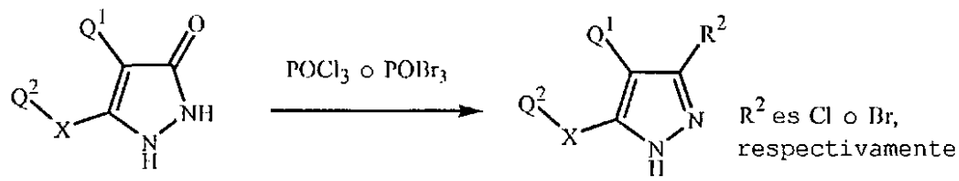


19 **20** **17a**

Las cetotioamidas de la Fórmula **17** pueden prepararse, además, cuando se permite que las cetoamidas correspondientes reaccionen con agentes sulfurantes, tales como el reactivo de Lawesson o P_2S_5; véase, por ejemplo, *Helv. Chim. Act.* **1998**, *81*(7), 1207.

Los compuestos de la Fórmula **2**, en donde X es NH y R^2 es Cl o Br, que son útiles para preparar compuestos de la Fórmula **1** de conformidad con el método del Esquema 2, pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos correspondientes de la Fórmula **31** con $POCl_3$ o $POBr_3$ mediante procedimientos generales conocidos en la técnica, tal como se muestra en el Esquema 19.

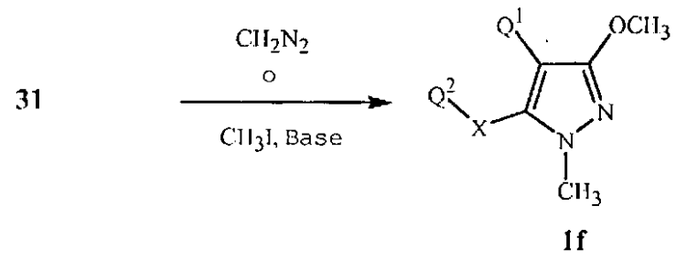
Esquema 19



31 X es NH **2**

Como se muestra en el Esquema 20, los compuestos de la Fórmula **1f** (es decir, Fórmula **1**, en donde R^1 y R^{1a} son H y R^2 es OCH_3) pueden prepararse por medio de la reacción de los compuestos correspondientes de la Fórmula **31** con diazometano o yodometano en presencia de la base mediante procedimientos generales conocidos en la técnica, tales como los descritos en *J. Heterocyclic Chem.* **1988**, 1307-1310.

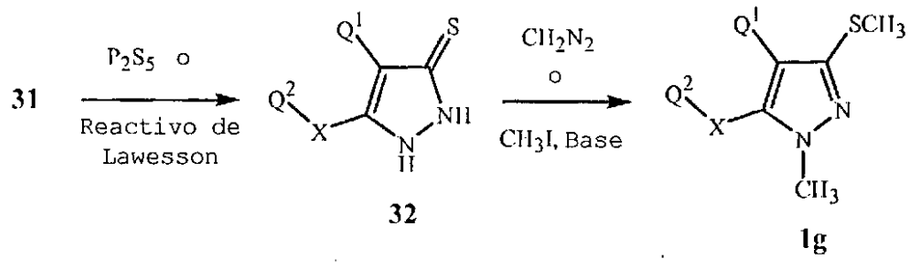
Esquema 20



1f

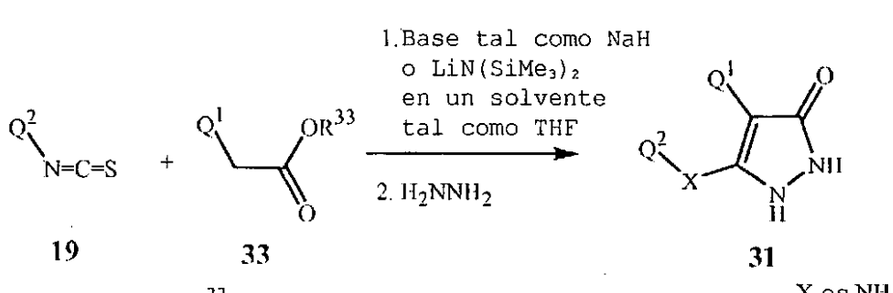
Los compuestos de la Fórmula **1g** (es decir, Fórmula **1**, en donde R^1 y R^{1a} son H y R^2 es SCH_3) pueden prepararse por medio del tratamiento de los compuestos correspondientes de la Fórmula **31** con P_2S_5 o reactivo de Lawesson para preparar los compuestos de la Fórmula **32** que, después, se hacen reaccionar con diazometano o yodometano en presencia de la base mediante procedimientos generales conocidos en la técnica, tal como se muestra en el Esquema 21.

Esquema 21



Como se muestra en el Esquema 22, los compuestos de la Fórmula **31**, en donde X es NH pueden prepararse por medio de la condensación de los isotiocianatos correspondientes de la Fórmula **19** con ésteres de la Fórmula **33**, en donde R^{33} es alquilo inferior (por ejemplo, metilo, etilo, propilo) en presencia de una base no nucleofílica fuerte, tal como hidruro sódico o hexametildisilazida de litio, en un solvente inerte tal como tetrahidrofurano (análogo al método del Esquema 18), seguido de la reacción del intermedio con hidrazina o una sal ácida de hidrazina, tal como, por ejemplo, una sal de acetato o clorhidrato (análogo al método del Esquema 16).

Esquema 22

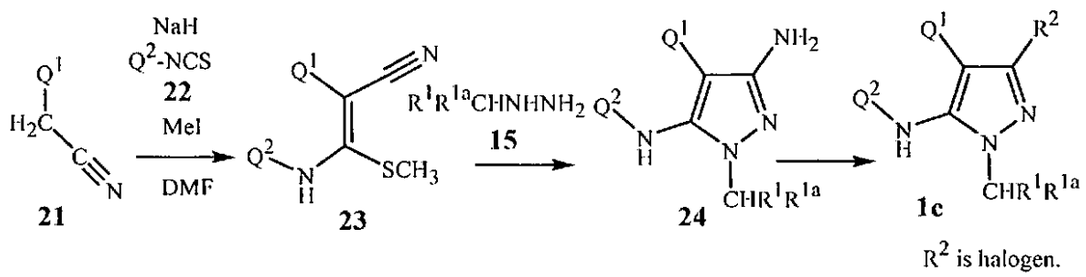


Una persona con experiencia en la técnica reconocerá que el uso de una hidrazina sustituida de la fórmula $H_2NNHCHR^1R^{1a}$ en lugar de una hidrazina no sustituida en el método del Esquema 22, seguida de los manejos adicionales descritos para los Esquemas 19, 20 y 21 producirán, además, los compuestos de la Fórmula **1**.

Los compuestos de la Fórmula **1c** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es NR^4 y R^4 es H) en los cuales R^2 es halógeno pueden prepararse, además, como se muestra en el Esquema 23. En este método, un compuesto de acetonitrilo de la Fórmula **21** se condensa con un compuesto de isotiocianato de la Fórmula **22** en presencia de una base tal como hidruro sódico o *terc*-butóxido potásico, en un solvente, tal como *N,N*-dimetilformamida o tetrahidrofurano, para producir un compuesto intermedio de ciano cetoamida que, después, se hace reaccionar con un agente metilante, tal como yodometano o sulfato de dimetilo, en presencia de una base para proporcionar el compuesto correspondiente de la Fórmula **23**. Alternativamente, el agente metilante puede incluirse en la mezcla de reacción con los compuestos de las Fórmulas **21** y **22** sin aislar el intermedio de ciano cetoamida. Una persona con experiencia en la técnica reconocerá que los compuestos de la Fórmula 23 pueden prepararse, además, por medio de un método análogo al Esquema 17, en donde el $C(O)R^2$ del compuesto de la Fórmula **18** se reemplaza con ciano. De conformidad con el método del Esquema

23, el compuesto resultante de la Fórmula **23** se hace reaccionar, después, con una alquilhidrazina de la Fórmula **15** para formar el compuesto de 3-aminopirazol correspondiente de la Fórmula **24** mediante procedimientos generales conocidos en la técnica; véase, por ejemplo, J. *Chem. Soc. Perkin 1* **1988**, *2*, 169-173 y J. *Med. Chem.* **2003**, *46(7)*, 1229-1241. Después, el grupo amino del compuesto de la Fórmula **24** puede convertirse en R^2 que, en la Fórmula **1c** es halógeno, mediante una reacción de diazotización en condiciones conocidas en la técnica, tales como las descritas anteriormente para el Esquema 5.

Esquema 23

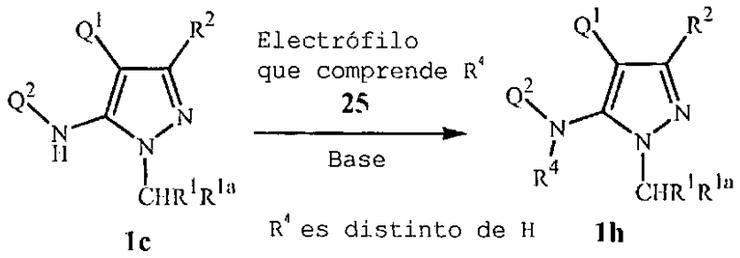


De manera análoga al método del Esquema 23, los compuestos de la Fórmula **2**, en donde X es NH y R^2 es halógeno pueden prepararse de manera similar por medio de la condensación de los compuestos de la Fórmula **23** con hidrazina en lugar de una alquilhidrazina de la Fórmula **15**.

Como se muestra en el Esquema 24, los compuestos de la Fórmula **1h** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es NR^4) pueden

prepararse por medio de la reacción de los compuestos correspondientes de la Fórmula **1c** (es decir, Fórmula **1**, en donde X es NH) con un electrófilo que comprende R^4 (es decir, Fórmula **25**), típicamente, en presencia de una base tal como NaH y un solvente polar, tal como N,N-dimetilformamida. En este contexto, la expresión "electrófilo que comprende R^4" significa un compuesto químico capaz de transferir una porción R^4 a un nucleófilo (tal como el átomo de nitrógeno unido a Q^2 en la Fórmula **1c**). Frecuentemente, los electrófilos que comprenden R^4 tienen la fórmula R^4Lg, en donde Lg es un nucleófugo (es decir, un grupo saliente en reacciones nucleofílicas). Los nucleófugos típicos incluyen halógenos (por ejemplo, Cl, Br, I) y sulfonatos (por ejemplo, $OS(O)_2CH_3$, $OS(O)_2CF_3$, $OS(O)_2$-(4-CH_3-Ph)). Sin embargo, algunos electrófilos que comprenden R^4 no comprenden un nucleófugo; un ejemplo es el trióxido de azufre (SO_3) que, después de la desprotonación (por ejemplo, por una base de las fórmulas M^+H^-, en donde M^+ es un catión) del átomo de nitrógeno unido a Q^2 en la Fórmula **1c**, puede unirse al átomo de nitrógeno como un sustituyente $-SO_3^-M^+$.

Esquema 24



1c 1h

Una persona con experiencia en la técnica reconoce que diversos grupos funcionales pueden convertirse en otros para proporcionar distintos compuestos de la Fórmula **1**. Por ejemplo, los compuestos de la Fórmula **1** en los cuales R^2 es metilo, etilo o ciclopropilo pueden modificarse mediante halogenación de radicales libres para formar compuestos de la Fórmula **1**, en donde R^2 es halometilo, haloetilo o halociclopropilo. Los compuestos de halometilo pueden usarse como intermedios para preparar compuestos de la Fórmula **1**, en donde R^2 es hidroximetilo o cianometilo. Los compuestos de la Fórmula 1 o los intermedios para su preparación podrían contener grupos nitro aromáticos que pueden reducirse a grupos amino y, después, convertirse por medio de reacciones bien conocidas en la técnica, tales como la reacción de Sandmeyer, en diversos haluros y, proporcionar así, otros compuestos de la Fórmula **1**. Por medio de reacciones conocidas similares, las aminas aromáticas (anilinas) pueden convertirse por medio de sales de diazonio en fenoles que, después, se pueden alquilar

para preparar los compuestos de la Fórmula 1 con sustituyentes alcoxi. De igual manera, los haluros aromáticos, tales como bromuros o yoduros preparados mediante la reacción de Sandmeyer, pueden reaccionar con alcoholes en condiciones catalizadas por cobre, tales como la reacción de Ullmann o modificaciones conocidas de esta, para proporcionar compuestos de la Fórmula **1** que contienen sustituyentes alcoxi. Adicionalmente, algunos grupos halógeno, tales como flúor o cloro, pueden desplazarse con alcoholes en condiciones básicas para proporcionar compuestos de la Fórmula **1** que contienen los sustituyentes alcoxi correspondientes. Los compuestos alcoxi resultantes pueden usarse en sí mismos en reacciones posteriores para preparar compuestos de la Fórmula 1, en donde R^3 es -U-V-T (véase, por ejemplo, la publicación del PCT núm. WO 2007/149448 A2). Los compuestos de la Fórmula **1** o los precursores de estos, en los cuales R^2 o R^3 es haluro, preferentemente, bromuro o yoduro, son intermedios particularmente útiles para las reacciones de acoplamiento cruzado catalizadas por metales de transición para preparar compuestos de la Fórmula **1**. Estos tipos de reacciones están bien documentados en la literatura; véase, por ejemplo, Tsuji en *Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis*, John Wiley and Sons, Chichester, 2002; Tsuji *en Palladium in Organic Synthesis*, Springer, 2005; y

Miyaura and Buchwald *en Cross Coupling Reactions: A Practical Guide*, 2002; y las referencias citadas en ellas.

Una persona con experiencia en la técnica reconocerá que los grupos sulfuro pueden oxidarse a los sulfóxidos o sulfonas correspondientes por medio de condiciones bien conocidas en la técnica. De igual modo, los compuestos de la Fórmula 1, en donde X es $CR^{15}R^{16}$, R^{15} es H, R^{16} es OR^{18} y R^{18} es H, se pueden interconvertir fácilmente con los compuestos correspondientes de la Fórmula **1**, en donde X es C(=O) por medio de reacciones de oxidación con alcohol y reducción con cetona bien conocidas en la técnica. Los compuestos de la Fórmula 1, en donde X es C(=O) (es decir, cetonas) pueden convertirse fácilmente a cetales por medio de métodos generales conocidos en la técnica y, proporcionar así, los compuestos de la Fórmula **1**, en donde X es $CR^{15}R^{16}$ y R^{15} y R^{16} se toman juntos como $-OCH_2CH_2O-$. Los compuestos de la Fórmula 1, en donde X es C(=O) pueden convertirse, además, por medio del uso de un reactivo de Lawesson para preparar los compuestos correspondientes de la Fórmula **1**, en donde X es C(=S). Además, los compuestos de la Fórmula **1**, en donde X es $CR^{15}R^{16}$, R^{15} es alquilo de C_1-C_4, R^{16} es OR^{18} y R^{18} es H pueden prepararse por medio de la adición de un reactivo de Grignard de alquilo a los compuestos correspondientes de la Fórmula **1**, en donde X es C(=O).

Además, en muchos casos, las reacciones anteriores se pueden realizar en una secuencia alternativa, tal como la

preparación de *1H* pirazoles para usar en la reacción del Esquema 2 por medio de las reacciones ilustradas más adelante para la preparación general de los pirazoles sustituidos. La presencia de ciertos grupos funcionales podría no ser compatible con todas estas condiciones de reacción, y el uso de grupos protectores podría ser deseable para obtener los productos deseados con rendimientos y/o pureza mejoradas.

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para la preparación de compuestos de la Fórmula **1** pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos la incorporación de secuencias de protección/desprotección o las interconversiones de grupos funcionales en las síntesis facilitarán la obtención de los productos deseados. El uso y la elección de los grupos de protección serán evidentes para un experto en síntesis de sustancias químicas (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2.° ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Una persona con experiencia en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de introducir un reactivo determinado tal como se representa en cualquier esquema individual, podría ser necesario realizar etapas de síntesis de rutina adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de los compuestos de la Fórmula **1**. Una persona con experiencia en la técnica reconocerá, además, que

podría ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al que implica la secuencia particular para preparar los compuestos de la Fórmula **1**. Una persona con experiencia en la técnica reconocerá, además, que los compuestos de la Fórmula **1** y los intermedios descritos en la presente invención pueden exponerse a diversas reacciones electrofílicas, nucleofílicas, radicales, organometálicas, oxidación y reducción para añadir sustituyentes o para modificar los sustituyentes existentes.

Sin entrar en otros detalles innecesarios, se considera que, basándose en la descripción precedente, un experimentado en la técnica podrá usar al máximo la presente invención. Por consiguiente, los siguientes ejemplos de síntesis deben interpretarse como meramente ilustrativos, sin limitar la descripción en ningún sentido. Las etapas de los siguientes ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa de una transformación sintética total, y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante la ejecución de un preparativo específico cuyo procedimiento se describe en otros ejemplos o en otras etapas. Los porcentajes son en peso, excepto para las mezclas de solventes para cromatografía o, en donde se indique de otra manera. Las partes y los porcentajes para las mezclas de solventes para cromatografía son en volumen, a menos que se indique de otra manera. Los espectros de ^{1}H NMR

se reportan en ppm campo abajo de tetrametilsilano en $CDCl_3$ a menos que se indique de cualquier otra forma; "s" significa singulete, "m" significa multiplete, "br s" significa singulete amplio. Los espectros de masa se reportan como el peso molecular del ion precursor de mayor abundancia isotópica (M+1) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) en la molécula, observada por espectrometría de masa con ionización química a presión atmosférica (AP^+), en donde "amu" significa unidades de masa atómica.

Ejemplo de síntesis 1

Preparación de *N*-(3-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*1H*-pirazol-5-amina (Compuesto 1)

Etapa A: Preparación de α-acetil-2,4-difluorobencenoacetonitrilo (designado, alternativamente, como α-ciano-2,4-difluorobencenoacetato de metilo)

Se agitó hidruro sódico (60 % en aceite mineral) (1,5 g, 38 mmol) en xilenos (7 ml en una atmósfera de nitrógeno a temperatura ambiente. Se añadió una solución de etanol anhidro (6,3 ml, 64 mmol) en xilenos (2 ml en gotas durante aproximadamente 20 minutos a una temperatura de aproximadamente 40 °C. La mezcla de reacción se calentó hasta 70 °C y se añadió una solución de 2,4-difluorofenilacetonitrilo (3,9 g, 25 mmol), acetato de etilo (3,8 ml, 38 mmol) y xilenos (1 ml en gotas

durante 15 min. Para facilitar la agitación se añadieron xilenos adicionales (5 ml). La mezcla de reacción se calentó durante 2 h y, después, se dejó enfriar. Se añadió agua (50 ml y la mezcla se extrajo con hexanos (50 ml). Después, la fase acuosa se acidificó hasta pH 3-4 con solución acuosa de HCl 1 N. La fase acuosa se extrajo con éter (50 ml), y el extracto etéreo se lavó con agua (25 ml y salmuera, después se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para producir el compuesto del título como un residuo viscoso (3,3 g).

^{1}H NMR δ 7,42 (m, 1H), 6,8-7,0 (m, 2H), 4,95 (s, 1H), 2,36 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se añadió ácido acético (0,5 ml, 8,3 mmol) y metilhidrazina (534 µL, 10,0 mmol) en una solución del residuo obtenido en la Etapa A (1,6 g, 8,5 mmol) en alcohol etílico (8 ml). Después, la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 16 h en una atmósfera de nitrógeno. Mientras la mezcla de reacción estaba aún tibia, se añadió agua en porciones pequeñas (1 ml por vez) hasta que se formó un precipitado (aproximadamente 12 ml de agua en total). La mezcla se calentó nuevamente para disolver los sólidos y, después, se dejó enfriar hasta temperatura ambiente. El precipitado resultante se recolectó en una frita de vidrio, se lavó con 2 a 3 ml de

alcohol etílico acuoso al 50 % y se secó en una atmósfera de vacío para obtener el compuesto como un sólido blanco (0,99 g).

^{1}H NMR δ 7,20 (m, 1H), 6,92 (m, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,47 (br s, 2H), 2,14 (s, 3H).

Etapa C: Preparación de *N*-(3-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se combinó acetato de paladio(II) (90 mg, 0,40 mmol), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (460 mg, 0,80 mmol) y carbonato potásico en polvo (5,5 g, 40 mmol) en 1,4-dioxano anhidro (20 ml y la mezcla se depuró con una corriente subsuperficial de gas N_2 durante 10 min. 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina (es decir, el producto de la Etapa B) (0,89 g, 4,0 mmol) se añadió en una porción y el 1-bromo-3-clorobenceno (0,47 ml, 4,0 mmol) se añadió con una jeringa. La mezcla de reacción se calentó a reflujo en una atmósfera de nitrógeno durante 3 h. Se añadió 1-bromo-3-clorobenceno (0,09 ml, 0,8 mmol) adicional y se continuó con el calentamiento durante 1 h. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriara hasta temperatura ambiente y, después, se dividió entre el agua (40 ml y el acetato de etilo (40 ml). La fase orgánica se lavó con agua adicional (40 ml), salmuera (40 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de 10 g de gel de sílice eluido con hexanos/acetato de etilo

(1:1) para producir el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido (0,41 g).

^{1}H NMR δ 7,2-7,3 (m, 2H), 7,10 (m, 1H), 6,9-7,0 (m, 2H), 6,70 (m, 1H), 6,58 (m, 1H), 6,52 (m, 1H), 3,64 (s, 3H), 2,14 (s, 3H). MS: 334 amu.

Ejemplo de síntesis 2

Preparación de 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 17)

Etapa A: Preparación de 5-bromo-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol

Se añadió bromuro de cobre(II) (3,94 g, 17,7 mmol) en una solución de 4-[2-cloro-4-fluorofenil]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (preparado de manera similar a la preparación de 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina en las etapas A y B del Ejemplo de síntesis 1) (2,4 g, 10 mmol) en acetonitrilo (50 ml), y la mezcla se agitó y enfrió en un baño de hielo mientras se añadían gotas de nitrito de *n*-butilo (grado técnico 90 %, 2,33 ml, 17,7 mmol) durante 5 min. La mezcla de reacción se dejó entibiar lentamente hasta la temperatura ambiente. Se añadió la solución de HCl acuosa (20 ml y, después, se añadió el acetato de etilo (20 ml). Esta mezcla se filtró a través de una almohadilla de 2 cm del auxiliar de filtro de diatomácea Celite®. La almohadilla del filtro se lavó con acetato de etilo (20 ml y las fases se separaron. La fase orgánica se lavó con

solución acuosa de ácido clorhídrico 1,0 N y salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener el compuesto del título como un semisólido naranja amarronado (2,8 g).

^{1}H NMR δ 7,18-7,25 (m, 2H), 7,04 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,14 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se combinó 5-bromo-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto de la Etapa A) (0,20 g, 0,66 mmol), acetato de paladio(II) (15 mg, 0,066 mmol), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (76 mg, 0,13 mmol) y carbonato potásico en polvo (1,8 g, 13 mmol) en 1,4-dioxano anhidro (3 ml y la mezcla se depuró con una corriente subsuperficial de gas N_2 durante 10 min. Se añadió 2,6-difluoro-4-metoxianilina (0,22 g, 1,3 mmol) en una porción y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 22 h. La mezcla de reacción se filtró a través del auxiliar de filtro de diatomácea Celite® y la almohadilla del filtro se lavó con acetato de etilo (20 ml). El filtrado se lavó con agua (10 ml y salmuera (10 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener un residuo semisólido. Este residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de 5 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (20:1 a 1:3) para producir el

compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido marrón claro (48 mg).

^{1}H NMR δ 7,0-7,1 (m, 2H), 6,85 (m, 1H), 6,26 (m, 2H), 4,84 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,66 (s, 3H), 2,08 (s 3H). MS: 382 amu.

Ejemplo de síntesis 3

Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 24)

Etapa A: Preparación de 2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo

Se añadió una solución de KCN (0,88 g, 13 mmol) disuelta en agua (2 ml en gotas en una solución enfriada en un baño de agua de bromuro de 2,6-difluoro-4-metoxibencilo (2,50 g, 10,5 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (10 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 20 min. Se añadió agua (20 ml y, después, la mezcla de reacción se vertió en solución acuosa saturada de $NaHCO_3$ (20 ml y se extrajo con éter (50 ml). La fase orgánica se lavó con agua (5 x 25 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para producir un aceite que se cristalizó al asentarse para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (1,9 g).

^{1}H NMR δ 6,50 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,65 (s, 2H).

Etapa B: Preparación de α-acetil-2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo

Se agitó el etóxido sódico sólido (4,7 g, 66 mmol) en una mezcla de xileno (20 ml y etanol (10 ml y se calentó hasta 50 °C. Se añadió una solución de 2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo (es decir, el producto de la Etapa A) (8,0 g, 44 mmol) en gotas en acetato de etilo (10,4 ml). La mezcla de reacción se calentó a 50 °C durante 4 h y, después, se enfrió hasta la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió en agua (100 ml y se extrajo con acetato de etilo (25 ml). La fase acuosa se acidificó con HCl 3 N acuoso hasta pH 4 y se extrajo con acetato de etilo (100 ml). Esta fase orgánica se lavó con agua (50 ml), salmuera (50 ml), después se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener el compuesto del título como un semisólido amarronado (8,0 g).

^{1}H NMR δ 6,56 (m, 2H), 4,86 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,40 (s, 3H).

Etapa C: Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se agitó α-acetil-2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo (es decir, el producto de la Etapa B) (8,03 g, 35,7 mmol) y ácido acético (5 ml en etanol (35 ml y se añadió metilhidrazina (1,91 ml, 35,7 mmol). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 16 h, se enfrió y después se vertió en agua (100 ml). La mezcla

resultante se extrajo con acetato de etilo (100 ml). La fase orgánica se lavó con NaOH 1 N acuoso (50 ml y, después, con salmuera (50 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener un sólido. El sólido se disolvió en metanol y la solución resultante se entibió hasta 45 °C. Se añadió agua (25 ml en gotas y la mezcla se dejó enfriar. El precipitado se recolectó en una frita de vidrio para producir el compuesto del título como un sólido blanco (3,88 g).

^{1}H NMR δ 6,55 (m, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,67 (s, 3H), 3,43 (br s, 2H), 2,09 (s, 3H).

Etapa D: Preparación de 5-bromo-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol

Se añadió bromuro de cobre(II) (3,81 g, 16,9 mmol) en una solución de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto de la Etapa C) (3,88 g, 15,4 mmol) en acetonitrilo (50 ml y la mezcla se agitó y enfrió en un baño de hielo fundente mientras se añadían gotas de nitrito de *n*-butilo (grado técnico 90 %, 3,54 ml, 26,9 mmol) durante 5 min. La mezcla de reacción se dejó entibiar lentamente hasta la temperatura ambiente. Se añadió solución acuosa de ácido clorhídrico (25 ml), después se añadió acetato de etilo (25 ml y la mezcla resultante se filtró a través de una almohadilla de 2 cm del auxiliar de filtro de diatomácea Celite®. La almohadilla del filtro se lavó con acetato de etilo (50 ml y las fases se separaron. La

fase orgánica se lavó con solución de HCl 1 N acuosa (25 ml y salmuera (25 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de 24 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (9:1 a 1:1) para producir el compuesto del título como un sólido blanco (3,25 g).

^{1}H NMR δ 6,54 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,83 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Etapa E: Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina

5-bromo-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto de la Etapa D) (0,30 g, 0,94 mmol), acetato de paladio(II) (20 mg, 0,090 mmol), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (0,11 g, 0,19 mmol) y carbonato potásico en polvo (2,6 g, 19 mmol) se combinaron en 1,4-dioxano anhidro (4 ml y la mezcla resultante se depuró con una corriente subsuperficial de gas N_2 durante 10 min. Se añadió 2,4,6-trifluoroanilina (0,28 g, 1,9 mmol) en una porción y la mezcla de reacción se calentó a reflujo en una atmósfera de nitrógeno durante 22 h. La mezcla de reacción se enfrió y, después, se filtró a través de un auxiliar de filtro de diatomácea Celite®. La almohadilla del filtro se lavó con acetato de etilo (20 ml y el filtrado se lavó con agua (10 ml y salmuera (10 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener un residuo semisólido. El residuo se purificó mediante

cromatografía en columna a través de 12 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (20:1 a 1:3) para producir el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un semisólido (73 mg).

^{1}H NMR (acetona-d_6) δ 6,84 (br s, 1H), 6,68 (m, 2H), 6,43 (m, 2H), 3,77 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 1,99 (s, 3H). MS: 384 amu (AP^+).

Ejemplo de síntesis 4

Preparación de 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 45)

Etapa A: Preparación de 4-[(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo

Se añadió carbonato potásico (1,38 g, 10 mmol) en una solución de 2,4-dihidro-2,5-dimetil-3*H*-pirazol-3-ona (0,70 g, 6,3 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (15 ml). Se añadió 3,4,5-trifluorobenzonitrilo (0,94 g, 6,0 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a 75 °C en una atmósfera de nitrógeno durante 16 h y, después, se dejó enfriar. La mezcla de reacción se dividió entre agua (60 ml y acetato de etilo (30 ml). La fase orgánica se lavó con agua (2 x 30 ml y salmuera (30 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para producir el compuesto del título como un aceite amarillo (1,38 g).

^{1}H NMR δ 7,36 (m, 2H), 5,24 (s, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 3,5-difluoro-4-[(4-yodo-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)oxi]benzonitrilo

Se agitó una solución de 4-[(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (es decir, el producto de la Etapa A) (1,38 g, 5,5 mmol) en acetonitrilo (20 ml a temperatura ambiente y se añadió *N*-yodosuccinimida (1,35 g, 6,0 mmol) en una porción. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 2 h, se enfrió y, después, se vertió en agua (40 ml). La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (40 ml). La fase orgánica se lavó con agua (20 ml y solución saturada acuosa de $NaHCO_3$ (20 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró a presión reducida para producir el compuesto del título como un sólido amarronado (2,1 g).

^1H NMR (acetona-d_6) δ 7,80 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 2,09 (s, 3H). MS: 376 amu (AP^+).

Etapa C: Preparación de 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo

En una solución de 3,5-difluoro-4-[(4-yodo-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)oxi]benzonitrilo (es decir, el producto de la Etapa B) (1,0 g, 2,67 mmol) en 1,4-dioxano (6 ml se añadió ácido 2-cloro-4-fluorobencenoborónico (designado alternativamente como ácido *B*-(2-cloro-4-fluorofenil)borónico) (0,93 g, 5,33 mmol), dicloro (bis)trifenilfosfina paladio(II) (designado alternativamente como dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II)) (93 mg, 0,13 mmol), carbonato

potásico (0,74 g, 5,33 mmol) y agua (4 ml). La mezcla resultante se calentó a reflujo durante 5 h, se dejó enfriar y se dividió entre el agua (20 ml y el acetato de etilo (20 ml). La capa orgánica se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice con un gradiente de hexanos / acetato de etilo para obtener el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blancuzco (110 mg).

^{1}H NMR δ 7,00-7,09 (m, 3H), 6,97 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 2,02 (s, 3H).

Ejemplo de síntesis 5

Preparación de 4-(2,4-diclorofenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 69)

Etapa A: Preparación de α-acetil-2,4-dicloro-*N*-(2,4-difluorofenil)bencenoetanotioamida

Se añadió isocianato de 2,4-difluorofenilo (0,27 ml, 2,0 mmol) en una suspensión agitada de hidruro sódico (60 % en aceite mineral) (112 mg, 2,8 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (4 ml enfriado en un baño de hielo fundente en una atmósfera de nitrógeno. Se añadió una solución de (2,4-diclorofenil)-2-propanona (570 mg, 2,8 mmol) en tetrahidrofurano (4 ml en gotas durante 5 min. La solución amarilla resultante se agitó a 5-10 °C durante 1 h. Se añadió agua (10 ml cuidadosamente y la mezcla de reacción se extrajo

con acetato de etilo (10 ml). La fase acuosa se acidificó hasta pH 3 con HCl 1 N acuoso y, después, se extrajo con acetato de etilo (20 ml). El extracto orgánico se lavó con agua (10 ml y salmuera (10 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener un sólido. El sólido se trituró con hexanos / acetato de etilo (2:1), se recolectó en una frita de vidrio y se secó al aire para producir el compuesto del título como un sólido blanco (240 mg). MS: 373 amu (AP^+).

Etapa B: Preparación de 4-(2,4-diclorofenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se añadió ácido acético (50 µL) y metilhidrazina (41 µL) en una suspensión agitada de α-acetil-2,4-dicloro-*N*-(2,4-difluorofenil)bencenoetanotioamida (238 mg, 0,64 mmol) en etanol (4 ml). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 2 h y se dejó enfriar. Después, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo (10 ml y se lavó con NaOH 1 N acuoso (10 ml), agua (10 ml y salmuera (10 ml), se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener un residuo sólido. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de 5 g de gel de sílice con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (2:1 a 1:1) para producir el compuesto del título como un sólido (170 mg).

^1H NMR δ 7,43 (s, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 6,62 (m, 1H), 6,37 (m, 1H), 5,22 (br s, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,18 (s, 3H). MS: 368 amu (AP^+).

Ejemplo de síntesis 6

Preparación de 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-α-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (Compuesto 351)

Se disolvió 5-bromo-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto del Ejemplo de síntesis 2, Etapa A) (0,25 g, 0,82 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (12 ml y la mezcla se enfrió en un baño de hielo seco/acetona en una atmósfera de nitrógeno. Se añadió una solución de ciclohexano de *n*-butil-litio (2,0 M, 0,49 ml, 0,98 mmol) en gotas durante 5 minutos. Después de 15 minutos se añadieron lentamente gotas de una solución de 2,4-difluorobenzaldehído (0,09 ml, 0,82 mmol) en tetrahidrofurano anhidro (3 ml de modo que la solución de color rojo oscuro se aclaró hasta un color amarillo. Después de 45 minutos, la mezcla de reacción se enfrió mediante la adición de solución acuosa saturada de NH_4Cl (~20 ml y se dejó entibiar a temperatura ambiente. Esta mezcla se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se lavó con solución acuosa saturada de NH_4Cl (25 ml y con salmuera, se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró para obtener un residuo viscoso. Este residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con un gradiente de acetato de etilo en hexano (7 % a 10 %) para producir el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un semisólido blanco (109 mg).

^{1}H NMR δ 7,5 (m, 1H), 7,1 (m, 2H), 7,0 (m, 1H), 6,85 (m, 2H), 6,0 (br s, 1H), 5,9 (s, 1H), 3,8 (s, 3H), 2,1 (s, 3H). MS: 367 amu (AP^+).

Ejemplo de síntesis 7

Preparación de [4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il](2,4-difluorofenil)metanona (Compuesto 370)

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-α-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol (es decir, el producto del Ejemplo de síntesis 6) (90 mg, 0,25 mmol) se disolvió en diclorometano (8 ml y se añadió dicromato de piridinio (113 mg, 0,3 mmol) en una porción. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h y, después, la mezcla de reacción se dividió entre el agua (5 ml y el diclorometano (5 ml). La fase orgánica se lavó con agua adicional (5 ml y con salmuera (5 ml), se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró a presión reducida para producir un residuo viscoso. Este residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con un gradiente de acetato de etilo en hexano (25 % a 30 %) para producir el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite viscoso amarillo pálido (29 mg).

^{1}H NMR δ 7,94 (m, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,27 (m, 1H), 7,03 (m, 1H), 6,95 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,13 (s, 3H). MS: 365 amu (AP^+).

Ejemplo de síntesis 8

Preparación de 5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol (Compuesto 54)

Etapa A: Preparación de 2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo

Se agitó una solución de ácido 2,4,6-trifluorobencenoacético (5,00 g, 26,3 mmol) en metanol (25 ml a temperatura ambiente y se añadió cloruro de tionilo (6 ml, ~ 3 eq.) en gotas, de modo que la temperatura de la mezcla de reacción alcanzara 60 °C. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente y se agitó durante 3 h. Se añadió agua (25 ml con enfriamiento en hielo. La mezcla se extrajo con acetato de etilo (2 x 100 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua (2x), con solución de bicarbonato sódico acuosa saturada y con salmuera y se secaron sobre $MgSO_4$. La concentración proporcionó el producto del título como un aceite transparente (5,38 g).

^{1}H NMR δ 6,68 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 3,66 (s, 2H).

Etapa B: Preparación de α-acetil-2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo

En una solución de tetrahidrofurano de bis(trimetilsilil)amida de litio obtenida comercialmente (1,0 M, 21,0 ml), agitada en una atmósfera de nitrógeno y enfriada hasta una temperatura interna de -65 °C se añadió en gotas durante 30 minutos una solución de 2,4,6-

trifluorobencenoacetato de metilo (es decir, el producto de la Etapa A) (2,04 g, 10,0 mmol) disuelta en tetrahidrofurano seco (10 ml). La mezcla de reacción se agitó durante otros 30 minutos y, después, mientras la temperatura se mantenía en -65 °C, se añadió una solución de cloruro de acetilo destilada fresca (0,80 ml, 11 mmol) en gotas en tetrahidrofurano seco (3 ml). La mezcla de reacción se dejó entibiar lentamente hasta temperatura ambiente y, después, se añadió agua (30 ml). La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (60 ml). La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico 1 N y se extrajo con acetato de etilo (60 ml). Se retuvo solamente el primer extracto, ya que el análisis cromatográfico de la capa delgada mostró que el segundo extracto contenía impurezas polares aparentes además del producto adicional deseado. La fase orgánica inicial se lavó aún más con ácido clorhídrico 1 N, agua y salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para proporcionar el producto del título como un aceite transparente (1,86 g).

^1H NMR δ 6,69 (m, 2H), 3,7 (m, 1H y s, 3H), 1,87 (s, 3 H); las resonancias menores a 13,2 ppm y 4,9 ppm indicaron la presencia de un tautómero enólico.

Etapa C: Preparación de 1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-ol

En una solución de α-acetil-2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo (es decir, el producto de

la Etapa B) (2,46 g, 10,0 mmol) en metanol (15 ml se añadió metilhidrazina (0,665 ml, 12,5 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. Se añadió solución de ácido cítrico acuosa (1 M, 10 ml y, después, se añadió agua (50 ml). La mezcla se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con agua y con salmuera, se secaron sobre $MgSO_4$ y se concentraron para dejar un sólido amarillo. Este sólido se suspendió en un volumen pequeño de acetato de etilo (aproximadamente 5 ml), se añadió gradualmente un volumen igual de hexanos y la suspensión se agitó durante 30 minutos. El componente sólido se recolectó en una frita de vidrio, se lavó con porciones pequeñas de acetato de etilo/ hexanos (1:1 y 1:2 v:v) y se dejó secar al aire para proporcionar un sólido blanco (1,02 g). La evaporación del líquido principal y el tratamiento del residuo resultante con pequeños volúmenes de acetato de etilo y hexanos, tal como se describió anteriormente, proporcionó 0,13 g adicionales de sólido que contenía el producto del título (1,15 g en total). El análisis de los sólidos combinados mediante LC/MS demostró un componente primario de masa 242 (AP+) y un componente menor que se eluyó después mediante cromatografía en líquido de fase inversa y que también tenía una masa de 242 (AP+). La relación aparente de los componentes era de 94:6.

^{1}H NMR (acetona-d_6) δ 6,95 (m, 2H), 3,52 (s, 3H), 1,98 (s, 3H); en este solvente no se observó resonancia de 5-hidroxi.

Etapa D: Preparación de 5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol

1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-ol (es decir, el producto de la Etapa C) (0,310 g, 1,28 mmol) se combinó con 3,4,5-trifluoronitrobenceno (157 µL, 1,35 mmol) y carbonato potásico en polvo (0,27 g, 2 mmol) en *N,N*-dimetilformamida seca (4 ml). Esta mezcla se agitó y calentó a 80 °C durante 45 minutos y después se dejó enfriar. La mezcla de reacción se diluyó con agua (10 ml y se extrajo con acetato de etilo (2 x 10 ml). La fase orgánica se lavó con agua y con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para dejar un residuo viscoso. Este residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con un gradiente de acetato de etilo (30 % a 100 %) en hexano para producir el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blancuzco (209 mg).

^{1}H NMR δ 7,71 (m, 2H), 6,54 (m, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,07 (s, 3H); 400 amu (AP+).

Ejemplo de síntesis 9

Preparación de 4-[[1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobencenamina (Compuesto 371)

5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol (es decir, el producto del Ejemplo de síntesis 8) (0,780 g, 1,95 mmol) se combinó con hierro en polvo (malla 325, 0,58 g, 10 mmol) y cloruro amónico (64 mg, 1,2 mmol) en etanol (27 ml en el cual se había añadido agua (3 ml). La mezcla se calentó a reflujo durante 1,25 h y, después, se dejó enfriar. La mezcla de reacción se diluyó con un volumen igual de acetato de etilo y se filtró a través de un auxiliar de filtro Celite. El filtrado se secó con $MgSO_4$ y se concentró. El análisis mediante LC/MS mostró que el componente principal (93 %) tenía una masa de 370 amu (AP+). El residuo se disolvió en sulfóxido de dimetilo anhidro (8 ml y se añadió una solución comercial de metóxido de sodio en metanol (0,45 ml de solución al 25 %). Esta solución se agitó en una atmósfera de nitrógeno y se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió solución de metóxido de sodio/metanol adicional (0,20 ml y se continuó con el calentamiento por otros 30 minutos. La mezcla de reacción se dejó enfriar y, después, se trató con solución de ácido cítrico acuosa (1 M, 5 ml), se diluyó con agua (50 ml y se extrajo con acetato de etilo (2 x 25 ml). La fase orgánica se lavó con agua (3x) y con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró para obtener el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite viscoso (0,52 g).

^{1}H NMR δ 6,29 (m, 2H), 5,95 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,55-3,75 (br s, NH_2), 2,01 (s, 3H); 382 amu (AP+).

Ejemplo de síntesis 10

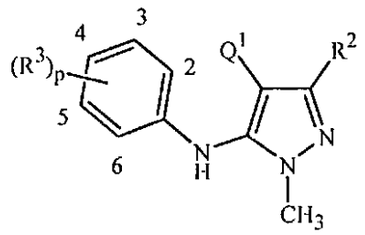
Preparación de 5-(4-cloro-2,6-difluorofenoxi)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (Compuesto 58)

Se añadió cloruro de cobre(I) (56 mg, 0,42 mmol) en una solución de 4-[[4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobencenamina (preparado de manera análoga al Ejemplo de síntesis 9) (132 mg, 0,346 mmol) en acetonitrilo (5 ml). La mezcla agitada se enfrío con un baño de hielo fundente y se añadió nitrito de *n*-butilo (grado técnico 90 %, 72 µL) en gotas. La mezcla de reacción se dejó entibiar lentamente a temperatura ambiente y se agitó a temperatura ambiente de la noche a la mañana y, después, se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió ácido clorhídrico (1 N, 5 ml y la mezcla se extrajo con acetato de etilo (~20 ml). La fase orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre $MgSO_4$ y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con acetato de etilo al 20 % en hexano para producir el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite viscoso (45 mg).

^{1}H NMR δ 6,74 (m, 2H), 6,30 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 2,03 (s, 3H); 401 amu (AP+).

Por medio de los procedimientos descritos en la presente invención combinados con métodos conocidos en la técnica se pueden preparar los compuestos descritos en las siguientes tablas. Las siguientes abreviaturas se usan en la siguiente tabla: Me significa metilo, Et significa etilo, *n*-Pr significa *n*-propilo, *c*-Pr significa ciclopropilo, Ph significa fenilo, OMe (o MeO) significa metoxi, OEt (o EtO) significa etoxi, -CN significa ciano y $-NO_2$ significa nitro.

Tabla 1



Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl

2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF_3-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

La presente descripción incluye, además, las Tablas 2 a 84; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 1 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 1 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 2, el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Cl" y $(R^3)_p$ es tal como se definió en la Tabla 1 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 2 describe específicamente 2-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-*N*-(2-fluorofenil)-1-metil-1*H*-pirazol-5-amina. Las Tablas 3 a 84 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
2	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	47	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Cl.
3	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^2 es Br.	48	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Br.
4	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Me.	49	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Me.
5	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	50	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Cl.
6	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Br.	51	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Br.
7	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Me.	52	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Me.
8	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Cl.	53	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Cl.
9	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Br.	54	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Br.
10	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y R^2 es Me.	55	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2 es Me.
11	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y R^2 es Cl.	56	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2 es Cl.
12	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y R^2 es Br.	57	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2 es Br.
12A	Q^1 es 2,6-di-F-4-	58	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2

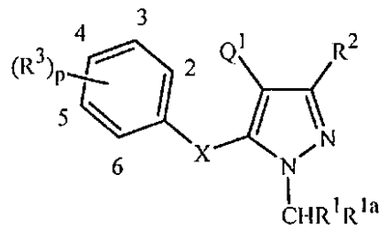
Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	OEt-Ph, y R^2 es Me.		es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2
12B	OEt-Ph, y R^2 es Cl.	59	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2
12C	OEt-Ph, y R^2 es Br.	60	es Br.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
13	Ph, y R^2 es Me.	60A	es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
14	Ph, y R^2 es Cl.	60B	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
15	Ph, y R^2 es Br.	60C	es Br.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y R^2
16	R^2 es Me.	61	es Me.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y R^2
17	R^2 es Cl.	62	es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y R^2
18	R^2 es Br.	63	es Br.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y R^2
19	R^2 es Me.	63A	es Me.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y R^2
20	R^2 es Cl.	63B	es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y R^2
21	R^2 es Br.	63C	es Br.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
22	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, y R^2 es Me.	64	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y R^2 es Me.
23	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	65	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y R^2 es Cl.
24	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, y R^2 es Br.	66	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y R^2 es Br.
25	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, y R^2 es Me.	66A	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y R^2 es Me.
26	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	66B	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y R^2 es Cl.
27	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, y R^2 es Br.	66C	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y R^2 es Br.
28	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y R^2 es Me.	67	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2 es Me.
29	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y R^2 es Cl.	68	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2 es Cl.
30	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y R^2 es Br.	69	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2 es Br.
31	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y R^2 es Me.	70	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y R^2 es Me.
32	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y R^2 es Cl.	71	Q^1 es 2-Cl -4-CN-Ph, y R^2 es Cl.
33	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y	72	Q^1 es 2-Cl -4-CN-Ph, y R^2

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	R^2 es Br.		es Br.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^2
34	R^2 es Me.	73	es Me.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br -4-CN-Ph, y R^2
35	R^2 es Cl.	74	es Cl.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^2
36	R^2 es Br.	75	es Br.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
37	R^2 es Me.	76	piridinilo, y R^2 es Me.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
38	R^2 es Cl.	77	piridinilo, y R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
39	R^2 es Br.	78	piridinilo, y R^2 es Br.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
40	Me.	79	R^2 es Me.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
41	Cl.	80	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
42	Br.	81	R^2 es Br.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
43	es Me.	82	tienilo, y R^2 es Me.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
44	es Cl.	83	tienilo, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
45	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2 es Br.	84	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, y R^2 es Br.
46	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Me.		

Tabla 85



Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H y R^2 es Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
4-F	4-Cl	4-Br	2,4-di-F	2-Br-4-F
2,6-di-F	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2-Cl-4-F	2-F-4-Cl
2-F-4-Br	2-Br-6-F	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-I-4-F
2-F-4-I	2-Cl-4,6-di-F	4-Cl-2,6-di-F	2-Br-4,6-di-F	4-Br-2,6-di-F
2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN
2-Br-4-CN	2,6-di-F-4-CN	2-F-4-NO_2	2-Cl-4-NO_2	2-Br-4-NO_2

2,5-di-F-4-CN	4-Cl-2,5-di-F	2-Br-4,5-di-F	4-Br-2,5-di-F	2-Cl-4,5-di-F

La presente descripción incluye, además, las Tablas 86 a 280; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 85 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 85 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H y R^2 es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 86, el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H y R^2 es Cl" y $(R^3)_p$ es tal como se definió en la Tabla 85 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 86 describe específicamente 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-5-(4-fluorofenoxi)-1-metil-1*H*-pirazol. Las Tablas 87 a 280 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila
86	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
87	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
88	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
89	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
90	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
91	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
92	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
93	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
94	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
95	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
96	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
96A	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
96B	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
96C	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
97	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
98	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
99	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
100	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
101	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
102	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
103	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
104	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
105	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
106	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
107	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
108	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
109	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
110	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
111	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
112	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
113	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
114	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
115	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
116	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
117	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
118	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
119	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
120	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
121	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
122	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
123	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
124	Q^1 es 2-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
125	Q^1 es 2-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
126	Q^1 es 2-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
127	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
128	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
129	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
130	Q^1 es 2-Br-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
131	Q^1 es 2-Br-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
132	Q^1 es 2-Br-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
133	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
134	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
135	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
136	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
137	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
138	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
139	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
140	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
141	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
142	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.

Tabla	Título de la fila
143	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
144	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
144A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
144B	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
144C	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
145	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
146	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
147	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
147A	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
147B	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
147C	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
148	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
149	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
150	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
150A	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
150B	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
150C	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
151	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
152	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
153	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
154	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
155	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
156	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
157	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
158	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
159	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
160	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
161	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
162	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
163	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.

Tabla	Título de la fila
164	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
165	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
166	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
167	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
168	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
169	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
170	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
171	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
172	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
173	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
174	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
175	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
176	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
177	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
178	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2

Tabla	Título de la fila
	es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
179	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
180	es Br.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
180A	es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
180B	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
180C	es Br.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
181	Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
182	Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
183	Br.
184	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
185	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
186	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
187	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
188	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
189	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
190	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
191	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
192	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
193	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
194	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
195	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
196	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
197	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
198	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
199	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
200	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
201	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
202	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
203	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
204	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
205	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
206	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
207	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
208	Q^1 es 2-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
209	Q^1 es 2-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
210	Q^1 es 2-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
211	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
212	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
213	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
214	Q^1 es 2-Br-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
215	Q^1 es 2-Br-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
216	Q^1 es 2-Br-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
217	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
218	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
219	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
220	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
221	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
222	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
223	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
224	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
225	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
226	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
227	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
228	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
228A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.

Tabla	Título de la fila
228B	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
228C	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
229	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
230	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
231	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
231A	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
231B	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
231C	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
232	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
233	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
234	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
234A	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
234B	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es

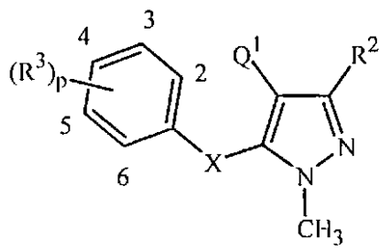
Tabla	Título de la fila
	Cl.
234C	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
235	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
236	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
237	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
238	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
239	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
240	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
241	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
242	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
243	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
244	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
245	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
246	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
247	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
248	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
249	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es

Tabla	Título de la fila
	Br.
250	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
251	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Cl.
252	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Br.
253	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es NH, R^1 y R^{1a} conforman *c*-Pr, y R^2 es Me.
254	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es O, R^1 es Et, R^{1a} es H, y R^2 es Cl.
255	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Et.
256	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es CHOH, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es CF_3.
257	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es NH, R^1 es $CH=CH_2$, R^{1a} es H, y R^2 es Cl.
258	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es CHOH, X es O, R^1 es *c*-Pr, R^{1a} es H, y R^2 es Br.
259	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} conforman *c*-Pr, y R^2 es Me.
260	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es CHOH, R^1 es *c*-Pr, R^{1a} es H, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es NH, X es NH, R^1 es Et,
261	R^{1a} es H, y R^2 es Br.
262	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Et.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R^1 es $CH_2CH=CH_2$, R^{1a} es H, y
263	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es CHOH, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
264	*c*-Pr.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es NH, R^1 es CH_2CF_3, R^{1a} es H, y R^2
265	es Me.
266	Q^1 es 2-F-Ph, X es O, R^1 es CH_2F, R^{1a} es H, y R^2 es Cl.
267	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es CH_2Cl.
268	Q^1 es 2-Br-Ph, X es $CHCH_3$, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es Me.
	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es $C(CH_3)OH$, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
269	es Me.
	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R^1 es Et, R^{1a} es H, y R^2 es
270	Br.
	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
271	OMe.
	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es $CHOCH_3$, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
272	es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es NH, R^1 y R^{1a} conforman *c*-Pr,
273	y R^2 es Br.
274	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R^1 es *n*-Pr, R^{1a} es H, y R^2

Tabla	Título de la fila
	es Me.
	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es NH, R^1 es $CH_2C{\equiv}CH$, R^{1a} es H, y
275	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es $C(OCH_3)_2$, R^1 y R^{1a} son H, y R^2
276	es Br.
	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es NH, R^1 y R^{1a} conforman *c*-Pr,
277	y R^2 es Me.
	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R^1 es *c*-Pr, R^{1a}
278	es H, y R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R^1 y R^{1a} son H, y R^2 es
279	Et.
	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es CHOH, R^1 es Et, R^{1a} es
280	H, y R^2 es Me.

Tabla 281



Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es CHOH y R^2 es Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$

4-F	4-Cl	4-Br	4-Me	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2-Cl-4-F	2-F-4-Cl
2-F-4-Br	2-Br-6-F	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-I-4-F
2-F-4-I	2-Cl-4,6-di-F	4-Cl-2,6-di-F	2-Br-4,6-di-F	4-Br-2,6-di-F
2-Br-4-F	2-Me-4-F	2,4,6-tri-F	2-Cl-4,5-di-F	4-Cl-2,5-di-F
2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN	2,6-diF-4-CN	2-F-4-MeO
2-Cl-4-MeO	2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	4-Br-2,5-di-F	2-Br-4,5-di-F

La presente descripción incluye, además, las Tablas 282 a 448; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 282 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 281 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es CHOH y R^2 es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 282, el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es CHOH y R^2 es Cl" y $(R^3)_p$ es tal como se definió en la Tabla 281 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 282 describe específicamente 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-α-(4-fluorofenil)-1-metil-1*H*-pirazol-5-metanol. Las Tablas 283 a 448 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila

Tabla	Título de la fila
282	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
283	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
284	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
285	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
286	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
287	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
288	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
289	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
290	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
291	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
292	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
292A	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
292B	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
292C	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
293	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
294	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
295	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
296	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
297	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
298	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
299	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
300	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
301	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
302	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
303	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
304	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
305	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
306	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
307	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
308	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
309	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
310	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
311	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
312	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
313	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
314	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
315	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
316	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
317	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
318	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
319	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
320	Q^1 es 2-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
321	Q^1 es 2-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
322	Q^1 es 2-F-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
323	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
324	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
325	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
326	Q^1 es 2-Br-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
327	Q^1 es 2-Br-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
328	Q^1 es 2-Br-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
329	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
330	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
331	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
332	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
333	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
334	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
335	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
336	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
337	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
338	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
339	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
340	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
340A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
340B	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
340C	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
341	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
342	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
343	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
343A	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.

Tabla	Título de la fila
343B	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
343C	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
344	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
345	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
346	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
346A	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
346B	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
346C	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
347	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
348	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
349	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
350	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
351	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
352	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
353	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Me.
354	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Cl.
355	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es CHOH, y R^2 es Br.
356	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es CHOH, y R^2 es Me.
357	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es CHOH, y R^2 es Cl.
358	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es CHOH, y R^2 es Br.
359	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Me.
360	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Cl.
361	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
362	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Me.
363	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Cl.
364	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es CHOH, y R^2 es Br.
365	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
366	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
367	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
368	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
369	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
370	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
371	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
372	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
373	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
374	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
375	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
376	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
376A	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
376B	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
376C	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
377	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
378	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
379	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
380	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
381	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.

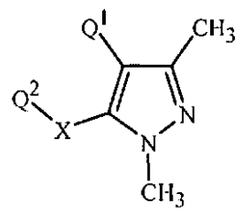
Tabla	Título de la fila
382	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
383	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
384	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
385	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
386	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
387	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
388	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
389	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
390	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
391	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
392	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
393	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
394	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
395	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
396	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
397	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
398	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
399	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
400	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
401	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
402	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
403	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
404	Q^1 es 2-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.

Tabla	Título de la fila
405	Q^1 es 2-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
406	Q^1 es 2-F-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
407	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
408	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
409	Q^1 es 2-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
410	Q^1 es 2-Br-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
411	Q^1 es 2-Br-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
412	Q^1 es 2-Br-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
413	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
414	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
415	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
416	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
417	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
418	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
419	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
420	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
421	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
422	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
423	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
424	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
424A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
424B	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
424C	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.

Tabla	Título de la fila
425	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
426	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
427	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
427A	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
427B	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
427C	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
428	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
429	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
430	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
430A	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
430B	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
430C	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
431	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
432	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
433	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
434	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
435	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
436	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
437	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Me.
438	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Cl.
439	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, X es C(O), y R^2 es Br.
440	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es C(O), y R^2 es Me.
441	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es C(O), y R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila
442	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es C(O), y R^2 es Br.
443	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Me.
444	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Cl.
445	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Br.
446	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Me.
447	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Cl.
448	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es C(O), y R^2 es Br.

Tabla 449



Q^1 es 2,6-di-F-Ph y X es NH.

Q^2	Q^2	Q^2	Q^2
2-Cl-3-piridinilo	6-Cl-3-piridinilo	2,6-di-Cl-3-piridinilo	3-Cl-2-piridinilo
3,5-di-Cl-2-piridinilo	3,5-di-F-2-piridinilo	5-Me-2-piridinilo	5-CN-2-piridinilo
5-pirimidinilo	2-Cl-5-pirimidinilo	1,3-di-Me-5-pirazolilo	5-Me-2-tiazolilo

5-Cl-2-piridinilo	3,5-di-Cl-4-piridinilo	Tetrahidro-2*H*-piran-4-ilo	Quinolin-2-ilo

La presente descripción incluye, además, las Tablas 450 a 587; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 449 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 449 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph y X es NH") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 450, el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,4-di-F-Ph y X es NH" y Q^2 es tal como se definió en la Tabla 449 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 450 describe específicamente 2-cloro-*N*-[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]-3-piridinamina. Las Tablas 451 a 587 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
450	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y X es NH.	519	Q^1 es 2-Cl-Ph, y X es S.
451	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y X es NH.	520	Q^1 es 2-Br-Ph, y X es S.
452	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y X es NH.	521	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y X es S.
453	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, y X es NH.	522	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y X es S.
454	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y	523	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y X

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	X es NH.		es S.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y X
455	X es NH.	524	es S.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y X
456	Ph, y X es NH.	525	es S.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y X
457	Ph, y X es NH.	526	es S.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y X
458	X es NH.	527	es S.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y X
459	X es NH.	528	es S.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y X
460	X es NH.	529	es S.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y X		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
461	es NH.	530	piridinilo, y X es S.
	Q^1 es 2-F-Ph, y X es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
462	NH.	531	X es S.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y X es		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
463	NH.	532	tienilo, y X es S.
	Q^1 es 2-Br-Ph, y X es		Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y X
464	NH.	533	es CHOH.
	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y X
465	X es NH.	534	es CHOH.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y
466	X es NH.	535	X es CHOH.
	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph,
467	X es NH.	536	y X es CHOH.
	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph,
468	X es NH.	537	y X es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y X
469	y X es NH.	538	es CHOH.
	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y X
470	y X es NH.	539	es CHOH.
	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph,
471	X es NH.	540	y X es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y		Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph,
472	X es NH.	541	y X es CHOH.
	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y X
473	X es NH.	542	es CHOH.
	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-		Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y X
	piridinilo, y X es		es CHOH.
474	NH.	543	
	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo,		Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y X
475	y X es NH.	544	es CHOH.
	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-		Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y X es
476	tienilo, y X es NH.	545	CHOH.

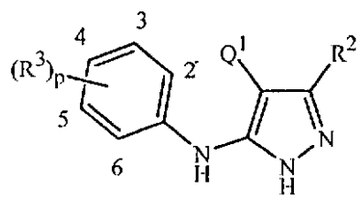
Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-Ph, y X es
477	X es O.	546	CHOH.
	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-Ph, y X es
478	X es O.	547	CHOH.
	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph,		Q^1 es 2-Br-Ph, y X es
479	y X es O.	548	CHOH.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-		Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y X
480	Ph, y X es O.	549	es CHOH.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y X
481	Ph, y X es O.	550	es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y X
482	X es O.	551	es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y X
483	X es O.	552	es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y X
484	Ph, y X es O.	553	es CHOH.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y X
485	Ph, y X es O.	554	es CHOH.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y X
486	X es O.	555	es CHOH.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y X
487	X es O.	556	es CHOH.
488	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y	557	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y X

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	X es O.		es CHOH.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y X		Q^1 es 2,5-di-Cl-pyridin-
489	es O.	558	3-yl, y X es CHOH.
	Q^1 es 2-F-Ph, y X es		Q^1 es 2,5-di-Cl-thien-3-
490	O.	559	yl, y X es CHOH.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y X es		Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y X
491	O.	560	es C(O).
	Q^1 es 2-Br-Ph, y X es		Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y X
492	O.	561	es C(O).
	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y
493	X es O.	562	X es C(O).
	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-OM-Ph
494	X es O.	563	e, y X es C(O).
	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph,
495	X es O.	564	y X es C(O).
	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y X
496	X es O.	565	es C(O).
	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y X
497	y X es O.	566	es C(O).
	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph,
498	y X es O.	567	y X es C(O).
	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y		Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph,
499	X es O.	568	y X es C(O).

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y X
500	X es O.	569	es C(O).
	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y X
501	X es O.	570	es C(O).
	Q^1 es 2,5-di-Cl-		Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y X
	pyridin-3-yl, y X es		es C(O).
502	O.	571	
	Q^1 es 2-Cl-thien-3-		Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y X es
503	yl, y X es O.	572	C(O).
	Q^1 es 2,5-di-Cl-		Q^1 es 2-F-Ph, y X es
504	thien-3-yl, y X es O.	573	C(O).
	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-Ph, y X es
505	X es S.	574	C(O).
	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-Ph, y X es
506	X es S.	575	C(O).
	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph,		Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y X
507	y X es S.	576	es C(O).
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-		Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y X
508	Ph, y X es S.	577	es C(O).
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y X
509	Ph, y X es S.	578	es C(O).
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y X
510	X es S.	579	es C(O).

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y X
511	X es S.	580	es C(O).
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y X
512	Ph, y X es S.	581	es C(O).
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y X
513	Ph, y X es S.	582	es C(O).
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y X
514	X es S.	583	es C(O).
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y X
515	X es S.	584	es C(O).
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
	X es S.		piridinilo, y X es
516		585	C(O).
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y X		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
517	es S.	586	X es C(O).
	Q^1 es 2-F-Ph, y X es		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
518	S.	587	tienilo, y X es C(O).

Tabla 588



Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF_3-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

La presente descripción incluye, además, las Tablas 589 a 671; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 588 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 588 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se

muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 589, el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^2 es Cl" y $(R^3)_p$ es tal como se definió en la Tabla 588 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 589 describe específicamente 5-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-*N*-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-3-amina. Las Tablas 589 a 671 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
589	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	634	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Cl.
590	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^2 es Br.	635	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Br.
591	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Me.	636	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Me.
592	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Cl.	637	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Cl.
593	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^2 es Br.	638	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^2 es Br.
594	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Me.	639	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Me.
595	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Cl.	640	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Cl.
596	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^2 es Br.	641	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^2 es Br.
597	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-	642	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Ph, y R^2 es Me.		es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-		Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2
598	Ph, y R^2 es Cl.	643	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-		Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^2
599	Ph, y R^2 es Br.	644	es Br.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2
599A	Ph, y R^2 es Me.	645	es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2
599B	Ph, y R^2 es Cl.	646	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-		Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^2
599C	Ph, y R^2 es Br.	647	es Br.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
600	Ph, y R^2 es Me.	647A	es Me.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
601	Ph, y R^2 es Cl.	647B	es Cl.
	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-		Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^2
602	Ph, y R^2 es Br.	647C	es Br.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y
603	R^2 es Me.	648	R^2 es Me.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y
604	R^2 es Cl.	649	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y
605	R^2 es Br.	650	R^2 es Br.

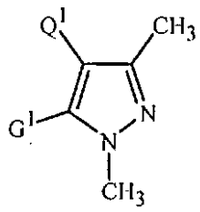
Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y
606	R^2 es Me.	650A	R^2 es Me.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y
607	R^2 es Cl.	650B	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y
608	R^2 es Br.	650C	R^2 es Br.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y
609	Ph, y R^2 es Me.	651	R^2 es Me.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y
610	Ph, y R^2 es Cl.	652	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y
611	Ph, y R^2 es Br.	653	R^2 es Br.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y
612	Ph, y R^2 es Me.	653A	R^2 es Me.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y
613	Ph, y R^2 es Cl.	653B	R^2 es Cl.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y
614	Ph, y R^2 es Br.	653C	R^2 es Br.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2
615	R^2 es Me.	654	es Me.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2
616	R^2 es Cl.	655	es Cl.
617	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y	656	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^2

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	R^2 es Br.		es Br.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y R^2
618	R^2 es Me.	657	es Me.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl -4-CN-Ph, y
619	R^2 es Cl.	658	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl -4-CN-Ph, y
620	R^2 es Br.	659	R^2 es Br.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^2
621	R^2 es Me.	660	es Me.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br -4-CN-Ph, y
622	R^2 es Cl.	661	R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^2
623	R^2 es Br.	662	es Br.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y R^2		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
624	es Me.	663	piridinilo, y R^2 es Me.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y R^2		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
625	es Cl.	664	piridinilo, y R^2 es Cl.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y R^2		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
626	es Br.	665	piridinilo, y R^2 es Br.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
627	Me.	666	R^2 es Me.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
628	Cl.	667	R^2 es Cl.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
629	Q^1 es 2-F-Ph, y R^2 es Br.	668	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y R^2 es Br.
630	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2 es Me.	669	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, y R^2 es Me.
631	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2 es Cl.	670	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, y R^2 es Cl.
632	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^2 es Br.	671	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, y R^2 es Br.
633	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^2 es Me.		

Los compuestos de las Tablas 588 a 671 ilustran compuestos de la Fórmula **2**, en donde X es NH que son intermedios útiles para preparar compuestos de la Fórmula **1** con el método del Esquema 2.

Tabla 672



G^1 es -OH.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

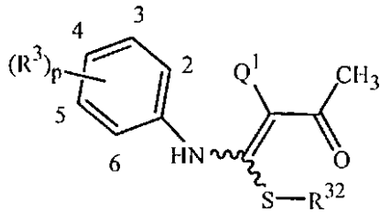
La presente descripción incluye, además, las Tablas 673 a 676; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 672 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 672 (es decir, "G^1 es -OH") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 673, el encabezamiento de la fila es "G^1 es -SH" y Q^1 es tal como se definió en la Tabla 672

anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 673 describe específicamente 4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-tiol. Las Tablas 674 a 676 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
673	G^1 es -SH.	675A	G^1 es I.
674	G^1 es Cl.	676	G^1 es $-NH_2$.
675	G^1 es Br.		

Los compuestos de las Tablas 672 y 673 ilustran compuestos de la Fórmula **4**, en donde X es O o S, cada R^1 y R^{1a} es H y R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos de la Fórmula **1** con el método del Esquema 3. Los compuestos de la Tabla 672 ilustran, además, compuestos de la Fórmula **4b**, en donde cada R^1 y R^{1a} es H y R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **6a** con el método del Esquema 6 y para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **6b** con el método del Esquema 7. Las Tablas 674 y 675 ilustran los compuestos de la Fórmula **6**, en donde G es Cl o Br y cada R^{1a} es H y R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos de la Fórmula **1c** con el método del Esquema 4. La Tabla 676 ilustra compuestos de la Fórmula **4a**, en donde cada R^1 y R^{1a} es H y R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **6** con el método del Esquema **5**.

Tabla 677



Q^1 es 2,6-di-F-Ph y R^{32} es Me.

$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$	$(R^3)_p$
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	$2-CF_3$-4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-	2-Cl-4-

			Cl	Br-6-F

La presente descripción incluye, además, las Tablas 678 a 704; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la Tabla 677 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 677 (es decir, "Q^1 es 2,6-di-F-Ph") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 2 el encabezamiento de la fila es "Q^1 es 2,4-di-F-Ph " y $(R^3)_p$ es tal como se definió en la Tabla 677 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 678 describe específicamente 3-(2,6-difluorofenil)-4-[(2,4-difluorofenil)amino]-4-(metiltio)-3-buten-2-ona. Las Tablas 679 a 704 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
678	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^{32} es Me.	721	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^{32} es Et.
679	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^{32} es Me.	722	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^{32} es Et.
680	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y R^{32} es Me.	723	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^{32} es Et.
680A	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, y R^{32} es Me.	724	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^{32} es Et.
681	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, y R^{32} es Me.	724A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^{32} es Et.
682	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y	725	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	R^{32} es Me.		R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y
683	R^{32} es Me.	725A	R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y
684	Ph, y R^{32} es Me.	726	R^{32} es Et.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y
685	Ph, y R^{32} es Me.	726A	R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^{32}
686	R^{32} es Me.	727	es Et.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y R^{32}
687	R^{32} es Me.	728	es Et.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^{32}
688	R^{32} es Me.	729	es Et.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
689	R^{32} es Me.	730	piridinilo, y R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^{32}		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
690	es Me.	731	R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^{32}		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
691	es Me.	732	tienilo, y R^{32} es Et.
	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^{32}		Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^{32}
692	es Me.	733	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^{32}
693	R^{32} es Me.	734	es *n*-Pr.

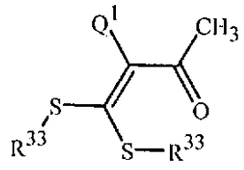
Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y
694	R^{32} es Me.	735	R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph,
695	R^{32} es Me.	736	y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph,
696	R^{32} es Me.	736A	y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y		Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph,
696A	R^{32} es Me.	737	y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y R^{32}
697	y R^{32} es Me.	738	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y R^{32}
697A	y R^{32} es Me.	739	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph,		Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-Ph,
698	y R^{32} es Me.	740	y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph,		Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-Ph,
698A	y R^{32} es Me.	741	y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y R^{32}
699	R^{32} es Me.	742	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y R^{32}
700	R^{32} es Me.	743	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y		Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y R^{32}
701	R^{32} es Me.	744	es *n*-Pr.
702	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-	745	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y R^{32}

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	piridinilo, y R^{32} es Me.		es *n*-Pr.
703	Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y R^{32} es Me.	746	Q^1 es 2-F-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
704	Q^1 es 2,5-di-Cl-3-tienilo, y R^{32} es Me.	747	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
705	Q^1 es 2,6-di-F-Ph, y R^{32} es Et.	748	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
706	Q^1 es 2,4-di-F-Ph, y R^{32} es Et.	749	Q^1 es 2-F-4-Cl-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
707	Q^1 es 2,4,6-tri-F-Ph, y R^{32} es Et.	750	Q^1 es 2,4-di-Cl-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
708	Q^1 es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, y R^{32} es Et.	751	Q^1 es 2,6-di-Cl-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
708A	Q^1 es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, y R^{32} es Et.	752	Q^1 es 2-F-4-MeO-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
709	Q^1 es 2,6-di-F-4-CN-Ph, y R^{32} es Et.	752A	Q^1 es 2-F-4-EtO-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
710	Q^1 es 2-Cl-4-F-Ph, y R^{32} es Et.	753	Q^1 es 2-Cl-4-MeO-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
711	Q^1 es 2-Cl-6-F-Ph, y R^{32} es Et.	753A	Q^1 es 2-Cl-4-EtO-Ph, y R^{32} es *n*-Pr.
712	Q^1 es 2-Cl-4,6-di-F-	754	Q^1 es 2-Br-4-MeO-Ph, y

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Ph, y R^{32} es Et.		R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 4-Cl-2,6-di-F-		Q^1 es 2-Br-4-EtO-Ph, y
713	Ph, y R^{32} es Et.	754A	R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-F-4-CN-Ph, y R^{32}
714	R^{32} es Et.	755	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-6-F-Ph, y		Q^1 es 2-Cl-4-CN-Ph, y R^{32}
715	R^{32} es Et.	756	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Me-4-F-Ph, y		Q^1 es 2-Br-4-CN-Ph, y R^{32}
716	R^{32} es Et.	757	es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-I-4-F-Ph, y		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
	R^{32} es Et.		piridinilo, y R^{32} es *n*-
717		758	Pr.
	Q^1 es 2-F-Ph, y R^{32}		Q^1 es 2-Cl-3-tienilo, y
718	es Et.	759	R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Cl-Ph, y R^{32}		Q^1 es 2,5-di-Cl-3-
719	es Et.	760	tienilo, y R^{32} es *n*-Pr.
	Q^1 es 2-Br-Ph, y R^{32}		
720	es Et.		

Los compuestos de las Tablas 677 a 760 ilustran compuestos de la Fórmula **17**, en donde R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos de la Fórmula **1c** con el método del Esquema 16.

Tabla 761



Cada R^{33} es Me.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

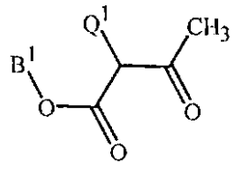
La presente descripción incluye, además, las Tablas 762 a 764; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que la

Tabla 761 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 761 (es decir, "Cada R^{33} es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 762 el encabezamiento de la fila es "Cada R^{33} es Et" y Q^1 es tal como se definió en la Tabla 761 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 762 describe específicamente 3-(2,6-difluorofenil)-4,4-bis(etiltio)-3-buten-2-ona. Las Tablas 763 y 764 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
	Cada R^{33} es Et.		Los dos R^{33} se toman
762		764	juntos como $-CH_2-$.
763	Cada R^{33} es *n*-Pr.		

Los compuestos de las Tablas 761 a 763 ilustran compuestos de la Fórmula **18**, en donde R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **17** con el método del Esquema 17. Los compuestos de la Tabla 764 ilustran compuestos de la Fórmula **18**, en donde R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **4c** con el método descrito a continuación en el Esquema 17.

Tabla 765



B^1 es Me.

Q^1	Q^1	Q^1	Q^1
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

La presente descripción incluye, además, las Tablas 766 a 769; cada una de ellas se estructuró de la misma manera que

la Tabla 765 anterior, excepto que el encabezamiento de la fila en la Tabla 765 (es decir, "B^1 es Me") se reemplazó por el encabezamiento de la fila respectiva que se muestra más abajo. Por ejemplo, en la Tabla 766 el encabezamiento de la fila es "B^1 es Et" y Q^1 es tal como se definió en la Tabla 765 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 766 describe específicamente α-acetil-2,6-difluorobencenoacetato de etilo. Las Tablas 767 a 769 se construyeron de manera similar.

Tabla	Título de la fila	Tabla	Título de la fila
766	B^1 es Et.	768	B^1 es Ph.
767	B^1 es *n*-Pr.	769	B^1 es CH_2Ph.

Los compuestos de las Tablas 765 a 769 ilustran compuestos de la Fórmula **16**, en donde R^2 es CH_3 que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de la Fórmula **4b** con el método del Esquema 14.

Formulación/uso

Un compuesto de esta invención se usará, generalmente, como un ingrediente fungicida activo en una composición, es decir, formulación, con por lo menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos útiles como portador. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan de acuerdo con las propiedades físicas del

ingrediente activo, el modo de aplicación y factores ambientales, tales como tipo de suelo, humedad y temperatura.

Las formulaciones útiles incluyen composiciones líquidas y sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (que incluyen concentrados emulsificables), suspensiones, emulsiones (que incluyen microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares que, opcionalmente, pueden espesarse para formar geles. Los tipos comunes de composiciones líquidas acuosas son concentrados solubles, concentrados de suspensión, suspensión en cápsulas, emulsión, microemulsión y suspoemulsión. Los tipos comunes de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión oleosa.

Los tipos comunes de composiciones sólidas son polvos, gránulos, microesferas, glóbulos, pastillas, tabletas, películas con carga (que incluyen recubrimientos para semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y recubrimientos que se forman a partir de las soluciones formadoras de películas o suspensiones autodispersables son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo se puede (micro)encapsular y, después, convertir en una suspensión o formulación sólida; Alternativamente, se puede encapsular (o "recubrir") la

formulación completa del ingrediente activo. La encapsulación puede controlar o retardar la liberación del ingrediente activo. Los gránulos emulsificables combinan las ventajas de las formulaciones concentradas emulsionables y de las formulaciones de gránulos secos. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para más formulaciones.

Generalmente, las formulaciones atomizables se extienden en un medio apropiado antes de atomizar. Estas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio atomizador, comúnmente, agua. Los volúmenes de aerosol pueden variar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea pero, más típicamente, se encuentran en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones atomizables pueden mezclarse en un tanque con agua u otro medio adecuado para tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de cultivo de la planta. Las formulaciones líquidas y secas se pueden dosificar directamente en los sistemas de irrigación por goteo o en los surcos durante la siembra. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos y otra vegetación que se desee como tratamientos de semillas antes de la siembra para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o follaje por absorción sistémica.

Generalmente, las formulaciones contienen cantidades eficaces de un ingrediente activo, diluyente y surfactante dentro de los siguientes intervalos aproximados que equivalen al 100 por ciento en peso.

	Porcentaje en peso		
	Ingrediente		
	Activo	Diluyente	Surfactante
Gránulos, tabletas y polvos dispersables y solubles en agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Soluciones, emulsiones, suspensiones y dispersiones oleosas (que incluyen concentrados emulsificables)	1-50	40-99	0-50
Polvos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y comprimidos	0,001-95	5-99,999	0-15
Composiciones de alta resistencia	90-99	0-10	0-2

Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas, tales como bentonita, montmorillonita, atapulguita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato cálcico,

carbonato sódico y bicarbonato, y sulfato de sodio. Los diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2.° ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetilo, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarburos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos y γ-butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico,

isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, diacetona-alcohol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos incluyen, además, ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (generalmente, C_6-C_{22}), tales como aceites de semillas de plantas y frutos (por ejemplo, aceites de oliva, castor, linaza, ajonjolí, maíz, cacahuate, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, frijol de soja, semilla de colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (por ejemplo, sebo de res, sebo porcino, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado), y mezclas de estos. Los diluyentes líquidos incluyen, además, ácidos grasos alquilatados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados), en donde los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol de origen animal y vegetal, y pueden purificarse por destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, *Solvents Guide*, 2.° ed., Interscience, New York, 1950.

Las composiciones líquidas y sólidas de la presente invención incluyen, frecuentemente, uno o más surfactantes. Generalmente, cuando se adicionan a un líquido, los surfactantes (también conocidos como "agentes tensoactivos") modifican y, con mayor frecuencia, reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los

grupos hidrófilo y lipófilo en una molécula surfactante, los surfactantes pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes desespumantes.

Los surfactantes pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los surfactantes no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no se limitan a: alcoxilatos de alcohol, tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados, tales como aceites etoxilados de frijol de soja, semilla de colza y ricino; alcoxilatos de alquilfenol, tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y el óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos, en donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres grasos y aceites etoxilados; ésteres de metilo etoxilados; tristirilfenol etoxilado (incluso los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de

butileno o mezclas de estos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerina, derivados a base de lanolina, ésteres de polietoxilato, tales como ésteres de ácido graso de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácido graso de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácido graso de glicerina polietoxilados; otros derivados de sorbitán, tales como ésteres de sorbitán; surfactantes poliméricos, tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas de peg (polietilenglicol) alquídicas, polímeros de injerto o tipo peine y polímeros en forma de estrella; polietilenglicoles (peg); ésteres de ácido graso de polietilenglicol; surfactantes a base de silicona; y derivados del azúcar, tales como ésteres de sacarosa, poliglicósidos de alquilo y polisacáridos de alquilo.

Los surfactantes aniónicos incluyen, pero no se limitan a: ácidos sulfónicos de alquilarilo y sus sales; alcohol carboxilado o etoxilatos de alquilfenol; derivados del sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina, tales como lignosulfonatos; ácido maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato, tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilo fenol; surfactantes a base de proteínas; derivados de sarcosina; éter sulfato de estirilfenol; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos

grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas, tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil y tridecilbenceno; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados, tales como sales de sulfosuccinato de dialquilo.

Los surfactantes catiónicos incluyen, pero no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas, tales como propanodiaminas de *N*-alquilo, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); sales de aminas, tales como acetatos de aminas y sales de diaminas; sales de amonio cuaternario, tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina, tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.

Además, son útiles para las presentes composiciones las mezclas de surfactantes no iónicos y aniónicos o mezclas de surfactantes no iónicos y catiónicos. Los surfactantes no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas que

incluyen *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ediciones anuales americanas e internacionales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, *Enciclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, 7.° ed., John Wiley y Sons, Nueva York, 1987,

Las composiciones de esta invención también pueden contener auxiliares y aditivos para formulaciones, conocidos por los experimentados en la técnica como auxiliares de formulación (puede considerarse que algunos de estos pueden funcionar como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o surfactantes). Tales auxiliares y aditivos de formulaciones pueden controlar: el pH (soluciones tampón), la producción de espuma durante el procesamiento (antiespumantes, tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de los ingredientes activos (agentes de suspensión), la viscosidad (aglomerantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano en el envase (antimicrobianos), la congelación de los productos (anticongelantes), el color (dispersiones de tintes/pigmentos), la eliminación por lavado (formadores o adhesivos de películas), la evaporación (retardantes de evaporación) y otros atributos de las formulaciones. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, acetatos de polivinilo, copolímeros de acetato de polivinilo, copolímero de polivinilpirrolidona-

acetato de vinilo, alcoholes polivinílicos, copolímeros y ceras de alcohol polivinílico. Los ejemplos de auxiliares y aditivos de formulación incluyen los mencionados en el *Volumen 2 de McCutcheon: Functional Materials*, ediciones anuales norteamericanas e internacionales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la publicación del PCT núm. WO 03/024222.

Generalmente, el compuesto de Fórmula **1** y cualquier otro ingrediente activo se incorporan en las presentes composiciones al disolver el ingrediente activo en un solvente o al molerlo en un diluyente líquido o seco. Las soluciones, incluso los concentrados emulsionables, pueden prepararse simplemente al mezclar los ingredientes. Si el solvente de una composición líquida destinada para usarse como concentrado emulsificable es inmiscible en agua se añade, típicamente, un emulsionante para emulsificar el solvente que contiene el activo después de diluirlo con agua. Las lechadas de ingredientes activos con diámetros de partícula de hasta 2000 µm se pueden moler en húmedo mediante el uso de molinos de medios a fin de obtener partículas con diámetros promedio menores que 3 µm. Las lechadas acuosas se pueden convertir en concentrados en suspensión terminados (véase, por ejemplo, la patente de los Estados Unidos núm. 3.060.084) o se pueden procesar adicionalmente con secado por aspersión para formar gránulos dispersables en agua. Usualmente, las formulaciones

secas requieren procesos de molienda en seco, que producen diámetros promedio de partícula en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos pueden prepararse por mezclado y, generalmente, por trituración (tal como con un molino de martillo o un molino con energía fluida). Los gránulos y microesferas pueden prepararse por medio de la atomización del material activo sobre portadores granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Véanse Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, 4 de diciembre de 1967, págs. 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4.° ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y la patente núm. WO 91/13546. Los comprimidos se pueden preparar tal como se describe en la patente de los Estados Unidos núm. 4.172.714. Los gránulos dispersables y solubles en agua se pueden preparar según las enseñanzas de las patentes de los Estados Unidos núms. 4.144.050 y 3.920.442, y la patente alemana núm. DE 3.246.493. Las tabletas se pueden preparar según las enseñanzas de las patentes de los Estados Unidos núms. 5.180.587; 5.232.701 y 5.208.030. Las películas se pueden preparar según las enseñanzas de la patente británica núm. 2.095.558 y la patente de los Estados Unidos núm. 3.299.566.

Para obtener mayor información con respecto a la técnica de formulación, véanse T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture"

en Pesticide Chemistry y Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Véase también la patente de los Estados Unidos núm. 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19, y los Ejemplos 10-41; la patente de los Estados Unidos núm. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62, y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; la patente de los Estados Unidos núm. 2.891.855, de la col. 3, línea 66 a col. 5, línea 17, y los Ejemplos 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, págs. 81-96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8.° Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

En los ejemplos siguientes, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones están preparadas de manera convencional. Los números de los compuestos se refieren a los compuestos en la Tabla índice A. Sin entrar en otros detalles innecesarios, se considera que, basándose en la descripción precedente, un experimentado en la técnica podrá usar al máximo la presente invención. Por lo tanto, los siguientes ejemplos se interpretarán como solamente ilustrativos, sin

limitar la descripción en ningún sentido. Los porcentajes son en peso, excepto donde se indique de otra manera.

Ejemplo A

Concentrado de alta resistencia

Compuesto 18	98,5 %
Aerogel de sílice	0,5 %
Sílice sintético fino y amorfo	1,0 %

Ejemplo B

Polvo humectable

Compuesto 22	65,0 %
Dodecilfenol polietilenglicol éter	2,0 %
Sulfonato sódico de lignina	4,0 %
Aluminosilicato de sodio	6,0 %
Montmorillonita (calcinada)	23,0 %

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 23	10,0 %
Gránulos de attapulguita (materia con baja volatilidad, 0,71/0,30 mm; tamices de los EE.UU. núms. 25-50)	90,0 %

Ejemplo D

Microesfera extrudida

Compuesto 24	25,0 %
Sulfato sódico anhidro	10,0 %
Sulfonato de lignina de calcio crudo	5,0 %
Alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0 %
Bentonita de calcio/magnesio	59,0 %

Ejemplo E

Concentrado emulsificable

Compuesto 36	10,0 %
Hexaoleato de sorbitol polioxietilenado	20,0 %
Éster metílico de ácidos grasos de C_6–C_{10}	70,0 %

Ejemplo F

Microemulsión

Compuesto 41	5,0 %
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0 %
Alquilpoliglicósido	30,0 %
Monooleato de glicerilo	15,0 %
Agua	20,0 %

Ejemplo G

Tratamiento de la semilla

Compuesto 45	20,00 %
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00 %
Ácido de cera de montana	5,00 %
Sulfonato de lignina de calcio	1,00 %
Copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno	1,00 %
Alcohol estearílico (POE 20)	2,00 %
Poliorganosilano	0,20 %
Colorante rojo/tintura	0,05 %
Agua	65,75 %

Las formulaciones, tales como las de la tabla de formulación, se diluyen, típicamente, con agua para formar composiciones acuosas antes de la aplicación. Las composiciones acuosas para aplicarse directamente a la planta o a una parte de esta (por ejemplo, composiciones de depósito de aspersión) comprenden, típicamente, al menos aproximadamente 1 ppm o más (por ejemplo, de 1 ppm a 100 ppm) de uno o más compuestos de esta invención.

Los compuestos de esta invención son útiles como agentes de control de enfermedades de las plantas. Por lo tanto, la presente invención comprende, además, un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas; el método comprende aplicar a la planta o a una porción de esta que se

protegerá, o a la semilla de la planta que se protegerá, una cantidad eficaz de un compuesto de la invención o una composición fungicida que contiene ese compuesto. Los compuestos y/o las composiciones de esta invención proporcionan control de enfermedades causadas por un amplio espectro de patógenos fúngicos de las plantas de las clases Basidiomyceto, Ascomyceto, Oomyceto y Deuteromyceto. Son eficaces para controlar un amplio espectro de enfermedades de las plantas, particularmente, los patógenos foliares de cultivos ornamentales, vegetales, extensivos, cerealeros, frutales y de césped. Los patógenos incluyen: Oomycetos, que incluyen enfermedades causadas por *Phytophthora*, tales como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* y *Phytophthora capsici*, enfermedades causadas por *Pythium*, tal como *Pythium aphanidermatum*, y enfermedades de la familia de Peronosporaceae, tales como *Plasmopara viticola*, esp. *Peronospora* (que incluye *Peronospora tabacina* y *Peronospora parasitica*), esp. *Pseudoperonospora* (que incluye *Pseudoperonospora cubensis*) y *Bremia lactucae*; Ascomycetos, que incluyen enfermedades causadas por *Alternaria*, tales como *Alternaria solani* y *Alternaria brassicae*, enfermedades de *Guignardia*, tal como *Guignardia bidwell*, enfermedades de *Venturia*, tal como *Venturia inaequalis*, enfermedades de *Septoria*, tales como *Septoria nodorum* y *Septoria tritici*,

enfermedades causadas por el oídio, tal como la esp. *Erysiphe* (que incluye *Erysiphe graminis* y *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necatur*, *Sphaerotheca fuligena* y *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercosporella herpotrichoides*, enfermedades de *Botrytis*, tal como *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, enfermedades de *Sclerotinia*, tal como *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, enfermedades de *Helminthosporium*, tal como *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, enfermedades de antracnosis, tal como la esp. *Glomerella* o *Colletotrichum* (tales como *Colletotrichum graminicola* y *Colletotrichum orbiculare*), y *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomycetos, que incluyen enfermedades de roya causadas por la esp. *Puccinia* (tales como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* y *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* y *Phakopsora pachyrhizi*; otros patógenos que incluyen *Rutstroemia floccosum* (conocido además como *Sclerontina homoeocarpa*); esp. *Rhizoctonia* (tal como *Rhizoctonia solani*); enfermedades de *Fusarium*, tal como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* y *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* y *Cercospora beticola*; y otros géneros y especies muy relacionados con estos patógenos. Además de su actividad fungicida, las composiciones o

composiciones tienen, además, actividad contra bacterias, tales como *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae* y otras especies relacionadas.

El control de enfermedades de las plantas se alcanza, comúnmente, mediante la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de la presente invención, antes o después de la infección, a una porción de la planta a protegerse, tales como raíces, tallos, follaje, frutos, semillas, tubérculos o bulbos, o a los medios (tierra o arena) en los cuales crecen las plantas a protegerse. Los compuestos también pueden aplicarse a las semillas para proteger las semillas o las plántulas que crecen de ellas. Los compuestos también pueden aplicarse mediante agua de irrigación para tratar las plantas.

Por consiguiente, este aspecto de la presente invención puede describirse, además, como un método para proteger una planta o la semilla de una planta contra enfermedades causadas por patógenos fúngicos; el método comprende aplicar una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la Fórmula **1**, un *N*-óxido o sal de estos a la planta (o partes de esta) o semilla de la planta (directamente o a través del ambiente (por ejemplo, el medio de crecimiento de la planta o semilla de la planta).

Las concentraciones de aplicación para estos compuestos pueden estar afectadas por muchos factores del ambiente y deberían determinarse en las condiciones de uso reales.

Normalmente, el follaje puede protegerse cuando se trata con una concentración de menos de aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5.000 g/ha de ingrediente activo. Las semilla y las plántulas pueden protegerse, normalmente, cuando la semilla se trata con una concentración de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.

Los compuestos de esta invención también pueden mezclarse con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento, tales como inhibidores de muda de los insectos y estimulantes radiculares, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, nutrientes de las plantas, bacterias, virus u hongos entomopatogénicos u otros compuestos biológicamente activos para formar un pesticida multicomponente que ofrece un espectro aún más amplio de protección agrícola. Así, la presente invención está relacionada, además, con una composición que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la Fórmula **1** y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un agente o compuesto biológicamente activo adicional y puede comprender, además, al menos un surfactante, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los otros compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse en composiciones que comprenden por lo menos uno de un

surfactante, diluyente sólido o líquido. Para las mezclas de la presente invención pueden formularse uno o más de otros agentes o compuesto biológicamente activos con un compuesto de la Fórmula **1** con el fin de formar una premezcla, o uno o más de otros agentes o compuestos biológicamente activos pueden formularse en forma separada a partir del compuesto de la Fórmula **1**, y las formulaciones pueden combinarse antes de la aplicación (por ejemplo, en un depósito de aspersión) o, alternativamente, aplicarse en sucesión.

Como se mencionó en la Breve descripción de la invención, un aspecto de la presente invención es una composición fungicida que comprende (es decir, una mezcla o combinación de) un compuesto de la Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal de estos (es decir, componente a) y al menos otro fungicida (es decir, componente b).

Destaca una composición que, además del compuesto de la Fórmula **1** del componente (a), incluye como componente (b) al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste de las clases (b1) fungicidas de metil benzimidazol carbamato (MBC); (b2) fungicidas de dicarboximida; (b3) fungicidas inhibidores de la demetilación (DMI); (b4) fungicidas de fenilamida; (b5) fungicidas de amina/morfolina; (b6) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos; (b7) fungicidas de carboxamida; (b8) fungicidas de hidroxi(2-amino-)pirimidina; (b9)

fungicidas de anilinopirimidina; (b10) fungicidas de *N*-fenil carbamato; (b11) fungicidas inhibidores externos de la quinona (QoI); (b12) fungicidas de fenilpirrol; (b13) fungicidas de quinolina; (b14) fungicidas inhibidores de la peroxidación de lípidos; (b15) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R); (b16) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-deshidratasa (MBI-D); (b17) fungicidas de hidroxianilida; (b18) fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa; (b19) fungicidas de polioxina; (b20) fungicidas de fenilurea; (b21) fungicidas inhibidores internos de la quinona (QiI); (b22) fungicidas de benzamida; (b23) fungicidas antibióticos de ácido enopiranurónico; (b24) fungicidas antibióticos de hexopiranosilo; (b25) antibiótico de glucopiranosilo: fungicidas de síntesis de proteínas; (b26) antibiótico de glucopiranosilo: fungicidas de biosíntesis de trehalasa e inositol; (b27) fungicidas de cianoacetamidaoxima; (b28) fungicidas de carbamato; (b29) fungicidas de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa; (b30) fungicidas órgano estánicos; (b31) fungicidas de ácido carboxílico; (b32) fungicidas heteroaromáticos; (b33) fungicidas de fosfonato; (b34) fungicidas de ácido ftalámico; (b35) fungicidas de benzotriazina; (b36) fungicidas de benceno-sulfonamida; (b37) fungicidas de piridazinona; (b38) fungicidas de tiofeno-carboxamida; (b39) fungicidas de pirimidinamida;

(b40) fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA); (b41) fungicidas antibióticos de tetraciclina; (b42) fungicidas de tiocarbamato; (b43) fungicidas de benzamida; (b44) fungicidas de inducción de defensa de la planta huésped; (b45) fungicidas de contacto multisitio; (b46) fungicidas que no son fungicidas de las clases (b1) a (b45); y sales de los compuestos de las clases (b1) a (b46).

A continuación se proporcionan las descripciones de estas clases de compuestos fungicidas.

(b1) Los "Fungicidas de metil benzimidazol carbamato (MBC)" (código 1 del Fungicide Resistance Action Committee (FRAC)) inhiben la mitosis al unirse a la β-tubulina durante el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de los microtúbulos puede interrumpir la división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los fungicidas de metil benzimidazol carbamato incluyen fungicidas de benzimidazol y tiofanato. Los benzimidazoles incluyen benomilo, carbendazim, fuberidazol y tiabendazol. Los tiofanatos incluyen tiofanato y tiofanato-metilo.

(b2) Los "fungicidas de dicarboximida" (código 2 del FRAC) se proponen para inhibir una peroxidación de lípidos en hongos mediante la interferencia con NADH citocromo C reductasa. Los ejemplos incluyen clozolinato, iprodiona, procimidona y vinclozolin.

(b3) Los "fungicidas inhibidores de la demetilación (DMI)" (código 3 del FRAC) inhiben la C14-demetilasa la cual cumple una función en la producción de esteroles. Los esteroles, tales como ergosterol, se necesitan para la función y estructura de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de las paredes de las células funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas resulta en el crecimiento anormal y, eventualmente, la muerte de los hongos sensibles. Los fungicidas DMI se dividen en varias clases químicas: azoles (que incluyen triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (que incluye diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz, pefurazoato y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones

bioquímicas mostraron que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI, como describe K. H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

(b4) Los "fungicidas de fenilamida" (código 4 del FRAC) son inhibidores específicos del ARN polimerasa en hongos Oomycetos. Los hongos sensibles expuestos a estos fungicidas muestran una capacidad reducida para incorporar uridina en el ARNr. La exposición a esta clase de fungicidas evita el crecimiento y desarrollo en hongos sensibles. Los fungicidas de fenilamida incluyen fungicidas acilalanina, oxazolidinona y butirolactona. Las acilalaninas incluyen benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, metalaxil, metalaxil-M (conocido además como mefenoxam). Las oxazolidinonas incluyen oxadixil. Las butirolactonas incluyen ofurace.

(b5) Los "fungicidas de amina/morfolina" (código 5 del FRAC) inhiben dos sitios destino dentro de la ruta biosintética del esterol, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerasa y Δ^{14} reductasa. Los esteroles, tales como ergosterol, se necesitan para la función y estructura de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de las paredes de las células funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas produce el crecimiento anormal y, eventualmente, la muerte

de los hongos sensibles. Los fungicidas de amina/morfolina (también conocidos como inhibidores de la biosíntesis de esteroles no DMI) incluyen los fungicidas de morfolina, piperidina y espirocetalamina. Las morfolinas incluyen aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida.. Las piperidinas incluyen fenpropidina y piperalina. Las espirocetalaminas incluyen espiroxamina.

(b6) Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos" (código 6 del FRAC) inhiben el crecimiento de hongos al afectar la biosíntesis de fosfolípidos. Los fungicidas de biosíntesis de fosfolípidos incluyen fungicidas de fosforotiolato y ditiolano. Los fosforotiolatos incluyen edifenfós, iprobenfós y pirazofós. Los ditiolanos incluyen isoprotiolano.

(b7) Los "fungicidas de carboxamida" (código 7 del FRAC) inhiben el Complejo II (succinato deshidrogenasa) de la respiración fúngica mediante la interrupción de una enzima clave en el ciclo de Krebs (ciclo del ATC) denominada succinato deshidrogenasa. La inhibición de la respiración evita que el hongo produzca ATP y, por lo tanto, inhibe el crecimiento y la reproducción. Los fungicidas de carboxamida incluyen benzamida, furan carboxamida, oxatiin carboxamida, tiazol carboxamida, pirazol carboxamida y piridin carboxamida. Las benzamidas incluyen benodanil, flutolanil y mepronil. Las

furan carboxamidas incluyen fenfuram. Las oxatiin carboxamidas incluyen carboxin y oxicarboxin. Las tiazol carboxamidas incluyen tifluzamida. Las pirazol carboxamidas incluyen bixafeno, furametpir, isopirazam, fluxapiroxad, sedaxane (*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-bicicloprópil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida) y penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (publicación de patente del PCT núm. WO 2003/010149)). Las piridin carboxamidas incluyen boscalid.

(b8) Los "fungicidas de hidroxi(2-amino-)pirimidina" (código 8 del FRAC) inhiben la síntesis de ácido nucleico al interferir con la adenosina deaminasa. Los ejemplos incluyen bupirimato, dimetirimol y etirimol.

(b9) Los "fungicidas de anilinopirimidina" (código 9 del FRAC) se proponen para inhibir la biosíntesis de la metionina del aminoácido y para interrumpir la secreción de enzimas hidrolíticas que producen la lisis de las células de las plantas durante la infección. Los ejemplos incluyen ciprodinil, mepanipirim y pirimetanil.

(b10) Los "fungicidas de N-fenil carbamato" (código 10 del FRAC) inhiben la mitosis al unirse a la β-tubulina y al interrumpir el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de los microtúbulos puede interrumpir la

división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los ejemplos incluyen dietofencarb.

(b11) Los "fungicidas inhibidores externos de la quinona (QoI)" (código 11 del FRAC) inhiben la respiración mitocondrial del Complejo III en hongos al afectar la ubiquinol oxidasa. La oxidación de ubiquinol se bloquea en el sitio "externo de la quinona" (Q_o) del complejo citocromo bc_1, el cual se ubica en la membrana mitocondrial interior de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial evita el crecimiento y el desarrollo normal de los hongos. Los fungicidas inhibidores externos de la quinona (también conocidos como fungicidas de estrobilurina) incluyen fungicidas de metoxiacrilato, metoxicarbamato, oximinoacetato, oximinoacetamida, oxazolidinadiona, dihidrodioxazina, imidazolinona y bencilcarbamato. Los metoxiacrilatos incluyen azoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071) y picoxistrobina. Los metoxicarbamatos incluyen piraclostrobina y pirametostrobina. Los oximinoacetatos incluyen cresoxim-metilo, piraoxistrobina y trifloxistrobina. Las oximinoacetamidas incluyen dimoxistrobina, metominostrobina, orisastrobina, α-[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]bencenacetamida y 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-iliden]amino]oxi]metil]-α-(metoxiimino)-*N*-metilbencenacetamida.

Las oxazolidinadionas incluyen famoxadona. Las dihidrodioxazinas incluyen fluoxastrobina. Las imidazolinonas incluyen fenamidona. Los bencilcarbamatos incluyen piribencarb.

(b12) Los "fungicidas de fenilpirrol" (código 12 del FRAC) inhiben una proteína MAP quinasa asociada con la transducción de señal osmótica en los hongos. El fenpiclonil y el fludioxonil son ejemplos de esta clase de fungicidas.

(b13) Los "fungicidas de quinolina" (código 13 del FRAC) se proponen para inhibir la transducción de señales al afectar las proteínas G en la señalización temprana de células. Se ha demostrado que interfieren con la germinación y/o formación del apresorio en los hongos que causan oídio. El quinoxifeno es un ejemplo de esta clase de fungicidas.

(b14) Los "fungicidas inhibidores de la peroxidación de lípidos" (código 14 del FRAC) se proponen para inhibir la peroxidación de lípidos, la cual afecta la síntesis de las membranas en los hongos. Los miembros de esta clase, tales como etridiazol, podrían afectar otros procesos biológicos, tales como la respiración y la biosíntesis de la melanina. Los fungicidas de peroxidación de lípidos incluyen fungicidas de carbono aromático y 1,2,4-tiadiazol. Los fungicidas de carbono aromático incluyen bifenil, cloroneb, dicloran, quintoceno, tecnaceno y metil tolcoflos. Los fungicidas de 1,2,4-tiadiazol incluyen etridiazol.

(b15) Los fungicidas "inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R)" (código 16.1 del FRAC) inhiben la etapa de reducción del naftal en la biosíntesis de melanina. La melanina se requiere para la infección de plantas huéspedes por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa incluyen fungicidas de isobenzofuranona, pirroloquinolinona y triazolobenzotiazol. Las isobenzofuranonas incluyen ftalida. Las pirroloquinolinonas incluyen piroquilona. Los triazolobenzotiazoles incluyen triciclazol.

(b16) Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-deshidratasa (MBI-D)" (código 16.2 del FRAC) inhiben la escitalona deshidratasa en la biosíntesis de melanina. La melanina se requiere para la infección de plantas huéspedes por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-deshidratasa incluyen fungicidas de ciclopropanocarboxamida, carboxamida y propionamida. Las ciclopropanocarboxamidas incluyen carpropamida. Las carboxamidas incluyen diclocimet. Las propionamidas incluyen fenoxanil.

(b17) Los "fungicidas de hidroxianilida" (código 17 del FRAC) inhiben la C4-demetilasa la cual cumple una función en la producción de esteroles. Los ejemplos incluyen fenhexamida.

(b18) Los "fungicidas inhibidores de la escualeno-epoxidasa" (código 18 del FRAC) inhiben la escualeno-

epoxidasa en la ruta de biosíntesis de ergosterol. Los esteroles, tales como ergosterol, se necesitan para la función y estructura de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de las paredes funcionales de las células. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas produce el crecimiento anormal y, eventualmente, la muerte de los hongos sensibles. Los fungicidas inhibidores de la escualeno-epoxidasa incluyen fungicidas de tiocarbamato y alilamina. Los tiocarbamatos incluyen piributicarb. Las alilaminas incluyen naftifina y terbinafina.

(b19) Los "fungicidas de polioxina" (código 19 del FRAC) inhiben la sintasa de la quitina. Los ejemplos incluyen polioxina.

(b20) Los "fungicidas de fenilurea" (código 20 del FRAC) se proponen para afectar la división celular. Los ejemplos incluyen pencicuron.

(b21) Los "fungicidas inhibidores internos de la quinona (QiI)" (código 21 del FRAC) inhiben la respiración mitocondrial del Complejo III en hongos al afectar la ubiquinol reductasa. La reducción de ubiquinol se bloquea en el sitio "interno de la quinona" (Q_i) del complejo citocromo bc_1, el cual se ubica en la membrana mitocondrial interior de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial evita el crecimiento y el desarrollo normal de los hongos. Los fungicidas inhibidores

internos de la quinona incluyen fungicidas de cianoimidazol y sulfamoiltriazol. Los cianoimidazoles incluyen ciazofamida. Los sulfamoiltriazoles incluyen amisulbrom.

(b22) Los "fungicidas de benzamida" (código 22 del FRAC) inhiben la mitosis al unirse a β-tubulina y al interrumpir el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de los microtúbulos puede interrumpir la división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los ejemplos incluyen zoxamida.

(b23) Los "fungicidas antibióticos de ácido enopiranurónico" (código 23 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen blasticidina-S.

(b24) Los "fungicidas antibióticos de hexopiranosilo" (código 24 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen casugamicina.

(b25) Los "antibióticos de glucopiranosilo: fungicidas de la síntesis de proteínas" (código 25 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen estreptomicina.

(b26) Los "antibióticos de glucopiranosilo: fungicidas de biosíntesis de inositol y trehalasa" (código 26 del FRAC)

inhiben la trehalasa en la ruta de biosíntesis del inositol. Los ejemplos incluyen validamicina.

(b27) Los "fungicidas de cianoacetamidaoxima" (código 27 del FRAC) incluyen cimoxanil.

(b28) Los "fungicidas de carbamato" (código 28 del FRAC) se consideran inhibidores multisitio del crecimiento fúngico. Se proponen para interferir con la síntesis de ácidos grasos en las membranas celulares, la cual, después, interrumpe la permeabilidad de la membrana celular. Los ejemplos de esta clase de fungicida incluyen propamacarb, clorhidrato de propamacarb, iodocarb y protiocarb.

(b29) Los "fungicidas de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa" (código 29 del FRAC) inhiben la respiración fúngica al desacoplar la fosforilación oxidativa. La inhibición de la respiración evita el crecimiento y el desarrollo normal de los hongos. Esta clase incluye 2,6-dinitroanilinas, tales como fluazinam, pirimidonahidrazonas, tales como ferimzona, y dinitrofenil crotonatos, tales como dinocap, meptildinocap y binapacril.

(b30) Los "fungicidas organo estánicos" (código 30 del FRAC) inhiben la adenosina trifosfato (ATP) sintasa en la ruta de fosforilación oxidativa. Los ejemplos incluyen acetato de fentina, cloruro de fentina e hidróxido de fentina.

(b31) Los "fungicidas de ácido carboxílico" (código 31 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la topoisomerasa tipo II (girasa) del ácido desoxirribonucleico (ADN). Los ejemplos incluyen ácido oxolínico.

(b32) Los "fungicidas heteroaromáticos" (código 32 del FRAC) se proponen para afectar la síntesis de ADN/ácido ribonucleico (ARN). Los fungicidas heteroaromáticos incluyen fungicidas de isoxazol e isotiazolona. Los isoxazoles incluyen himexazol y las isotiazolonas incluyen octilinona.

(b33) Los "fungicidas de fosfonato" (código 33 del FRAC) incluyen ácido fosforoso y sus sales, que incluyen fosetil-aluminio.

(b34) Los "fungicidas de ácido ftalámico" (código 34 del FRAC) incluyen tecloftalam.

(b35) Los "fungicidas de benzotriazina" (código 35 del FRAC) incluyen triazóxido.

(b36) Los "fungicidas de benceno-sulfonamida" (código 36 del FRAC) incluyen flusulfamida.

(b37) Los "fungicidas de piridazinona" (código 37 del FRAC) incluyen diclomezina.

(b38) Los "fungicidas de tiofeno-carboxamida" (código 38 del FRAC) se proponen para afectar la producción de ATP. Los ejemplos incluyen siltiofam.

(b39) Los "fungicidas de pirimidinamida" (código 39 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la biosíntesis de fosfolípidos e incluyen diflumetorim.

(b40) Los "fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA)" (código 40 del FRAC) se proponen para inhibir la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de las paredes celulares. La inhibición de estos procesos evita el crecimiento y llevan a la muerte del hongo objetivo. Los fungicidas de amida de ácido carboxílico incluyen fungicidas de amida de ácido cinámico, amida de ácido mandélico y valinamida carbamato. Las amidas del ácido cinámico incluyen dimetomorf y flumorf. Los valinamida carbamatos incluyen bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, iprovalicarb y valifenalato (valifenal). Las amidas de ácido mandélico incluyen mandipropamid, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida y *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida.

(b41) Los "fungicidas antibióticos de tetraciclina" (código 41 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos al afectar la nicotinamida adenina dinucleótido (NADH) oxidoreductasa complejo 1. Los ejemplos incluyen oxitetraciclina.

(b42) Los "fungicidas de tiocarbamato (b42)" (código 42 del FRAC) incluyen metasulfocarb.

(b43) Los "fungicidas de benzamida" (código 43 del FRAC) inhiben el crecimiento de los hongos por deslocalización de proteínas similares a la espectrina. Los ejemplos incluyen fungicidas de acilpicolidas, tales como fluopicolida y fluopiram.

(b44) Los "fungicidas de inducción de defensa de la planta huésped" (código P del FRAC) inducen los mecanismos de defensa de la planta huésped. Los fungicidas de inducción de defensa de la planta huésped incluyen fungicidas de benzo-tiadiazol, benzisotiazol y tiadiazol-carboxamida. Los benzo-tiadiazoles incluyen acibenzolar-*S*-metilo. Los benzisotiazoles incluyen probenazol. Los tiadiazol-carboxamidas incluyen tiadinil e isotianil.

(b45) Los "fungicidas de contacto multisitio" inhiben el crecimiento fúngico a través de múltiples sitios de acción y tienen actividad preventiva/de contacto. Esta clase de fungicidas incluye: (b45.1) "fungicidas de cobre" "(código M1 del FRAC)", (b45.2) "fungicidas de azufre" (código M2 del FRAC), (b45.3) "fungicidas de ditiocarbamato" (código M3 del FRAC), (b45.4) "fungicidas de ftalimida" (código M4 del FRAC), (b45.5) "fungicidas de cloronitrilo" (código M5 del FRAC), (b45.6) "fungicidas de sulfamida" (código M6 del

FRAC), (b45.7) “fungicidas de guanidina” (código M7 del FRAC), (b45.8) “fungicidas de triazina” (código M8 del FRAC) y (b45.9) “fungicidas de quinona” (código M9 del FRAC). Los “fungicidas de cobre” son compuestos inorgánicos que contienen cobre, típicamente, en el estado de oxidación del cobre(II); los ejemplos incluyen oxicloruro de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, que incluyen composiciones tales como el caldo bordelés (sulfato de cobre tribásico). Los “fungicidas de azufre” son sustancias químicas inorgánicas que contienen anillos o cadenas de átomos de azufre; los ejemplos incluyen azufre elemental. Los “fungicidas de ditiocarbamato” contienen una porción molecular de ditiocarbamato; los ejemplos incluyen mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, tiram, zineb y ziram. Los “fungicidas de ftalimida” contienen una porción molecular de ftalimida; los ejemplos incluyen folpet, captán y captafol. Los “fungicidas de cloronitrilo” contienen un anillo aromático sustituido con cloro y ciano; los ejemplos incluyen clorotalonil. Los “fungicidas de sulfamida” incluyen diclofluanid y tolifluanid. Los “fungicidas de guanidina” incluyen dodina, guazatina e imoctadina, que incluyen albesilato de iminoctadina y triacetato de iminoctadina. Los “fungicidas de triazina” incluyen anilazina. Los “fungicidas de quinona” incluyen ditianona.

(b46) Los "fungicidas que no son los fungicidas de las clases (b1) a (b45)" incluyen ciertos fungicidas cuyos modos de acción podrían ser desconocidos. Estos incluyen: (b46.1) "fungicidas de tiazol carboxamida" (código U5 del FRAC), (b46.2) "fungicidas de fenil-acetamida" (código U6 del FRAC), (b46.3) "fungicidas de quinazolinona" (código U7 del FRAC) y (b46.4) "fungicidas de benzofenona" (código U8 del FRAC). Las tiazol carboxamidas incluyen etaboxam. Las fenil-acetamidas incluyen ciflufenamida y *N*-[[(ciclopropilmetoxi)amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]-metilen]bencenoacetamida. Las quinazolinonas incluyen proquinazid y 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona. Las benzofenonas incluyen metrafenona y piriofenona. La clase (b46) incluye, además, betoxazina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), fenpirazamina, pirrolnitrina, quinometionato, tebufloquina, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidiniliden]acetonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, 4-fluorofenil *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato, 5-cloro-

6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, *N*-[[(ciclopropilmetoxi)amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metilen]bencenoacetamida, *N*'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida y 1-[(2-propeniltio)carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona.

Por lo tanto, es de interés una mezcla (es decir, una composición) que comprende como componente (a) un compuesto de la Fórmula **1** (o un *N*-óxido o sal de estos) y como componente (b) al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste de las clases (b1) a (b46) descritas anteriormente. Destacan también las modalidades en donde el componente (b) comprende al menos un fungicida de cada uno de los dos grupos diferentes seleccionados de (b1) a (b46). También es de interés una composición que comprende la mezcla (en una cantidad eficaz como fungicida) y que comprende, además, al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Es de especial interés una mezcla (es decir, una composición) que comprende un compuesto de la Fórmula **1** y al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo de los compuestos específicos enumerados anteriormente en conexión con las clases (b1) a (b46). También es de especial interés

una composición que comprende la mezcla (en una cantidad eficaz como fungicida) y que comprende, además, al menos un surfactante adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

Los ejemplos de otros compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular los compuestos de la presente invención son: insecticidas, tales como abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, aldicarb, amidoflumet (S-1955), amitraz, avermectina, azadiractina, metil azinfos, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurón, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorpirifos, metil clorpirifos, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1*H*-pirazol-5-carboxamida), ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromacina, deltametrina, diafentiurón, diazinona, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzurón, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, ensodulfán, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvaleriato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-

fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxurón, fonofós, halofenozida, hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurón, malatión, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidation, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novalurón (XDE-007), noviflumurón, oxamil, paration, metil paration, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protiocarb, protrifenbuto, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramat, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumurón; nematocidas tales como aldicarb, imiciafos, oxamil y fenamifos; bactericidas tales como estreptomicina; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cienopirafeno, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos que incluyen bacterias entomopatogénicas, tales como *Bacillus*

thuringiensis subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis*, subespecie *kurstaki* y las delta endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatogénicos, tales como hongo de la muscardina verde; y virus entomopatogénicos que incluyen baculovirus, virus de la poliedrosis nuclear (NPV), tal como HzNPV, AfNPV; y virus de la granulosis (GV), tal como CpGV.

Las referencias generales para protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen *The Pesticide Manual, 13.° edición*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 y *The BioPesticide Manual, 2.°d ed.*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

Para modalidades en donde se usan uno o más de estos diversos productos de mezcla, la relación en peso de estos productos de mezcla (en total) con respecto al compuesto de la Fórmula **1** (o un *N*-óxido o sal de estos) es, típicamente, de aproximadamente 1:3000 a aproximadamente 3000:1. Destacan las relaciones en peso de aproximadamente 1:300 a aproximadamente 300:1 (por ejemplo, relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Una persona con experiencia en la técnica podrá determinar fácilmente mediante experimentación simple las cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarios

para el espectro deseado de actividad biológica. Es evidente que incluir estos componentes adicionales puede ampliar el espectro de enfermedades controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de la Fórmula **1** solo.

En algunos casos las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes (en particular, fungicidas) biológicamente activos (es decir, ingredientes activos) pueden producir un efecto mayor que el efecto aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el ambiente y al mismo tiempo asegurar un control eficaz de las plagas. Cuando se produce una sinergia de los ingredientes activos fungicidas en concentraciones de aplicación que dan niveles agronómicamente satisfactorios de control fúngico, estas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el costo de producción del cultivo y disminuir la carga ambiental.

Los compuestos de esta invención y las composiciones que los contienen pueden aplicarse a plantas modificadas genéticamente para expresar proteínas que son tóxicas para las plagas de invertebrados (tales como las delta endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos fungicidas de esta invención aplicados exógenamente podría ser sinérgico con las proteínas de las toxinas expresadas.

Destaca una combinación de un compuesto de la Fórmula **1** (o un *N*-óxido o sal de este) con al menos otro ingrediente

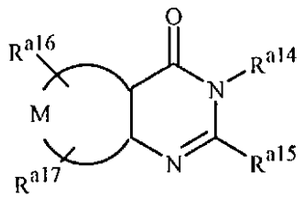
fungicida activo. Destaca, particularmente, una combinación en donde el otro ingrediente activo fungicida tiene diferentes sitios de acción que el compuesto de la Fórmula *1*. En ciertas instancias, una combinación de al menos otro ingrediente activo fungicida que tiene un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente será particularmente ventajoso para el manejo de la resistencia. Por lo tanto, una composición de la presente invención también puede comprender una cantidad biológicamente eficaz de por lo menos un ingrediente activo fungicida adicional que tiene un espectro de control similar, pero un sitio de acción diferente.

Destacan, particularmente, las composiciones que, además del compuesto de la Fórmula **1**, incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste de (1) fungicidas de alquilenbis(ditiocarbamato); (2) cimoxanil; (3) fungicidas de fenilamida; (4) fungicidas de pirimidinona; (5) clorotalonil; (6) carboxamidas que actúan en el complejo II del sitio de transferencia de electrones de la cadena respiratoria mitocondrial de los hongos; (7) quinoxifeno; (8) metrafenona o piriofenona; (9) ciflufenamida; (10) ciprodinil; (11) compuestos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetil-aluminio; (14) fungicidas de benzimidazol; (15) ciazofamida; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de diclorofenil dicarboximida; (21) zoxamida; (22) fluopicolida;

(23) mandipropamid; (24) amidas de ácido carboxílico que actúan sobre la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de paredes celulares; (25) dimetomorf; (26) inhibidores de la biosíntesis de esteroles no DMI; (27) inhibidores de desmetilasa en la biosíntesis de esteroles; (28) fungicidas del complejo bc_1; y sales de los compuestos (1) a (28).

A continuación se proporcionan las descripciones de estas clases de compuestos fungicidas.

Los fungicidas de pirimidinona (grupo (4)) incluyen los compuestos de la Fórmula **A1**



A1

en donde M forma un anillo fusionado de fenilo, tiofeno o piridina; R^{a14} es alquilo de C_1-C_6; R^{a15} es alquilo de C_1-C_6 o alcoxi de C_1-C_6; R^{a16} es halógeno; y R^{a17} es hidrógeno o halógeno.

Los fungicidas de pirimidinona se describen en la publicación de solicitud de patente del PCT núm. WO 94/26722 y en las patentes de los Estados Unidos núms. 6.066.638, 6.245.770, 6.262.058 y 6.277.858. Destacan los fungicidas de

pirimidinona seleccionados del grupo: 6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona, 6,8-diyodo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona, 6-yodo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona (proquinazid), 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona y 3-(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroles (grupo (27)) controlan los hongos al inhibir las enzimas en la ruta de biosíntesis de los esteroles. Los fungicidas inhibidores de desmetilasa tienen un sitio de acción común dentro de la ruta de biosíntesis de esteroles fúngicos, que incluye la inhibición de la desmetilación en la posición 14 de lanosterol o 24-metilen dihidrolanosterol, los cuales son precursores de los esteroles en los hongos. Los compuestos que actúan en este sitio se denominan, frecuentemente, inhibidores de desmetilasa, fungicidas DMI o DMI. A veces, la enzima desmetilasa se conoce con otros nombres en la literatura bioquímica, que incluyen citocromo P-450 (14DM). La enzima desmetilasa se describe, por ejemplo, en *J. Biol. Chem.* **1992**, *267*, 13175-79 y las referencias citadas en ella. Los fungicidas DMI se dividen en varias clases químicas:

azoles (que incluyen triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (que incluye diniconazole-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas mostraron que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI, como describe K. H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

Los fungicidas del complejo bc_1 (grupo 28) tienen un modo de acción fungicida que inhibe el complejo bc_1 en la cadena de respiración mitocondrial. A veces, el complejo bc_1 se conoce con otros nombres en la literatura bioquímica, que incluyen complejo III de la cadena de transferencia de electrones, y ubihidroquinona: citocromo *c* oxidorreductasa.

Este complejo se identifica exclusivamente con el número de la Enzyme Commission EC1.10.2.2. El complejo bc_1 se describe, por ejemplo, en *J. Biol. Chem.* **1989**, *264*, 14543-48; *Methods Enzymol.* **1986**, *126*, 253-71; y las referencias citadas en ella. Se conoce que los fungicidas de estrobilurina, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071), fluoxastrobina, cresoxim metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina y trifloxistrobina, tienen este modo de acción. Sauter et al., *Angew. Chem. Int. Ed.* **1999**, *38*, 1328-1349). Otros compuestos fungicidas que inhiben el complejo bc_1 en la cadena de respiración mitocondrial incluyen famoxadona y fenamidona.

Los alquilenobis(ditiocarbamato)s (grupo (1)) incluyen compuestos tales como mancozeb, maneb, propineb y zineb. Las fenilamidas (grupo (3)) incluyen compuestos tales como metalaxilo, benalaxil, furalaxilo y oxadixilo. Las carboxamidas (grupo (6)) incluyen compuestos tales como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, fluxapiroxad, furametpir, mepronil, oxicarboxin, tifluzamida, pentiopirad y penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (publicación de patente del PCT núm. WO 2003/010149)) y se sabe que inhiben la función mitocondrial mediante la interrupción del complejo II (succinato deshidrogenasa) en la cadena de transporte de electrones respiratorios. Los compuestos de cobre (grupo (11)) incluyen

compuestos tales como oxicloruro de cobre, sulfato de cobre y hidróxido de cobre, que incluyen composiciones tales como caldo bordelés (sulfato de cobre tribásico). Las ftalimidas (grupo (12)) incluyen compuestos tales como folpet y captán. Los fungicidas de bencimidazol (grupo (14)) incluyen benomil y carbendazim. Los fungicidas de diclorofenil dicarboximida (grupo (20)) incluyen clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolina, procimidona y vinclozolina.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroles no DMI (grupo (26)) incluyen fungicidas de morfolina y piperidina. Se ha demostrado que las morfolinas y piperidinas son inhibidores de la biosíntesis de esteroles que inhiben etapas en la ruta de biosíntesis de esteroles en un punto después que las inhibiciones logradas por los inhibidores de biosíntesis de esteroles DMI (grupo (27)). Las morfolinas incluyen aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidina.

Los ejemplos de fungicidas de componente (b) incluyen acibenzolar-*S*-metilo, aldimorf, ametoctradina, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxiestrobina, benalaxil, benalaxil-M, benodanil, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, betoxazina, binapacrilo, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blasticidina-S, boscalid, bromuconazol, bupirimato, carboxin, carpropamida, captafol, captán, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, clotrimazol, sales de

cobre tales como caldo bordelés (sulfato de cobre tribásico), hidróxido de cobre y oxicloruro de cobre, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianona, dodemorf, dodina, edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanil, fenpiclonil, fenpropidina, fenpropimorf, fenpirazamina, acetato de fentina, floruto de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorf, fluopicolida (conocida además como picobenzamida), fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianil (2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidiniliden]acetonitrilo), flutolanil, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxil, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, yodocarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolan, isopirazam, isotianil, kasugamicina, cresoxim metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepronil, meptildinocap, metalaxil, metalaxil-M, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, mepanipirim, metrafenona, miclobutanilo,

naftifina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, oxitetraciclina, penconazol, pencicuron, penflufen, pentiopirad, pefurazoato, ácido fosforoso y sales de este, ftalida, picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, piriofenona, piroquilona, pirrolnitrina, quinometionato, quinoxifeno, quintoceno, sedaxane, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomicina, azufre, tebuconazol, tebufloquina, tecloftalam, tecnaceno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, metil tolclofos, tolilfluanida, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triticonazol, tridemorf, triflumizol, triticonazol, trifloxistrobina, triforina, trimorfamida, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato (valifenal), vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, *N*'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina (BAS600), penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-

carboxamida), *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, 4-fluorofenil *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato, *N*-[[(ciclopropilmetoxi)amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metilen]bencenoacetamida, α-(metoxiimino)-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]bencenoacetamida, *N*'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, 2-[[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-iliden]amino]oxi]metil]-α-(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida, 1-[(2-propeniltio)carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona, etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-ilamina, pentil *N*-[4-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi]metil]-2-tiazolil]carbamato y pentil *N*-[6-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato

Destacan las combinaciones de los compuestos de la Fórmula **1** (o un *N*-óxido o sal de estos) (es decir, Componente (a) en composiciones) con azoxistrobina, cresoxim metilo,

trifloxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, piraxistrobina, piraoxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobina/fenominostrobina, carbendazim, clorotalonil, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamida, fenpropidina, fenpropimorf, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, fluxapiroxad, hexaconazol, ipconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, proquinazid, protioconazol, piriofenona, tebuconazol, triticonazol, famoxadona, procloraz, pentiopirad y boscalid (nicobifeno) (es decir, como Componente (b) en composiciones).

Para un mejor control de las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas (por ejemplo, menor concentración de uso o más amplio espectro de patógenos de las plantas controlados), o un mejor manejo de la resistencia, se prefieren las mezclas de un compuesto de la presente invención con un fungicida seleccionado del grupo: azoxistrobina, cresoxim metilo, trifloxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobina/fenominostrobina, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamida, fenpropidina, fenpropimorf, ciproconazol, epoxiconazol, flusilazol, metconazol, propiconazol, proquinazid, protioconazol, piriofenona, tebuconazol, triticonazol, famoxadona y pentiopirad.

Las Tablas A1 a A54 enumeran combinaciones específicas de un compuesto del Componente (b) con el Componente (a) (los números de los compuestos se refieren a los compuestos en la Tabla índice A) representativas de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. En la Tabla A1, cada línea debajo de los encabezamientos de las columnas "Componente (a)" y "Componente (b)" describe específicamente una combinación (es decir, mezcla) del Componente (a), que es el Compuesto 22, con un fungicida del Componente (b). Las entradas debajo del encabezamiento "Relaciones ilustrativas" describen tres relaciones en peso específicas del Componente (b) al Componente (a) para la mezcla descrita. Por ejemplo, la primera línea de la Tabla A1 describe una mezcla del Compuesto 22 con acibenzolar-*S*-metilo y enumera relaciones en peso de acibenzolar-*S*-metilo al Compuesto 22 de 1:1, 1:4 o 1:17.

Tabla A1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Acibenzolar-*S*-metilo	1:1	1:4	1:18
Compuesto 22	Aldimorf	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Ametoctradina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Amisulbrom	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Anilazina	22:1	8:1	4:1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Azaconazol	2:1	1:2	1:4
Compuesto 22	Azoxistrobina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Benalaxil	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Benalaxil-M	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Benodanil	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Benomilo	11:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Bentiavalicarb	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Bentiavalicarb-isopropilo	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Betoxazina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Binapacrilo	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Bifenilo	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Bitertanol	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Bixafeno	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Blasticidina-S	1:4	1:12	1:30
Compuesto 22	Caldo bordelés (sulfato de cobre tribásico)	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Boscalid	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Bromuconazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Bupirimato	1:3	1:10	1:30
Compuesto 22	Captafol	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Captán	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Carbendazim	11:1	4:1	2:1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Carboxin	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Carpropamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Cloroneb	100:1	35:1	14:1
Compuesto 22	Clorotalonil	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Clozolinato	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Clotrimazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Hidróxido de cobre	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Oxicloruro de cobre	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Ciazofamida	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Ciflufenamida	1:2	1:6	1:24
Compuesto 22	Cimoxanil	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Ciproconazol	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Ciprodinil	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Diclofluanid	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Diclocimet	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Diclomezina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Dicloran	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Dietofencarb	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Difenoconazol	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	Diflumetorim	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Dimetirimol	1:3	1:8	1:30
Compuesto 22	Dimetomorf	3:1	1:1	1:2

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Dimoxistrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Diniconazol	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Diniconazol-M	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	Dinocap	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ditianona	5:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Dodemorf	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Dodina	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Edifenfos	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Enestroburina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Epoxiconazol	1:1	1:3	1:7
Compuesto 22	Etaboxam	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Etirimol	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Etridiazol	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Famoxadona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Fenamidona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Fenarimol	1:2	1:7	1:24
Compuesto 22	Fenbuconazol	1:1	1:3	1:10
Compuesto 22	Fenfuram	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Fenhexamida	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Fenoxanil	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Fenpiclonil	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Fenpropidina	7:1	2:1	1:1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Fenpropimorf	7:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Fenpirazamina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Sal de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ferbam	30:1	10:1	4:1
Compuesto 22	Ferimzona	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Fluazinam	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Fludioxonil	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Flumetover	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Flumorf	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Fluopicolida	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Fluopiram	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Fluoroimida	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Fluoxastrobina	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Fluquinconazol	1:1	1:2	1:4
Compuesto 22	Flusilazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Flusulfamida	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Flutianil	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Flutolanil	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Flutriafol	1:1	1:2	1:4

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Fluxapiroxad	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Folpet	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Fosetil-aluminio	30:1	12:1	5:1
Compuesto 22	Fuberidazol	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Furalaxil	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Furametpir	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Guazatina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Hexaconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Himexazol	75:1	25:1	9:1
Compuesto 22	Imazalil	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Imibenconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Iminoctadina	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Yodocarb	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Ipconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Iprobenfos	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Iprodiona	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Iprovalicarb	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Isoprotiolano	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Isopirazam	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Isotianil	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Kasugamicina	1:2	1:7	1:24
Compuesto 22	Cresoxim metilo	2:1	1:1	1:4

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Mancozeb	22:1	7:1	3:1
Compuesto 22	Mandipropamid	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Maneb	22:1	7:1	3:1
Compuesto 22	Mepanipirim	6:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Mepronil	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Meptildinocap	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Metalaxil	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Metalaxil-M	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Metconazol	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Metasulfocarb	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Metiram	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Metominostrobin	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Metrafenona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Miclobutanilo	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Naftifina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Neo-asozina (metanoarsonato férrico)	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Nuarimol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Octilinona	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Ofurace	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Orysastrobin	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Oxadixil	1:1	1:2	1:6

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Ácido oxolínico	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Oxpoconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Oxicarboxina	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Oxitetraciclina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pefurazoato	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Penconazol	1:2	1:6	1:15
Compuesto 22	Pencicuron	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Pentiopirad	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ácido fosforoso o una sal de este	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Ftalida	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Picoxistrobina	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Piperalina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Polioxina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Probenazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Procloraz	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Procimidona	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Propamocarb o clorhidrato de propamocarb	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Propiconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Propineb	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Proquinazid	1:1	1:3	1:12

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Protiocarb	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Protioconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Piraclostrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Pirametostrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Piraoxistrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Pirazofos	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Piribencarb	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Piributicarb	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Pirifenox	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pirimetanil	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Piriofenona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Piroquilona	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pirrolnitrina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Quinometionato	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Quinoxifeno	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Quintoceno	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Siltiofam	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Simeconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Espiroxamina	5:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Estreptomicina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Azufre	75:1	25:1	9:1
Compuesto 22	Tebuconazol	1:1	1:2	1:5

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Tebufloquina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tecloftalam	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Tecnaceno	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Terbinafina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Tetraconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Tiabendazol	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tifluzamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tiofanato	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tiofanato-metilo	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tiram	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Tiadinil	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Metil tolclofos	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Tolilfluanida	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Triadimefon	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Triadimenol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Triazóxido	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Triciclazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tridemorf	7:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Trifloxistrobin	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Triflumizol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Triforina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Trimorfamida	7:1	2:1	1:2

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Triticonazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Uniconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Validamicina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Valifenalato (valifenal)	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Vinclozolina	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Zineb	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Ziram	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Zoxamida	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida)	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	*N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-	2:1	1:1	1:4

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
	[(metilsulfonil)amino] butanamida			
	N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino] butanamida			
Compuesto 22		2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	4-fluorofenil *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil] metil]propil]carbamato	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	*N*-[[(ciclopropilmetoxi) amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metilen]ben	1:2	1:7	1:24

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
	cenoacetamida α-[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]benceno acetamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	*N'*-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	*N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-iliden]amino]oxi]metil]-α-(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	*N*-[4-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi	3:1	1:1	1:3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas(*)		
	]metil]-2-tiazolil]carbamato de pentilo *N*-[6-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato de pentilo			
Compuesto 22		3:1	1:1	1:3

(*) Relaciones del Componente (b) con respecto al Componente (a) en peso.

Cada una de las Tablas A2 a A54 se estructuró de la misma manera que la Tabla A1 anterior, excepto que las entradas debajo del encabezamiento de la columna “Componente (a)” se reemplazan por la entrada de la columna del Componente (a) respectiva que se muestra más abajo. Así, por ejemplo, en la Tabla A2 las entradas debajo del encabezamiento de la columna “Componente (a)” indican “Compuesto 18”, y la primera línea debajo de los encabezamientos de las columnas en la Tabla A2 describe específicamente una mezcla del Compuesto 18 con acibenzolar-*S*-metilo. Las Tablas A3 a A54 se estructuraron de manera similar.

Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)	Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)
A2	Compuesto 18	A29	Compuesto 351
A3	Compuesto 23	A30	Compuesto 352
A4	Compuesto 24	A31	Compuesto 357
A5	Compuesto 36	A32	Compuesto 358
A6	Compuesto 41	A33	Compuesto 360
A7	Compuesto 45	A34	Compuesto 361
A8	Compuesto 87	A35	Compuesto 364
A9	Compuesto 91	A36	Compuesto 365
A10	Compuesto 118	A37	Compuesto 367
A11	Compuesto 139	A38	Compuesto 368
A12	Compuesto 148	A39	Compuesto 369
A13	Compuesto 172	A40	Compuesto 372
A14	Compuesto 175	A41	Compuesto 373
A15	Compuesto 193	A42	Compuesto 374
A16	Compuesto 232	A43	Compuesto 375
A17	Compuesto 265	A44	Compuesto 376
A18	Compuesto 266	A45	Compuesto 377
A19	Compuesto 284	A46	Compuesto 378
A20	Compuesto 286	A47	Compuesto 379
A21	Compuesto 287	A48	Compuesto 380
A22	Compuesto 292	A49	Compuesto 381

Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)	Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)
A23	Compuesto 297	A50	Compuesto 382
A24	Compuesto 332	A51	Compuesto 383
A25	Compuesto 336	A52	Compuesto 384
A26	Compuesto 343	A53	Compuesto 385
A27	Compuesto 346	A54	Compuesto 386
A28	Compuesto 349		

La Tabla B1 enumera combinaciones específicas de un compuesto del Componente (b) con el Componente (a) representativas de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla B1 enumera el compuesto específico del Componente (b) (por ejemplo, "acibenzolar-S-metilo" en la primera línea). La segunda, tercera y cuarta columnas de la Tabla B1 enumeran los rangos de relaciones en pesos para las concentraciones en las cuales el compuesto del Componente (b) se aplica, típicamente, en un cultivo cultivado en campo con respecto al Componente (a) (por ejemplo, "2:1 a 1:180" de acibenzolar-S-metilo con respecto al Componente (a) en peso). Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla B1 describe específicamente que la combinación de acibenzolar-S-metilo con el Componente (a) se aplica, típicamente, en una relación en peso de 2:1 a 1:180.

Las líneas restantes de la Tabla B1 se interpretarán de manera similar. De este modo, la Tabla B1 complementa las relaciones específicas descritas en las Tablas A1 a A54 con intervalos de relaciones para estas combinaciones.

Tabla B1

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Acibenzolar-*S*-metilo	2:1 a 1:180	1:1 a 1:60	1:1 a 1:18
Aldimorf	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Ametoctradina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Amisulbrom	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Anilazina	90:1 a 2:1	30:1 a 4:1	22:1 a 4:1
Azaconazol	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Azoxistrobina	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Benalaxil	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Benalaxil-M	4:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:8
Benodanil	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Benomilo	45:1 a 1:4	15:1 a 1:1	11:1 a 1:1
Bentiavalicarb o bentiavalicarb-isopropilo	2:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Betoxazina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Binapacrilo	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Bifenilo	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Bitertanol	15:1 a 1:5	5:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Bixafeno	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Blasticidina-S	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:4 a 1:30
Boscalid	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Bromuconazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Bupirimato	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:3 a 1:30
Captafol	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Captán	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Carbendazim	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 to 2:1
Carboxin	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Carpropamida	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Cloroneb	300:1 a 2:1	100:1 a 4:1	100:1 a 14:1
Clorotalonil	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Clozolinato	45:1 a 1:2	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Clotrimazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Sales de cobre, tales como caldo bordelés (sulfato de cobre	450:1 a 1:1	150:1 a 4:1	45:1 a 5:1

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
tribásico), oxicloruro de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre			
Ciazofamida	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Ciflufenamida	1:1 a 1:90	1:2 a 1:30	1:2 a 1:24
Cimoxanil	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Ciproconazol	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Ciprodinil	22:1 a 1:9	7:1 a 1:3	4:1 a 1:2
Diclofluanid	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Diclocimet	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Diclomezina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Dicloran	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Dietofencarb	22:1 a 1:9	7:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Difenoconazol	4:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Diflumetorim	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Dimetirimol	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:3 a 1:30
Dimetomorf	9:1 a 1:6	3:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Dimoxistrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Diniconazol	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:8
Diniconazol M	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:1 a 1:12

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Dinocap	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Ditianona	15:1 a 1:4	5:1 a 1:2	5:1 a 1:2
Dodemorf	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Dodina	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Edifenfos	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Enestroburina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Epoxiconazol	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:7
Etaboxam	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Etirimol	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Etridiazol	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Famoxadona	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Fenamidona	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Fenarimol	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:2 a 1:24
Fenbuconazol	3:1 a 1:30	1:1 a 1:10	1:1 a 1:10
Fenfuram	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Fenhexamida	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Fenoxanil	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Fenpiclonil	75:1 a 1:9	25:1 a 1:3	15:1 a 2:1
Fenpropidina	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Fenpropimorf	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Fenpirazamina	100:1 a	10:1 a 1:10	3:1 a 1:3

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
	1:100		
Sal de fentina, tal como el acetato, cloruro o hidróxido	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Ferbam	300:1 a 1:2	100:1 a 2:1	30:1 a 4:1
Ferimzona	30:1 a 1:5	10:1 a 1:2	7:1 a 1:2
Fluazinam	22:1 a 1:5	7:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Fludioxonil	7:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Flumetover	9:1 a 1:6	3:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Flumorf	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Fluopicolida	3:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Fluopiram	15:1 a 1:90	5:1 a 1:30	3:1 a 1:3
Fluoroimida	150:1 a 2:1	50:1 a 4:1	37:1 a 5:1
Fluoxastrobina	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Fluquinconazol	4:1 a 1:12	1:1 a 1:4	1:1 a 1:4
Flusilazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Flusulfamida	90:1 a 1:2	30:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Flutianil	7:1 a 1:36	2:1 a 1:12	1:1 a 1:6
Flutolanil	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Flutriafol	4:1 a 1:12	1:1 a 1:4	1:1 a 1:4
Fluxapiroxad	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Folpet	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Fosetil-aluminio	225:1 a 2:1	75:1 a 5:1	30:1 a 5:1
Fuberidazol	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 a 2:1
Furalaxil	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Furametpir	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Guazatina o iminoctadina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Hexaconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Himexazol	225:1 a 2:1	75:1 a 4:1	75:1 a 9:1
Imazalil	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Imibenconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Yodocarb	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Ipconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Iprobenfos	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Iprodiona	120:1 a 1:2	40:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Iprovalicarb	9:1 a 1:9	3:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Isoprotiolano	150:1 a 2:1	50:1 a 4:1	45:1 a 5:1
Isopirazam	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Isotianil	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Kasugamicina	7:1 a 1:90	2:1 a 1:30	1:2 a 1:24
Cresoxim metilo	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Mancozeb	180:1 a 1:3	60:1 a 2:1	22:1 a 3:1

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Mandipropamid	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Maneb	180:1 a 1:3	60:1 a 2:1	22:1 a 3:1
Mepanipirim	18:1 a 1:3	6:1 a 1:1	6:1 a 1:1
Mepronil	7:1 a 1:36	2:1 a 1:12	1:1 a 1:6
Meptildinocap	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Metalaxil	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Metalaxil-M	7:1 a 1:90	2:1 a 1:30	1:1 a 1:12
Metconazol	3:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Metasulfocarb	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Metiram	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Metominostrobin	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Metrafenona	6:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Miclobutanilo	5:1 a 1:26	1:1 a 1:9	1:1 a 1:8
Naftifina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Neo-asozina (metanoarsonato férrico)	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Nuarimol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Octilinona	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Ofurace	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Orysastrobin	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Oxadixil	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Ácido oxolínico	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Oxpoconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Oxicarboxina	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Oxitetraciclina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pefurazoato	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Penconazol	1:1 a 1:45	1:2 a 1:15	1:2 a 1:15
Pencicuron	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Pentiopirad	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Ácido fosforoso y sales de este	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Ftalida	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Picoxistrobina	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Piperalina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Polioxina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Probenazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Procloraz	22:1 a 1:4	7:1 a 1:1	7:1 a 1:2
Procimidona	45:1 a 1:3	15:1 a 1:1	11:1 a 2:1
Propamocarb o clorhidrato de propamocarb	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Propiconazol	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:5

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Propineb	45:1 a 1:2	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Proquinazid	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Protiocarb	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Protioconazol	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Piraclostrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Pirametostrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Piraoxistrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Pirazofos	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Piribencarb	15:1 a 1:6	5:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Pirifenox	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pirimetanil	30:1 a 1:6	10:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Piriofenona	6:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Piroquilona	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pirrolnitrina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Quinometionato	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Quinoxifeno	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Quintoceno	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Siltiofam	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Simeconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Espiroxamina	22:1 a 1:4	7:1 a 1:2	5:1 a 1:2
Estreptomicina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Azufre	300:1 a 3:1	100:1 a 9:1	75:1 a 9:1
Tebuconazol	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Tebufloquina	100:1 a 1:100	10:1 a 1:10	3:1 a 1:3
Tecloftalam	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Tecnaceno	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Terbinafina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Tetraconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Tiabendazol	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 a 2:1
Tifluzamida	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Tiofanato	45:1 a 1:3	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Tiofanato-metilo	45:1 a 1:3	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Tiram	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Tiadinil	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Metil tolclofos	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Tolilfluanida	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Triadimefon	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Triadimenol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Triazóxido	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Triciclazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Tridemorf	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
Trifloxistrobin	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Triflumizol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Triforina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Trimorfamida	45:1 a 1:9	15:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Triticonazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Uniconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Validamicina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	3:1 a 1:3
Valifenalato (valifenal)	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Vinclozolina	120:1 a 1:2	40:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Zineb	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Ziram	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Zoxamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:6
Penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida)	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil] piridina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
4-fluorofenil *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
sulfonil]metil] propil]carbamato			
N-[[(ciclopropilmetoxi) amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil] metilen] bencenoacetamida	1:1 a 1:90	1:2 a 1:30	1:2 a 1:24
α-[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil) fenil]etoxi]imino] metil] bencenoacetamida	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
N'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil) fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida	15:1 a 1:18	5:1 a 1:6	3:1 a 1:3
N-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida	15:1 a 1:18	5:1 a 1:6	3:1 a 1:3
2-[[[3-(2,6-	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3

Componente (b)	Relación en peso Típica	Más típica Típica	Aún más típica Típica
diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-iliden]amino]oxi]metil]-α-(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida			
N-[4-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi]metil]-2-tiazolil]carbamato de pentilo	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
N-[6-[[[[(1-metil-1*H*-tetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato de pentilo	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3

Como se mencionó anteriormente, la presente invención incluye modalidades en donde en la composición que comprende los componentes (a) y (b), el componente (b) comprende al menos un fungicida de cada uno de los dos grupos

seleccionados de (b1) a (b46). Las Tablas C1 a C54 enumeran mezclas específicas (los números de los compuestos se refieren a los compuestos de la Tabla índice A) para ilustrar modalidades, en donde el componente (b) incluye al menos un fungicida de cada uno de los dos grupos seleccionados de (b1) a (b46). En la Tabla C1, cada línea debajo de los encabezamientos de las columnas "Componente (a)" y "Componente (b)" describe específicamente una mezcla del Componente (a), que es el Compuesto 22, con al menos dos fungicidas del Componente (b). Las entradas debajo del encabezamiento "Relaciones ilustrativas" describen tres relaciones en peso específicas del Componente (a) a cada fungicida del Componente (b) en secuencia para la mezcla descrita. Por ejemplo, la primera línea describe una mezcla del Compuesto 22 con ciproconazol y azoxistrobina y enumera relaciones en peso del Compuesto 22 al ciproconazol a la azoxistrobina de 1:1:1, 2:1:1 o 3:1:1.

Tabla C1

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Ciproconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Cresoxim metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Trifloxistrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Ciflufenamida	1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1

Componente (a)	Componente (b)			Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Ciproconazol	Sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Ciproconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Trifloxistrobin	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Azoxistrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Cresoxim metilo		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Picoxistrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Piraclostrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Trifloxistrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Bixafeno		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Ciflufenamida		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Difenconazol	Fluopiram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Isopirazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Metrafenona		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Pentiopirad		1:1:2	2:1:2	3:1:2

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Difenconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Difenconazol	Picoxistrobina Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Difenconazol	Trifloxistrobin Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Cresoxim metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Trifloxistrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Ciflufenamida	1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Epoxiconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Epoxiconazol	Picoxistrobina Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Epoxiconazol	Trifloxistrobin Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Cresoxim metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Trifloxistrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Ciflufenamida	1:2:1	2:2:1	3:2:1

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Metconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Metconazol	Picoxistrobina Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Metconazol	Trifloxistrobin Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Cresoxim metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Trifloxistrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2

Componente (a)	Componente (b)			Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Miclobutanilo	Boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Ciflufenamida		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Fluopiram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Isopirazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Metrafenona		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Pentiopirad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Quinoxifeno		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Miclobutanilo	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Miclobutanilo	Trifloxistrobin	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Azoxistrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Cresoxim metilo		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Picoxistrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Piraclostrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1

Componente (a)	Componente (b)			Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Protioconazol	Trifloxistrobin		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Bixafeno		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Boscalid		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Ciflufenamida		1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Protioconazol	Fluopiram		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Isopirazam		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Metrafenona		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Pentiopirad		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Proquinazid		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Quinoxifeno		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Sedaxane		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Protioconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Protioconazol	Trifloxistrobin	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Azoxistrobina		1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Cresoxim metilo		1:1:1	2:1:1	3:1:1

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas(*)		
Compuesto 22	Tebuconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Trifloxistrobin	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Ciflufenamida	1:2:1	2:2:1	3:2:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Sedaxane	1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	Tebuconazol	Picoxistrobina Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Tebuconazol	Trifloxistrobin Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

(*) Relaciones del Componente (a) con respecto al Componente (b) en secuencia, en peso.

Cada una de las Tablas C2 a C54 se estructuró de la misma manera que la Tabla C1 anterior, excepto que las entradas debajo del encabezamiento de la columna "Componente (a)" se reemplazan por la entrada de la columna del Componente (a) respectiva que se muestra más abajo. Así, por ejemplo, en la Tabla C2 las entradas debajo del encabezamiento de la columna "Componente (a)" indican "Compuesto 18", y la primera línea debajo de los encabezamientos de las columnas de la Tabla C2 describe específicamente una mezcla del Compuesto 18 con ciproconazol y azoxistrobina, y las relaciones en peso ilustrativas de 1:1:1, 2:1:1 y 3:1:1 del Compuesto 18:ciproconazol:azoxistrobina. Las Tablas C3 a C54 se estructuraron de manera similar.

Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)	Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)
C2	Compuesto 18	C29	Compuesto 351
C3	Compuesto 23	C30	Compuesto 352
C4	Compuesto 24	C31	Compuesto 357
C5	Compuesto 36	C32	Compuesto 358
C6	Compuesto 41	C33	Compuesto 360
C7	Compuesto 45	C34	Compuesto 361
C8	Compuesto 87	C35	Compuesto 364

C9	Compuesto 91	C36	Compuesto 365
C10	Compuesto 118	C37	Compuesto 367
C11	Compuesto 139	C38	Compuesto 368
C12	Compuesto 148	C39	Compuesto 369
C13	Compuesto 172	C40	Compuesto 372
C14	Compuesto 175	C41	Compuesto 373
C15	Compuesto 193	C42	Compuesto 374
C16	Compuesto 232	C43	Compuesto 375
C17	Compuesto 265	C44	Compuesto 376
C18	Compuesto 266	C45	Compuesto 377
C19	Compuesto 284	C46	Compuesto 378
C20	Compuesto 286	C47	Compuesto 379
C21	Compuesto 287	C48	Compuesto 380
C22	Compuesto 292	C49	Compuesto 381
C23	Compuesto 297	C50	Compuesto 382
C24	Compuesto 332	C51	Compuesto 383
C25	Compuesto 336	C52	Compuesto 384
C26	Compuesto 343	C53	Compuesto 385
C27	Compuesto 346	C54	Compuesto 386
C28	Compuesto 349		

Como se mencionó en la Breve descripción de la invención, un aspecto de la presente invención es una composición que comprende (es decir, una mezcla o combinación de) un compuesto de la Fórmula **1**, un *N*-óxido o una sal de estos, y al menos un compuesto o agente para controlar la plaga de invertebrados

(por ejemplo, insecticida, acaricida). Destaca una composición que comprende el componente (a) y al menos un (es decir, uno o más) compuesto o agente para controlar la plaga de invertebrados que después se puede combinar con el componente (b) para proporcionar una composición que comprende los componentes (a) y (b) y el o los compuestos o agentes para controlar la plaga de invertebrados. Alternativamente, sin mezclar primero con el componente (b), se puede aplicar una cantidad biológicamente eficaz de la composición que comprende el componente (a) con al menos un agente para controlar la plaga de invertebrados a una planta o semilla de la planta (directamente o a través del ambiente de la planta o semilla de la planta) para proteger la planta o semilla de la planta contra enfermedades causadas por patógenos fúngicos y daños causados por plagas de invertebrados.

Para modalidades en donde se usa uno o más compuestos para controlar la plaga de invertebrados, la relación en peso de estos compuestos (en total) a los compuestos del componente (a) es, típicamente, de aproximadamente 1:3000 a aproximadamente 3000:1. Destacan las relaciones en peso de aproximadamente 1:300 a aproximadamente 300:1 (por ejemplo, las relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Una persona con experiencia en la técnica podrá determinar fácilmente mediante experimentación simple las

cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica.

Destaca una composición de la presente invención que comprende, además de un compuesto del componente (a), solo o combinado con un componente fungicida (b), al menos un compuesto o agente para controlar la plaga de invertebrados seleccionado del grupo que consiste de abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, metil azinfos, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurón, clorantraniliprol, clorpirifos, metil clorpirifos, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciantraniliprol, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromacina, deltametrina, diafentiurón, diazinona, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzurón, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, ensodulfán, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvaleriato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurón, fonofós, halofenozida, hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurón, malatión, meperflutrina, metaflumizona, metaldehído,

metamidofos, metidation, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofós, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, parationa, metil parationa, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbuto, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfós, tetrametilflutina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumurón, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopoliedroviruses, delta endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

En algunos casos, las combinaciones de un compuesto de la Fórmula **1** o un *N*-óxido o sal de estos (es decir, componente (a)), solo o en una mezcla con un componente fungicida (b), con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente, para el control de plagas de invertebrados) (es decir, ingredientes activos) pueden producir un efecto mayor que el efecto aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable reducir la cantidad de

ingredientes activos liberados en el ambiente y al mismo tiempo asegurar un control eficaz de las plagas. Cuando se produce una sinergia de los ingredientes activos para controlar la plaga de invertebrados en concentraciones de aplicación que dan niveles agronómicamente satisfactorios de control de la plaga de invertebrados, estas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el costo de producción del cultivo y disminuir la carga ambiental.

La Tabla D1 enumera combinaciones específicas de agentes para controlar la plaga de invertebrados con el Compuesto 22 (identificado en la Tabla índice A) como un compuesto del componente (a) representativo de mezclas y composiciones que comprenden estos ingredientes activos y métodos de uso de estos de conformidad con la presente invención. La segunda columna de la Tabla D1 enumera los agentes específicos para el control de plagas de invertebrados (por ejemplo, "abamectina" en la primera línea). La tercera columna de la Tabla D1 enumera el modo de acción (de ser conocido) o la clase química de los agentes para el control de plagas de invertebrados. La cuarta columna de la Tabla D1 enumera una o varias modalidades de rangos de relaciones en peso para las concentraciones en las cuales el agente para controlar las plagas de invertebrados se aplica, típicamente, con respecto al Compuesto 22 solo o combinado con el componente fungicida

(b) (por ejemplo, "50:1 a 1:50" de abamectina con respecto a un Compuesto 22 en peso). Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla D1 describe específicamente la combinación del Compuesto 22 con abamectina se aplica, típicamente, en una relación en peso de 50:1 a 1:50. Las demás líneas de la Tabla D1 se interpretarán de manera similar.

Tabla D1

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
Compuesto 22	Abamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Acetamiprida	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Amitraz	Ligandos del receptor de octopamina	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Avermectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Azadiractina	Agonistas de la ecdisona	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Beta ciflutrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Bifentrina	Moduladores del	100:1 a 1:10

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
		canal de sodio	
Compuesto 22	Buprofezina	Inhibidores de la síntesis de la quitina	500:1 a 1:50
Compuesto 22	Cartap	Análogos de la nereistoxina	100:1 a 1:200
Compuesto 22	Clorantraniliprol	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Clorfenapir	Inhibidores del transporte electrónico mitocondrial	300:1 a 1:200
Compuesto 22	Clorpirifos	Inhibidores de la colinesterasa	500:1 a 1:200
Compuesto 22	Clotianidina	Neonicotinoides	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Ciantraniliprol	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Ciflutrina	Moduladores del	150:1 a 1:200

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
		canal de sodio	
Compuesto 22	Cialotrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Cipermetrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Ciromacina	Inhibidores de la síntesis de la quitina	400:1 a 1:50
Compuesto 22	Deltametrina	Moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:400
Compuesto 22	Dieldrina	Insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Dinotefurano	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Diofenolán	Inhibidor de muda	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Emamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:10
Compuesto 22	Endosulfán	Insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Esfenvalerato	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:400

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
Compuesto 22	Etiprol	Bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Fenotiocarb		150:1 a 1:200
Compuesto 22	Fenoxicarb	Imitadores de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Fenvalerato	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Fipronil	Bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	150:1 a 1:100
Compuesto 22	Flonicamid		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Flubendiamida	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Flufenoxurón	Inhibidores de	200:1 a 1:100

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
		la síntesis de la quitina	
Compuesto 22	Hexaflumurón	Inhibidores de la síntesis de la quitina	300:1 a 1:50
Compuesto 22	Hidrametilnon	Inhibidores del transporte electrónico mitocondrial	150:1 a 1:250
Compuesto 22	Imidacloprid	Neonicotinoides	1000:1 a 1:1000
Compuesto 22	Indoxacarb	Moduladores del canal de sodio	200:1 a 1:50
Compuesto 22	Lambda cialotrina	Moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:250
Compuesto 22	Lufenurón	Inhibidores de la síntesis de la quitina	500:1 a 1:250
Compuesto 22	Meperflutrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Metaflumizona		200:1 a 1:200

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
Compuesto 22	Metomilo	Inhibidores de la colinesterasa	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Metopreno	Imitadores de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Metoxifenozida	Agonistas de la ecdisona	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Nitenpiram	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Nitiazina	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Novalurona	Inhibidores de la síntesis de la quitina	500:1 a 1:150
Compuesto 22	Oxamil	Inhibidores de la colinesterasa	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Pimetrozina		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Piretrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Compuesto 22	Piridaben	Inhibidores del transporte	200:1 a 1:100

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
		electrónico mitocondrial	
Compuesto 22	Piridalilo		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Piriproxifeno	Imitadores de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Rianodina	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Espinetoram	Lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Compuesto 22	Espinosad	Lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Compuesto 22	Espirodiclofeno	Inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Espiromesifeno	Inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Sulfoxaflor		200: 1 a 1: 200

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
Compuesto 22	Tebufenozida	Agonistas de la ecdisona	500:1 a 1:250
Compuesto 22	Tetrametilflutrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Tiacloprid	Neonicotinoides	100:1 a 1:200
Compuesto 22	Tiametoxam	Neonicotinoides	1250:1 a 1:1000
Compuesto 22	Tiodicarb	Inhibidores de la colinesterasa	500:1 a 1:400
Compuesto 22	Tiosultap-sodio		150:1 a 1:100
Compuesto 22	Tralometrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Triazamato	Inhibidores de la colinesterasa	250:1 a 1:100
Compuesto 22	Triflumurón	Inhibidores de la síntesis de la quitina	200:1 a 1:100
Compuesto 22	*Bacillus thuringiensis*	Agentes biológicos	50:1 a 1:10

Componente (a)	Agente para controlar plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso Típica
Compuesto 22	Delta endotoxinas *de Bacillus* thuringiensis	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
Compuesto 22	NPV (por ejemplo, Gemstar)	Agentes biológicos	50:1 a 1:10

Cada una de las Tablas D2 a D54 se estructuró de la misma manera que la Tabla D1 anterior, excepto que las entradas debajo del encabezamiento de la columna "Componente (a)" se reemplazan por la entrada de la columna Componente (a) respectiva que se muestra más abajo. Así, por ejemplo, en la Tabla D2 las entradas debajo del encabezamiento de la columna "Componente (a)" indican "Compuesto 18", y la primera línea debajo de los encabezamientos de las columnas en la Tabla D2 describe específicamente una mezcla del Compuesto 18 con abamectina. Las Tablas D3 a D54 se estructuraron de manera similar.

Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)	Número de la Tabla	Entradas de la columna Componente (a)
D2	Compuesto 18	D29	Compuesto 351
D3	Compuesto 23	D30	Compuesto 352

D4	Compuesto 24	D31	Compuesto 357
D5	Compuesto 36	D32	Compuesto 358
D6	Compuesto 41	D33	Compuesto 360
D7	Compuesto 45	D34	Compuesto 361
D8	Compuesto 87	D35	Compuesto 364
D9	Compuesto 91	D35	Compuesto 365
D10	Compuesto 118	D37	Compuesto 367
D11	Compuesto 139	D38	Compuesto 368
D12	Compuesto 148	D39	Compuesto 369
D13	Compuesto 172	D40	Compuesto 372
D14	Compuesto 175	D41	Compuesto 373
D15	Compuesto 193	D42	Compuesto 374
D16	Compuesto 232	D43	Compuesto 375
D17	Compuesto 265	D44	Compuesto 376
D18	Compuesto 266	D45	Compuesto 377
D19	Compuesto 284	D46	Compuesto 378
D20	Compuesto 286	D47	Compuesto 379
D21	Compuesto 287	D48	Compuesto 380
D22	Compuesto 292	D49	Compuesto 381
D23	Compuesto 297	D50	Compuesto 382
D24	Compuesto 332	D51	Compuesto 383
D25	Compuesto 336	D52	Compuesto 384
D26	Compuesto 343	D53	Compuesto 385
D27	Compuesto 346	D54	Compuesto 386

D28 Compuesto 349

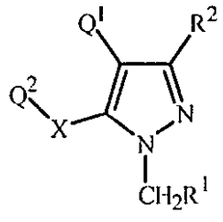
Una modalidad de agentes para controlar la plaga de invertebrados (por ejemplo, insecticidas y acaricidas) para mezclar con compuestos de la Fórmula **1** (y *N*-óxidos y sales de estos) incluyen moduladores del canal de sodio, tales como bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvaleriato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina y tralometrina; inhibidores de colinesterasa, tales como clorpirifos, metomilo, oxamilo, tiodicarb y triazamato; neonicotinoides, tales como acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiacina; tiacloprid y tiametoxam; lactonas macrocíclicas insecticidas, tales como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina y emamectina; bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA (ácido γ-aminobutírico), tales como ensodulfán, etiprol y fipronil; inhibidores de la síntesis de quitina, tales como buprofezina, ciromacina, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflumurona; imitadores de la hormona juvenil, tales como diofenolano, fenoxicarb, metopreno y piriproxifeno; ligandos de los receptores de octopamina, tales como amitraz; agonista de ecdisona, tales como azadiractina, metoxifenozida y tebufenozida; ligandos de los receptores de rianodina, tales

como rianodina, diamidas antranílicas, tales como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; análogos de nereistoxina, tales como cartap; inhibidores del transporte de electrones en la mitocondria, tales como clorfenapir, hidrametilnona y piridabeno; inhibidores de la síntesis de lípidos, tales como espirodiclofeno y espiromesifeno; insecticidas de ciclodieno, tal como dieldrina; ciflumetofeno; fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafluprol; piridalilo; piriprol; pimetrozina; espirotetramat; y tiosultap-sodio. Una modalidad de agentes biológicos para mezclar con compuestos del componente (a) incluye nucleopoliedrovirus, tales como HzNPV y AfNPV; *Bacillus thuringiensis* y delta endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, tales como Cellcap, MPV y MPVII; además de los insecticidas virales naturales y modificados genéticamente que incluyen miembros de la familia Baculoviridae además de hongos entomófagos. Destaca una composición que comprende el componente (a) y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional seleccionado de los agentes para controlar la plaga de invertebrados enumerados en la Tabla D1 anterior.

Las siguientes pruebas demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en patógenos específicos. Sin embargo, la protección de control de patógenos proporcionada por los compuestos no se limita a estas

especies. Ver Tabla índice A para las descripciones de los compuestos. Las siguientes abreviaciones se usan en las Tablas índice a continuación: Me es metilo, Ph es fenilo, OMe es metoxi, -CN es ciano, $-NO_2$ es nitro. Además, "piridin-2-ilo" es sinónimo de "2-piridinilo", "piridin-3-ilo" es sinónimo de "3-piridinilo" y "pirimidin-5-ilo" es sinónimo de 5-pirimidinilo". La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y está seguida de un número que indica el ejemplo en el cual se prepara el compuesto. "Comp. núm. " significa número de compuesto. Los espectros de masas (M.S.) se informan como el peso molecular del ion precursor de mayor abundancia isotópica (M+1) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) en la molécula, observada por espectrometría de masa con ionización química a presión atmosférica (AP^+).

Tabla índice A



Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
1	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NH	**
(Ej. 1)						
2	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
3	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NMe	*
4	H	Me	4-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
5	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	334
6	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NMe	348
7	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	369
8	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-Ph	NH	334
9	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	352
10	H	Me	4-Cl-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	NH	352
11	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	NH	334
12	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-Ph	NH	334
13	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
14	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	370
15	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	347
16	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	359
17	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	**
(Ex. 2)						
18	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	370
19	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	350
20	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO_2-Ph	O	380

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
21	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	O	365
22	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	NH	364
23	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366
24 (Ex. 3)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	**
25	H	Me	3-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
26	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-NO_2-Ph	O	364
27	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-Ph	O	353
28	H	Me	4-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	352
29	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
30	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-Cl-4-CF_3-Ph	O	455
31	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	380
32	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	398
33	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
34	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-Cl-piridin-3-yl	NH	365
35	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
36	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
37	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
38	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	387
39	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-piridin-2-yl	O	354
40	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	399
41	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
42	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
43	H	Me	3-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	344
44	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	360
45	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	**
(Ex. 4)						
46	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
47	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Cl-piridin-2-yl	O	366
48	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	366
49	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	382

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
50	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Me-Ph	NH	344
51	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	390
52	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	358
53	Ph	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	476
54 (Ex. 8)	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	**
55	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl- 4-OMe-Ph	O	343
56	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	328
57	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	392
58 (Ex. 10)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	O	**
59	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-6-Cl-Ph	NH	424
60	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	362
61	Me	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	348
62	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
63	Me	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	374
64	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	O	388

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
65	$-CO_2Et$	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F, 4-NO_2-Ph	O	472
66	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Me-piridin-2-yl	NH	345
67	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	5-CN-piridin-2-yl	NH	342
68	$-CO_2H$	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	444
69 (Ex. 5)	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	**
70	Me	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	382
71	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-(NHC(O)Me)-Ph	O	392
72	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	360
73	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	387
74	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	3,4-di-OMe-Ph		392
75	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
76	H	Me	2,4-di-F-Ph	6-Cl-piridin-3-yl	NH	331
77	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-NH_2-Ph	O	382
78	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-	NH	384

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
				Ph		
79	H	Me	4-Me-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	332
	H	Me	4-Me-Ph	2,6-di-F-4-OMe-	NH	344
80				Ph		
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	5-Cl-2,4-di-OMe-	NH	424
81			Ph	Ph		
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	391
82			Ph			
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	2,6-di-F-4-OMe-	NH	396
83			Ph	Ph		
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	2,6-di-F-Ph	O	367
84			Ph			
85	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	386
	H	Me	6-Cl-piridin-3-	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	361
86			yl			
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	2-Cl-4-F-Ph	NH	382
87			Ph			
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	4-F-2-Me-Ph	NH	362
88			Ph			
89	H	Me	4-F-2-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	4-Br-2,6-di-F-Ph	O	447
90			Ph			

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
91	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
92	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	379
93	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	378
94	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	6-OMe-piridin-3-yl	NH	349
95	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-OMe-piridin-3-yl	NH	361
96	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	362
97	H	Me	4-F-2-Me-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	358
98	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	378
99	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	380
100	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-2,4-di-OMe-Ph	NH	412
101	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	386
102	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	398
103	H	Me	2,6-di-F-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
104	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	382
105	H	Me	2,6-di-F-4-$OS(O)_2CF_3$	2,4-di-F-Ph	NH	484
106	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	361

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-	NH	386
107				piridin-3-yl		
	H	c-Pr	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	378
108						
	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-F-	NH	355
109				piridin-2-yl		
110	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-Ph	NH	***
111	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	NH	***
112	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
113	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-4-OMe-Ph	NH	***
114	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	***
115	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-Ph	NH	***
116	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-5-CN-Ph	O	360
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	2-Cl-4-CN-Ph	NH	389
117			Ph			
118	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
119	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-NO_2-Ph	O	396
120	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	361
121	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-NO_2-Ph	O	398
122	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-NO_2-Ph	O	380
123	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-Cl-Ph	NH	***
124	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Me-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
125	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-3-F-Ph	NH	***
126	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
127	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-3-OMe-Ph	NH	373
128	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	NH	367
129	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	***
130	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	***
131	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-NO_2-Ph	O	***
132	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4,5-tri-F-Ph	NH	370
133	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
134	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	***
135	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Me-4-NO_2-Ph	O	***
136	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-Ph	NH	***
137	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
138	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***
139	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	376
140	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	392
141	H	Me	2,6-di-F-4-OEt-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	380
142	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	5-Cl-2-F-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
143	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	***
144	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	***
145	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
146	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
147	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
148	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	378
149	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-CN-Ph	O	360
150	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	401
151	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-4-NO_2-Ph	O	***
152	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	383
153	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	429
154	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	NH	353
155	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	390
156	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-4-NO_2-Ph	O	***
157	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	***
158	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NEt	410
159	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-	NCH_2C	422

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
				Ph	$H=CH_2$	
160	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	364
161	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	364
162	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	375
163	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	403
164	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
165	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
166	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	429
167	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	O	373
168	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	367
169	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	369
170	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	362
171	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	370
172	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	352
173	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	352
174	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	382
175	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
176	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	364
177	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
178	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
179	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
180	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***
181	H	Me	2-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	318
182	H	Me	2-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	336
183	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	348
184	H	Me	2-F-Ph	4-F-Ph	NH	300
185	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	379
186	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
187	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Me-Ph	O	***
188	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Me_Ph	O	363
189	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	O	354
190	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	382
191	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	369
192	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
193	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
194	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	***
195	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
196	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	343
197	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
198	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
199	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-F-2-OMe-Ph	NH	***
200	H	Me	2,6-di-F-Ph	3-OMe-Ph	NH	***
201	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
202	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
203	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
204	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
205	H	Me	2,3-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	318
206	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	365
207	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
208	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	381
209	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
210	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
211	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
212	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
			Ph			
213	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-Ph	O	349
214	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
215	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
216	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
217	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	4-Cl-3-CN-Ph	O	***
218			Ph			
219	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Me-Ph	O	333
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	3-Me-Ph	O	345
220			Ph			
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	3-OMe-Ph	O	361
221			Ph			
222	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-Ph	O	344
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	3-CN-Ph	O	356
223			Ph			
224	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***
225	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***
226	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
227	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
228	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***
229	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
230	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
231	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
232	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	423
233	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	423
234	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-3-CN-Ph	NH	359
235	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	375
236	H	Me	2-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	384
237	H	Me	2-CF_3-Ph	4-F-Ph	NH	350
238	H	Me	2-CF_3-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
239	H	Me	2-CF_3-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
240	H	Me	2-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
241	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Cl-piridin-2-yl	NH	353
242	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
243	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
244	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
245	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
246	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	***
247	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
248	H	Me	2-Br-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	398
249	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	3-OMe-4-Me-Ph	O	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
			Ph			
250	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***
	H	Me	2-CF_3-Ph	3,5-di-Cl-	NH	401
251				piridin-2-yl		
	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-Cl-	NH	387
252				piridin-2-yl		
253	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	402
254	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	4-F-Ph	NH	368
255	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
256	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-	NH	***
257				Ph		
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	4-Br-3-CN-Ph	O	***
258			Ph			
	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-	3-CN-4-Me-Ph	O	***
259			Ph			
	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-F-5-CF_3-	O	449
260				piridin-2-yl		
	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-Cl-5-CF_3-	O	465
261				piridin-2-yl		
262	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	404
263	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-OMe-	NH	416

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
264	H	Me	2-F-6-CF_3-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	NH	387
265	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	413
266	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	415
267	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	399
268	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-pyrimidin-5-yl	NH	***
269	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Me-pyrimidin-5-yl	NH	***
270	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	pyrimidin-5-yl	NH	***
271	H	Me	2-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
272	H	Me	2-Br-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
273	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
274	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
275	H	Me	2,5-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
276	H	Me	2-Cl-5-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
277	H	Me	2-Cl-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
278	H	Me	2-F-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
279	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	NH	353

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
280	H	Me	2-CF_3-Ph	3,5-di-F-piridin-2-yl	NH	369
281	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
282	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	397
283	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	386
284	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	406
285	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	422
286	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	386
287	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386
288	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	346
289	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
290	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***
291	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	***
292	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	431
293	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NMe	***
294	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NEt	***
295	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	430
296	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	413
297	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	370
298	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
299	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	383
300	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
301	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***
302	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
303	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	400
304	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	$NS(O)_2Me$	***
305	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
306	H	Me	2-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
307	H	Me	2-Cl-5-CF_3-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
308	H	Me	2-Cl-piridin-3-yl	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
309	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH_2OMe	***
310	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	372
311	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	388
312	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	398
313	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	458
314	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	414
315	H	Me	2-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
316	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	448

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
317	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	392
318	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	433
319	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	418
320	H	Me	2-Cl-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	368
321	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	369
322	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	380
323	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	459
324	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	425
325	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OEt-Ph	NH	394
326	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH_2CN	409
327	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
328	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-yl	NH	369
329	H	Me	2,5-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
330	H	Me	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	395
331	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	359
332	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	393
333	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
334	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
335	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	359
336	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	393
337	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-F-Ph	NH	***
338	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	375
339	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
340	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	***
341	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
342	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
343	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	369
344	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO_2-Ph	NH	380
345	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-5-NO_2-Ph	NH	380
346	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	398
347	H	Me	4-Cl-2-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
348	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-6-Cl-4-F-Ph	NH	432
349	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
350	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	CHOH	349
351	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	**
(Ex. 6)						
352	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	CHOH	383
353	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
354	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
355	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
356	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	CHOH	385
357	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
358	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	360
359	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	376
360	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	432
361	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344
362	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	394
363	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
364	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	416
365	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	432
366	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	414
367	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	402
368	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
369	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
370	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	C(=O)	**
(Ex. 7)						
371	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NH_2-Ph	O	**
(Ex. 9)						
372	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-CN-Ph	O	
373	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	
374	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
375	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
376	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
377	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
378	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	
379	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
380	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
381	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	CHOH	402
382	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	
383	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	NH	
384	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	CHOH	
385	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH	
386	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH	
387	H	Me	2-Cl-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	350
388	H	Me	2-Cl-4-OCH_2CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	389
389	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-4-F-Ph	NH	396
390	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	448
391	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	***
392	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	***
393	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OEt	NH	360
394	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F	O	369
395	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
396	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
397	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386
398	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
399	H	Me	2,6-di-F-4-($OCH_2CH_2CH_2NMe_2$)-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	445
400	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
401	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
402	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	474
403	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	464
404	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
405	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	404
406	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
407	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	414
408	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	508
409	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	458
410	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	420
411	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
412	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	430
413	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	474

Comp. núm.	R^1	R^2	Q^1	Q^2	X	M.S
414	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	464
415	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-2-I-Ph	NH	444
416	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Me-Ph	NH	342
417	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
418	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
419	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOAc	409
420	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	piridin-2-yl	CHOH	332
421	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	CHOH	384
422	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	CHOH	385
423	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	CHOH	374
424	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-6-I-Ph	NH	478
425	H	Me	2-Cl-4-($OCH_2CH_2CH_2NHMe$)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	421
426	H	Me	2-Cl-4-($OCH_2CH_2CH_2OMe$)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	422
427	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366
428	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	CHOH	382

* Datos de ^{1}H NMR incluidos en la Tabla índice B

** Datos de AP^+ o datos de ^{1}H NMR incluidos en los Ejemplos de síntesis

*** Datos de MP incluidos en la Tabla índice C

Tabla B

Comp. núm.	Datos de ^{1}H RMN (solución de $CDCl_3$ a menos que se indique de cualquier otra forma)[a]
3	δ 7,11 (m, 1H), 6,99 (m, 1H), 6,75-6,85 (m, 3H), 6,58 (m, 1H), 6,40 (m, 1H), 3,58 (s, 3H), 3,07 (s, 3H), 2,21 (s, 3H).

a. ^{1}H RMN Los datos están en ppm a campo bajo de tetrametilsilano. Los acoplamientos se designan como (s)-singulete y (m)-multiplete.

Tabla índice C

Comp. núm.	Temperatura de fusión [b]	Comp. núm.	Temperatura de fusión	Comp. núm.	Temperatura de fusión
110	85-87	197	115-117	271	132-135
111	165-167	198	106-108	272	132-134
112	80-82	199	134-136	273	152-153
113	135-137	200	139-141	274	141-143
114	147-149	201	109-111	275	168-171
115	168-170	207	57-59	276	115-117
123	171-173	209	92-96	277	131-134
124	135-137	210	73-77	278	112-114
125	138-140	211	110-114	281	49-52
126	142-144	212	130-134	289	148-150
129	127-130	214	105-107	290	181-183
130	129-131	215	90-92	291	146-149

Comp. núm.	Temperatura de fusión [b]	Comp. núm.	Temperatura de fusión	Comp. núm.	Temperatura de fusión
131	129-133	216	152-154	293	116-118
133	160-162	217	72-76	294	113-115
134	228-230	218	112-117	300	178-180
135	112-117	224	132-135	301	168-170
136	152-154	225	123-126	304	186-191
137	165-167	226	139-141	305	101-105
138	171-173	227	99-102	306	134-138
142	186-188	228	133-135	307	161-166
143	93-95	229	144-146	308	142-145
144	176-178	231	108-110	309	118-123
145	142-144	242	91-93	327	118-120
146	145-147	243	82-84	329	98-100
147	60-62	244	95-97	333	177-179
151	150-158	245	73-75	334	117-119
156	107-114	246	182-184	337	186-188
157	96-101	247	156-158	339	135-136
164	106-110	249	83-87	340	137-139
165	111-113	250	126-129	341	151-153
178	110-112	256	171-173	353	169-171
179	105-107	257	172-174	354	111-113
180	130-132	258	121-124	355	90-92
186	78-84	259	97-100	363	229-231

Comp. núm.	Temperatura de fusión [b]	Comp. núm.	Temperatura de fusión	Comp. núm.	Temperatura de fusión
187	107-113	268	178-180	391	181-183
194	133-135	269	80-85	392	155-157
195	98-100	270	172-176		

[b] Los datos de la temperatura de fusión se expresan en °C.

Ejemplos biológicos de la invención

Protocolo general para preparar suspensiones de prueba para las Pruebas A-J: los compuestos de la prueba se disolvieron primero en acetona en una cantidad igual a 3 % del volumen final y, después, se suspendieron a la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (50/50 mezcla por volumen) que contiene 250 ppm del surfactante Trem® 014 (ésteres de alcohol polihídrico). Después, las suspensiones de prueba resultantes se usaron en las Pruebas A-J. El rociado de una suspensión de prueba de 200 ppm en exceso sobre plantas de prueba fue el equivalente a una concentración de 500 g/ha. A menos que se indique de cualquier otra forma, los valores de la clasificación indican que se usó una suspensión de prueba de 200 ppm. (Un asterisco "*" a continuación del valor de clasificación indica que se usó una suspensión de prueba de 40 ppm).

Prueba A

Se inocularon plántulas de uva con una suspensión de esporas de *Plasmopara viticola* (el agente causal del oídio de la vid) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h. Después de un periodo breve de secado, la suspensión de prueba se roció en exceso sobre las plántulas de uva y, después, las plántulas se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 4 días, después de lo cual las unidades de prueba se colocaron nuevamente en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h. Al removerlas, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba B

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de tomate. Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* (el agente causal de la botrytis del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 48 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 24 °C durante otros 3 días. Después de ese tiempo, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba C

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de tomate. Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* (el agente causal del tizón temprano del tomate), se

incubaron en una atmósfera saturada a 27 °C durante 48 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días. Transcurrido este periodo, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba D

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de tomate. Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal del tizón tardío del tomate), se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 5 días. Transcurrido este periodo, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba E

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de agrostis rastrera (esp. *Agrostis*). Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de avena y micelas de *Rhizoctonia solani* (el agente causal de la rizoctonia del césped), se incubaron en una atmósfera saturada a 27 °C durante 48 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 27 °C durante 3 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba F

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de trigo. Al día siguiente se inocularon las

plántulas con una suspensión de esporas de *Septoria nodorum* (el agente causal del tizón de la gluma de *Septoria*), se incubaron en una atmósfera saturada a 24 °C durante 48 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba G

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de trigo. Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de esporas de *Septoria tritici* (el agente causal del tizón de la gluma del trigo), se incubaron en una atmósfera saturada a 24 °C durante 48 h. y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante otros 19 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba H

Se inocularon plántulas de trigo con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. esp. *tritici* (el agente causal de la roya de la hoja del trigo), se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 2 días. Al final de este periodo, la suspensión de prueba se roció en exceso y las plántulas se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba I

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de trigo. Al día siguiente se inocularon las plántulas con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. esp. *tritici* (el agente causal de la roya de la hoja del trigo), se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h y después se llevaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 7 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Prueba J

La suspensión de prueba se roció en exceso sobre plántulas de trigo. Al día siguiente se inocularon las plántulas con un polvo de esporas de *Erysiphe graminis* f. esp. *tritici*, (el agente causal del oídio del trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20 °C durante 8 días. Transcurrido este período, se realizó visualmente la calificación de la enfermedad.

Los resultados de las Pruebas A-J se proporcionan en la Tabla A. En la tabla, una calificación de 100 indica 100 % de control de enfermedad, y una calificación de 0 indica que no hay control de la enfermedad (en comparación con las plantas testigo). Un guión (-) indica que no hay resultados de la prueba.

Tabla A

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
1	0	99	0	0	47	0	99	-	0	98
2	8	1	0	0	0	0	0	-	0	0
3	6	0	25	9	0	0	13	-	0	99
4	29	87	46	0	0	0	98	-	53	97
5	36	0	25	0	0	0	0	-	0	0
6	65	10	23	0	0	0	0	-	0	93
7	29	99	0	0	63	0	100	-	74	92
8	55	99	54	0	99	0	100	-	97	99
9	-	99	0	0	55	0	100	-	98	97
10	-	47	0	0	0	0	0	-	0	0
11	-	99	99	0	99	0	100	-	99	100
12	-	99	93	0	99	0	100	-	99	100
13	-	99	100	0	98	64	100	-	100	99
14	-	98	0	-	-	0	99	-	99	98

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
15	-	99	67	-	-	73	99	-	98	99
16	-	60	0	-	-	0	47	48	28	0
17	-	100	100	-	-	93	97	96	100	100
18	-	99	100	-	-	99	95	99	100	100
19	-	100	85	-	-	0	96	0	92	98
20	-	100	99	-	-	100	100	79	100	99
21	-	98	100	-	-	97	-	-	100	99
22	-	90	85	-	-	90	94	9	94	100
23	-	98	100	-	-	99	93	92	100	100
24	-	98	100	-	-	0	94	9	97	100
25	-	100	0	-	-	0	100	0	94	79
26	-	99	83	-	-	0	100	0	99	100
27	-	99	88	-	-	0	95	0	25	87
28	-	99	0	-	-	0	96	7	91	0
29	-	94	0	-	-	0	98	0	46	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
30	-	7	0	-	-	0	41	0	79	0
31	-	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
32	-	99	0	-	-	0	96	0	99	97
33	-	0	0	-	-	0	95	0	18	0
34	-	100*	97*	-	-	0*	96*	0*	76*	0*
35	-	100	0	-	-	0	95	0	97	100
36	-	100	0	-	-	0	96	0	96	98
37	0	0	0	0	0	0	3	-	0	0
38	-	99	9	-	-	0	97	0	99	99
39	-	100	99	-	-	0	99	99	99	99
40	-	99	0	-	-	0	94	92	99	99
41	-	100	99	-	-	90	94	0	100	99
42	-	100	0	-	-	0	93	0	94	82
43	-	76	0	-	-	0	97	66	82	99
44	-	82	0	-	-	0	96	7	9	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
45	-	100	100	-	-	100	100	7	100	100
46	-	99	100	-	-	99	100	37	100	99
47	-	100*	87*	-	-	0*	99*	37*	96*	99*
48	-	100	78	-	-	0	99	0	98	98
49	-	100	17	-	-	35	99	0	89	79
50	-	99	57	-	-	0	100	0	98	99
51	-	100	0	-	-	0	100	0	89	78
52	-	54	0	-	-	0	97	0	92	64
53	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
54	-	96	0	-	-	0	41	0	95	95
55	-	6	0	-	-	0	98	0	41	73
56	-	43	0	-	-	0	99	0	28	64
57	-	98	0	-	-	0	94	85	85	0
58	-	98	100	-	-	89	98	82	100	100
59	-	94	0	-	-	0	88	0	68	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
60	-	75	0	-	-	0	97	59	79	0
61	-	97	0	-	-	0	99	0	38	73
62	-	99	98	-	-	84	98	98	99	99
63	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
64	-	97	80	-	-	0	100	0	95	98
65	-	0	0	-	-	0	1	0	58	0
66	-	100	99	-	-	0	100	6	100	99
67	-	95	0	-	-	0	99	24	95	86
68	-	0	0	-	-	0	0	6	0	0
69	-	100	73	-	-	60	99	91	99	100
70	-	99	0	-	-	0	99	41	85	98
71	-	93	0	-	-	0	96	0	91	67
72	-	0	0	-	-	0	0	59	0	0
73	-	100	99	-	-	64	100	88	100	99
74	-	0	0	-	-	0	25	4	0	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
75	-	100	98	-	-	98	99	95	99	97
76	-	100	0	-	-	0	98	6	0	0
77	-	99	0	-	-	0	95	6	97	0
78	-	99	82	-	-	0	98	0	89	91
79	-	99	0	-	-	0	99	0	55	0
80	-	100	0	-	-	0	99	18	86	89
81	-	97	0	-	-	0	0	0	27	0
82	-	100	100	-	-	40	99	0	68	13
83	-	100	100	-	-	89	99	99	96	94
84	-	100	100	-	-	78	100	98	100	99
85	-	0	0	-	-	0	17	0	19	0
86	-	0	0	-	-	0	48	0	0	0
87	-	100	100	-	-	95	98	85	99	100
88	-	100	100	-	-	99	98	95	99	100
89	-	99	0	-	-	0	99	0	0	97

530

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
90	-	99	95	-	-	84	100	0	98	100
91	-	100	99	-	-	95	99	0	100	100
92	-	100	100	-	-	99	100	41	99	100
93	-	41	0	-	-	0	77	0	9	0
94	-	99	70	-	-	29	98	0	9	0
95	-	99	16	-	-	0	97	0	0	0
96	-	99	99	-	-	99	100	9	99	100
97	-	100	99	-	-	95	100	0	99	99
98	-	100	17	-	-	69	100	26	99	99
99	-	100	99	-	-	100	99	40	100	100
100	-	38	0	-	-	0	48	0	41	0
101	-	100	99	-	-	100	100	99	99	100
102	-	100	100	-	-	98	99	0	100	98
103	-	100	64	-	-	0	95	0	91	0
104	-	100	99	-	-	97	99	99	99	100

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
105	-	23	0	-	-	0	73	9	0	72
106	-	100	99	-	-	90	100	82	99	100
107	-	99*	0*	-	-	0*	99*	8*	24*	0*
108	-	97	0	-	-	0	98	0	16	97
109	-	100	99	-	-	97	100	99	100	100
110	-	99	66	-	-	98	99	0	97	94
111	-	99	75	-	-	90	99	0	97	99
112	-	100	98	-	-	99	99	53	100	100
113	-	99	47	-	-	0	100	8	95	48
114	-	99	24	-	-	69	99	8	99	84
115	-	99	0	-	-	0	100	0	91	0
116	-	100	94	-	-	73	100	16	97	99
117	-	99	97	-	-	82	100	11	98	97
118	-	100	100	-	-	98	100	99	100	99
119	-	100	0	-	-	0	100	16	99	96

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
135	-	0	0	-	-	0	97	16	74	95
136	-	99	71	-	-	86	99	0	99	100
137	-	96	97	-	-	78	99	8	100	100
138	-	99	96	-	-	84	99	38	100	98
139	-	100	86	-	-	100	100	69	99	100
140	-	99	94	-	-	87	99	0	96	97
141	-	99	99	-	-	98	100	0	99	100
142	-	33	13	-	-	20	99	0	95	90
143	-	99	99	-	-	100	100	63	100	100
144	-	99	9	-	-	40	99	0	98	91
145	-	96	98	-	-	100	100	88	100	100
146	-	99	0	-	-	0	99	0	97	56
147	-	99	88	-	-	100	100	0	98	92
148	-	99	99	-	-	100	100	61	100	99
149	-	100	98	-	-	100	100	99	100	100

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
150	-	19	0	-	-	60	7	0	74	50
151	-	99	9	-	-	0	96	0	54	64
152	-	100	82	-	-	87	99	9	97	99
153	-	100	0	-	-	73	100	0	96	98
154	-	99	99	-	-	97	100	41	100	100
155	-	100	99	-	-	100	100	92	100	99
156	-	94	0	-	-	0	73	0	41	47
157	-	0	0	-	-	0	0	0	54	73
158	-	100	0	-	-	0	99	18	99	98
159	-	99	0	-	-	0	100	74	99	100
160	-	98	99	-	-	0	99	8	100	100
161	-	98	100	-	-	0	100	95	100	98
162	-	99	0	-	-	0	99	8	98	94
163	-	0	9	-	-	0	83	0	88	0
164	-	49	57	-	-	0	99	15	9	97

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
165	-	0	0	-	-	0	52	8	0	99
166	-	0	0	-	-	0	97	0	68	96
167	-	75	0	-	-	0	0	0	0	0
168	-	14	0	-	-	0	33	0	0	0
169	-	24	0	-	-	0	85	0	0	0
170	-	100	99	-	-	99	98	0	100	99
171	-	100	97	-	-	0	97	68	99	100
172	-	100	100	-	-	87	100	0	99	100
173	-	100	86	-	-	0	98	0	83	100
174	-	100	99	-	-	0	96	0	97	99
175	-	100	99	-	-	82	96	93	99	100
176	-	100	71	-	-	0	96	0	68	100
177	-	100	100	-	-	73	98	0	83	100
178	-	100	100	-	-	80	98	0	83	100
179	-	100	99	-	-	73	95	0	93	100

536

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
180	-	100	99	-	-	0	98	0	68	100
181	-	94	44	-	-	0	100	0	60	98
182	-	97	99	-	-	87	100	0	95	99
183	-	97	100	-	-	67	99	27	94	99
184	-	97	0	-	-	0	99	0	82	98
185	-	0	0	-	-	0	100	0	74	98
186	-	0	0	-	-	0	99	0	54	93
187	-	33	0	-	-	0	20	0	9	13
188	-	87	0	-	-	0	100	0	97	97
189	-	99	100	-	-	80	100	99	99	98
190	-	99	99	-	-	80	100	94	100	99
191	-	98	100	-	-	0	100	0	97	99
192	-	97	100	-	-	73	100	0	99	99
193	-	99	100	-	-	0	100	32	99	100
194	-	97	86	-	-	0	99	0	91	99

537

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
195	-	100	97	-	-	60	100	0	98	97
196	-	99	94	-	-	73	100	9	98	98
197	-	97	0	-	-	95	99	0	79	96
198	-	97	68	-	-	0	100	0	94	97
199	-	99	86	-	-	0	99	0	68	98
200	-	82	0	-	-	0	97	0	0	94
201	-	99	97	-	-	20	100	18	97	99
202	-	99	0	-	-	0	99	0	28	99
203	-	99	0	-	-	0	98	0	96	100
204	-	100*	77*	-	-	0*	99*	0*	86*	99*
205	-	100	17	-	-	0	99	0	91	100
206	-	99	99	-	-	84	99	41	99	100
207	-	100	93	-	-	64	100	0	99	100
208	-	100	100	-	-	99	100	0	99	99
209	-	0	0	-	-	0	0	0	0	97

528

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
210	-	0	0	-	-	0	100	99	94	99
211	-	77	0	-	-	0	99	0	17	96
212	-	0	17	-	-	-	98	0	-	-
213	-	97	30	-	-	0	85	94	96	100
214	-	98	51	-	-	0	100	9	99	100
215	-	89	0	-	-	0	98	0	94	99
216	-	96	0	-	-	0	76	0	26	99
217	-	75	0	-	-	0	83	40	79	99
218	-	94	0	-	-	0	99	17	92	87
219	-	70	0	-	-	0	0	17	0	0
220	-	98	97	-	-	40	98	40	99	100
221	-	98	94	-	-	82	100	17	99	100
222	-	99	99	-	-	0	100	88	99	100
223	-	96	9	-	-	99	100	0	100	100
224	-	99	51	-	-	0	100	17	91	100

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
225	-	65	0	-	-	0	99	0	79	98
226	-	99	0	-	-	0	96	28	91	100
227	-	87	0	-	-	0	99	0	74	98
228	-	99	99	-	-	0	99	0	80	99
229	-	99	17	-	-	0	99	0	91	98
230	-	99	99	-	-	0	100	0	97	100
231	-	98	34	-	-	0	100	0	86	100
232	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
233	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
234	-	99	0	-	-	0	99	0	92	84
235	-	84	0	-	-	0	17	0	0	79
236	-	97	0	-	-	0	96	0	68	97
237	-	99	0	-	-	0	97	0	68	97
238	-	99	0	-	-	0	0	53	9	43
239	-	99	95	-	-	0	67	0	68	100

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
240	-	100	99	-	-	0	99	0	99	100
241	-	99	99	-	-	0	100	97	100	100
242	-	99	37	-	-	0	100	0	91	100
243	-	100	64	-	-	0	100	0	97	100
244	-	82	0	-	-	0	91	0	0	96
245	-	90	0	-	-	0	97	0	68	93
246	-	99	51	-	-	0	100	0	80	100
247	-	100	99	-	-	60	100	0	99	100
248	-	99	26	-	-	73	100	0	99	100
249	-	40	0	-	-	0	99	0	96	100
250	-	98	0	-	-	0	77	0	86	100
251	-	99	0	-	-	0	98	0	86	100
252	-	100	97	-	-	0	100	0	100	100
253	-	99	0	-	-	0	0	0	0	76
254	-	100	0	-	-	0	84	0	0	64

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
255	-	100	0	-	-	0	0	0	0	39
256	-	99	99	-	-	96	100	0	99	100
257	-	100	99	-	-	0	100	0	97	98
258	-	41	9	-	-	0	89	0	68	90
259	-	98	9	-	-	0	100	0	86	97
260	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
261	-	0	0	-	-	0	0	0	0	47
262	-	99	51	-	-	0	0	0	68	99
263	-	100	98	-	-	0	100	0	98	100
264	-	100	98	-	-	0	92	0	99	98
265	-	100	99	-	-	78	100	90	100	100
266	-	100	100	-	-	98	100	0	100	100
267	-	100	79	-	-	60	100	0	96	93
268	-	95	93	-	-	0	99	0	74	0
269	-	80	0	-	-	0	67	8	0	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
270	-	92	86	-	-	0	91	8	0	81
271	-	100	99	-	-	99	100	0	99	98
272	-	100	97	-	-	99	99	0	99	99
273	-	0	0	-	-	0	72	0	27	43
274	-	8	0	-	-	0	96	8	0	69
275	-	97	46	-	-	0	99	8	97	99
276	-	100	99	-	-	98	100	31	100	100
277	-	100	0	-	-	0	100	0	96	98
278	-	99	0	-	-	0	99	0	82	100
279	-	100	99	-	-	0	100	8	98	100
280	-	99	0	-	-	0	96	8	18	87
281	-	98	44	-	-	0	-	0	94	98
282	-	99	98	-	-	0	-	0	99	100
283	-	99	65	-	-	0	-	9	99	100
284	-	99	99	-	-	100	-	28	100	100

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
285	-	98	0	-	-	60	-	9	99	99
286	-	98*	85*	-	-	60*	-	100*	100*	100*
288	9	99	52	0	92	0	-	-	74	92
289	-	100	0	-	-	0	99	0	96	97
290	-	100	99	-	-	87	100	0	100	100
291	-	99	0	-	-	0	98	0	85	43
292	-	100	99	-	-	96	100	92	100	100
293	0	97	47	0	99	0	-	-	94	99
294	0	98	0	0	80	0	-	-	0	84
296	-	99	0	-	-	0	100	0	99	-
297	-	100	99	-	-	90	100	0	100	100
298	-	100	93	-	-	87	100	0	100	100
299	-	100	95	-	-	51		41	100	100
300	-	100	99	-	-	82	100	9	99	100
301	-	99	87	-	-	87	100	0	98	99

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
302	-	99*	0*	-	-	0*	99*	0*	18*	97*
303	-	99	0	-	-	0	98	0	92	71
304	-	0	0	-	0	0	16	-	0	0
305	-	99	99	-	-	94	100	0	99	99
306	-	7	0	-	-	0	93	0	28	64
307	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
308	-	81	0	-	-	0	98	9	100	0
309	-	97	61	-	92	60	100	-	0	99
310	-	100	99	-	-	99	100	0	99	96
311	-	100	0	-	-	60	100	0	99	91
313	-	100	97	-	-	51	100	91	100	100
314	-	100	95	-	-	0	100	94	100	100
315	-	99	99	-	-	0	100	0	96	100
316	-	99	0	-	-	0	-	9	99	96
318	-	99	0	-	-	0	100	0	97	89

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
319	-	92	88	-	-	100	100	0	99	95
320	-	99	67	-	-	0	100	0	99	98
321	-	100	99	-	-	78	100	9	99	100
322	-	100	93	-	-	0	100	99	100	100
323	-	98	0	-	-	0	98	0	94	-
324	-	99	83	-	-	0	100	63	99	99
325	-	100	0	-	-	0	100	0	97	99
326	8	99	99	0	99	73	100	-	99	94
327	-	99	0	-	-	0	100	0	96	99
328	-	100	86	-	-	0	100	0	98	100
329	-	100	99	-	-	69	100	0	100	100
331	-	100	80	-	-	73	100	8	100	97
333	-	100	0	-	-	0	100	9	74	0
334	-	100	0	-	-	0	100	0	97	100
336	-	100	97	-	-	95	100	94	100	99

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
337	-	99	0	-	-	0	99	9	41	98
338	-	100	37	-	-	40	100	8	100	99
339	-	100	0	-	-	0	100	0	98	100
340	-	99	0	-	-	0	100	0	91	100
341	-	99	0	-	-	0	99	0	99	93
342	-	100	33	-	-	99	100	0	100	100
343	-	100	100	-	-	97	100	91	100	100
344	-	100	40	-	-	87	100	62	100	100
345	-	0	0	-	-	0	67	0	9	0
348	-	100	80	-	-	94	100	19	100	100
350	-	99	9	-	-	0	-	9	96	0
351	-	100	99	-	-	92	-	96	100	99
353	-	97	17	-	-	0	99	3	99	99
354	-	99	0	-	-	0	100	82	98	100
355	-	99	0	-	-	0	100	3	91	0

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
356	-	100	0	-	-	0	-	100	100	0
357	-	100	86	-	-	87	100	0	99	100
358	-	99	0	-	-	0	100	0	97	97
359	-	100	99	-	-	97	100	0	100	99
360	-	100	97	-	-	95	100	79	100	100
361	-	100	90	-	-	0	100	0	100	100
362	-	100	0	-	-	0	100	0	96	96
363	-	65	0	-	-	0	99	0	96	43
364	-	99	97	-	-	88	100	0	99	100
365	-	100	99	-	-	64	100	74	100	100
366	-	100	58	-	-	0	100	9	99	100
367	-	100	100	-	-	100	-	100	100	100
369	-	100	66	-	-	0	-	17	100	99
389	-	100	9	-	-	0	-	68	98	99
391	-	100	99	-	-	73	-	31	99	99

548

Comp. núm.	PRUEBA A	PRUEBA B	PRUEBA C	PRUEBA D	PRUEBA E	PRUEBA F	PRUEBA G	PRUEBA H	PRUEBA I	PRUEBA J
403	-	99	0	-	-	0	-	99	100	99

"Núm. del comp." significa número del compuesto y se refiere al mismo número del compuesto indicado en la Tabla índice A.

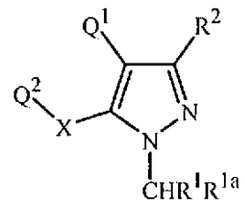
Sn9

Se hace constar que con relación a esta fecha, el mejor método conocido por la solicitante para llevar a la práctica la citada invención, es el que resulta claro de la presente descripción de la invención.

REIVINDICACIONES

Habiéndose descrito la invención como antecede, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes reivindicaciones:

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula **1**, *N*-óxidos y sales de estos,



1

en donde

Q^1 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde

hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

Q^2 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos

seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno; o alquilo de C_1-C_{12}, alquenilo de C_2-C_{12}, alquinilo de C_2-C_{12}, cicloalquilo de C_3-C_{12} o cicloalquenilo de C_3-C_{12}; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S);

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, cicloalquilo de C_3-C_7, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5; o

R^1 es fenilo sustituido opcionalmente con hasta 3 R^8; o un heterociclo aromático de cinco o seis miembros que contiene nitrógeno sustituido opcionalmente con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros de anillo de los átomos de carbono y R^{9b} en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

R^{1a} es H; o

R^{1a} y R^1 se toman junto con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo de ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, halógeno, ciano, cianometilo, halometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, formilamino, alquilcarbonilamino de C_2-C_3, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, alquilsulfoniloxi de C_1-C_2, haloalquilsulfoniloxi de C_1-C_2, cicloalquilo de C_3-C_4, cicloalcoxi de C_3-C_7, alquilcicloalquilo de C_4-C_6, cicloalquilalquilo de C_4-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_7, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, hidroxi, formilo, alquilcarbonilo de C_2-C_3, alquilcarboniloxi de C_2-C_3, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ o -U-V-T;

R^4 es H, formilo, alquenilo de C_2-C_5, alquinilo de C_3-C_5, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3^-M^+$, $-S(=O)_tR^{10}$, $-(C=W)R^{11}$, NH_2 u OR^{21}; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

R^5 es H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

R^6 y R^7 se seleccionan independientemente de H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6,

cicloalquilo de C_3-C_7, cicloalquilalquilo de C_4-C_8 y alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno del anillo conector, seleccionados de átomos de carbono y, opcionalmente, hasta un miembro de anillo seleccionado de O, $S(O)_n$ y NR^{13};

cada R^8, R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2, haloalcoxi de C_1-C_2, ciano, nitro, SCH_3, $S(O)CH_3$ y $S(O)_2CH_3$;

R^{10} es alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6;

cada R^{11} es independientemente alquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_7, alquilaminoalquilo de C_2-C_7, dialquilaminoalquilo de C_2-C_8, alquiltio de C_1-C_6 o alquiltioalquilo de C_2-C_7;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4, haloalcoxi de C_1-C_4, alquiltio de C_1-C_4, alquilsulfinilo de C_1-C_4, alquilsulfonilo de C_1-C_4 o ciano;

R^{13} es H, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_2-C_3;

cada R^{14} es independientemente H, ciano, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_1-C_3;

R^{15} es H, alquilo de C_1-C_4 u OR^{18};

R^{16} es alquilo de C_1-C_4 u OR^{18}; o

R^{15} y R^{16} se toman juntos como $-OCH_2CH_2O-$;

cada R^{18} es independientemente H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3^-M^+$ o $-(C=W)R^{11}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

cada R^{19} y R^{20} es independientemente H o CH_3;

R^{21} es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7, $-SO_3^-M^+$ o $-(C=W)R^{11}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

cada U es independientemente O, $S(=O)_w$, NR^{22} o un enlace directo;

cada V es independientemente alquileno de C_1-C_6, alquenileno de C_2-C_6, alquinileno de C_3-C_6, cicloalquileno de C_3-C_6 o cicloalquenileno de C_3-C_6, en donde hasta 3 átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O); cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxi, alquilo de

C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6 y haloalcoxi de C_1-C_6;

cada T es independientemente ciano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} o $S(=O)_yR^{25}$

cada R^{22} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8; o

un par de R^{23a} y R^{23b} unidos al mismo átomo de nitrógeno se toman junto con el átomo de

nitrógeno para formar un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros; el anillo está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{26};

cada R^{24} y R^{25} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{26} es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alcoxi de C_1-C_6;

cada W es independientemente O o S;

cada M^+ es independientemente un catión;

m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1 o 2;

t es 0, 1 o 2;

cada u y v es independientemente 0, 1 o 2 en cada instancia de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, siempre que la suma de u y v sea 0, 1 o 2;

cada w es independientemente 0, 1 o 2; y

cada y es independientemente 0, 1 o 2;

siempre que:

cuando Q^2 es un anillo de fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de -U-V-T, en donde U es un enlace directo, V es C(=O) y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24}, entonces X es distinto de NR^4.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; siempre que cuando un sustituyente R^3 esté ubicado en una posición meta, entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3, siempre que cuando un sustituyente R^3 esté ubicado en una posición meta, entonces ese sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

X es O, NR^4, C(=O) o $CR^{15}R^{16}$;

R^1 es H, halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, CO_2R^5, $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi de C_1-C_6, haloalcoxi de C_1-C_6 o alcoxialquilo de C_2-C_5;

R^{1a} es H;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, cicloalquilo de C_3-C_4, $C(=S)NH_2$ y -U-V-T;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 2 R^{12};

R^5 es alquilo de C_1-C_6;

R^6 es H o alquilo de C_1-C_6;

R^7 es H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alquilcicloalquilo de C_4-C_8; o

R^6 y R^7 se toman junto con el átomo de nitrógeno al cual están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros de anillo, además del átomo de nitrógeno conector,

seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13};

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo de C_3-C_7, alcoxi de C_1-C_4 o ciano;

R^{13} es H o CH_3;

R^{15} es H o CH_3; y

R^{16} es OR^{18}.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde

Q^1 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo o piridinilo; cada uno está sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

R^1 es H, halógeno o alquilo de C_1-C_6;

R^2 es CH_3, Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3 y -U-V-T;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo de C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo de C_1-C_6 sustituido con un R^{12};

cada R^{12} es independientemente ciclopropilo, $-OCH_3$ o ciano;

R^{15} es H;

cada U es independientemente O o NH;

cada V es alquileno de C_2-C_4;

cada T es independientemente $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24};

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6; y

cada R^{24} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6 o haloalquilo de C_1-C_6.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, en donde

al menos Q^1 o Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

R^1 es H o CH_3;

R2 es CH^3;

R^4 es H;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo de C_1-C_3, haloalquilo de C_1-C_3, alcoxi de C_1-C_3 y haloalcoxi de C_1-C_3; y

R^{18} es H.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en

las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es O, NR^4 o $CR^{15}R^{16}$;

R^1 es H;

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo de C_1-C_2, haloalquilo de C_1-C_2, alcoxi de C_1-C_2 y haloalcoxi de C_1-C_2; y

R^4 es H.

6. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 5, en donde

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi de C_1-C_2 y fluorometoxi.

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, en donde:

X es O o NH; y

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi.

8. Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde se selecciona del grupo:

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-(3,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*1H*-pirazol-5-amina,

4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo,

4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

3-cloro-4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-α-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol,

N,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

3-cloro-4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]amino]-3,5-difluorobenzonitrilo,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-2,5-difluorobenzonitrilo,

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

α,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

3-cloro-4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]benzonitrilo,

3-cloro-4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]benzonitrilo,

N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo,

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

3-cloro-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

N-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
α-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol,
4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo,
4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo,
α-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol,
α-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol, y
α-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-metanol.

9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde el compuesto es 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina.

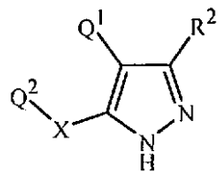
10. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y (b) al menos otro fungicida.

11. Una composición fungicida en donde comprende: (a) un compuesto de conformidad con la reivindicación 1; y (b) al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste de surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

12. Un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos fúngicos de las plantas; el método comprende aplicar a una planta o a una porción de esta, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la reivindicación 1.

13. Una composición en donde comprende un compuesto de conformidad con la reivindicación 1 y al menos un compuesto o agente para controlar la plaga de invertebrados.

14. Un compuesto en donde es un compuesto de la Fórmula 2 o una sal de este



2

en donde

Q^1 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido

opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno;

Q^2 es un sistema anular de fenilo o naftalenilo; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema anular contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros de anillo de los átomos de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$; cada anillo o sistema anular está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 en miembros de anillo de los átomos de carbono y seleccionados de ciano, alquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_2-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, alcoxi de C_1-C_6, alcoxialquilo de C_2-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6,

alquilaminoalquilo de C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo de C_3-C_6 en miembros de anillo de los átomos de nitrógeno; o alquilo de C_1-C_{12}, alquenilo de C_2-C_{12}, alquinilo de C_2-C_{12}, cicloalquilo de C_3-C_{12} o cicloalquenilo de C_3-C_{12}; cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3;

X es NH;

R^2 es CH_3, CH_2CH_3, halógeno, ciano, cianometilo, halometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo sustituido opcionalmente con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, nitro, amino, metilamino, dimetilamino, formilamino, alquilcarbonilamino de C_2-C_3, alquilo de C_1-C_4, haloalquilo de C_1-C_4, alcoxi de C_1-C_3, haloalcoxi de C_1-C_3, alquiltio de C_1-C_3, haloalquiltio de C_1-C_3, alquilsulfinilo de C_1-C_3, haloalquilsulfinilo de C_1-C_3, alquilsulfonilo de C_1-C_3, haloalquilsulfonilo de C_1-C_3, alquilsulfoniloxi de C_1-C_2, haloalquilsulfoniloxi de C_1-C_2, cicloalquilo de C_3-C_4, cicloalcoxi de C_3-C_7, alquilcicloalquilo

de C_4-C_6, cicloalquilalquilo de C_4-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_7, alquenilo de C_2-C_4, alquinilo de C_2-C_4, hidroxi, formilo, alquilcarbonilo de C_2-C_3, alquilcarboniloxi de C_2-C_3, $-SF_5$, -SCN, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ o -U-V-T;

cada R^{14} es independientemente H, ciano, alquilo de C_1-C_3 o haloalquilo de C_1-C_3;

cada R^{19} y R^{20} es independientemente H o CH_3;

cada U es independientemente O, $S(=O)_w$, NR^{22} o un enlace directo;

cada V es independientemente alquileno de C_1-C_6, alquenileno de C_2-C_6, alquinileno de C_3-C_6, cicloalquileno de C_3-C_6 o cicloalquenileno de C_3-C_6, en donde hasta 3 átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O); cada uno está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxi, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alcoxi de C_1-C_6 y haloalcoxi de C_1-C_6;

cada T es independientemente ciano, $NR^{23a}R^{23b}$, OR^{24} o $S(=O)_yR^{25}$

cada R^{22} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6,

(alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

o un par de R^{23a} y R^{23b} unidos al mismo átomo de nitrógeno se toman junto con el átomo de nitrógeno para formar un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros; el anillo está sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{26};

cada R^{24} y R^{25} es independientemente H, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6, alquenilo de C_2-

C_6, alquinilo de C_3-C_6, cicloalquilo de C_3-C_6, halocicloalquilo de C_3-C_6, alquilcarbonilo de C_2-C_6, alcoxicarbonilo de C_2-C_6, (alquiltio)carbonilo de C_2-C_6, alcoxi(tiocarbonilo) de C_2-C_6, cicloalquilcarbonilo de C_4-C_8, cicloalcoxicarbonilo de C_4-C_8, (cicloalquiltio)carbonilo de C_4-C_8 o cicloalcoxi(tiocarbonilo) de C_4-C_8;

cada R^{26} es independientemente halógeno, alquilo de C_1-C_6, haloalquilo de C_1-C_6 o alcoxi de C_1-C_6;

cada u y v es independientemente 0, 1 o 2 en cada instancia de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, siempre que la suma de u y v sea 0, 1 o 2;

cada w es independientemente 0, 1 o 2; y

cada y es independientemente 0, 1 o 2;

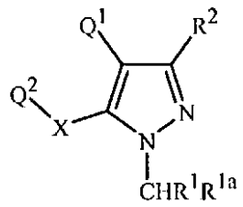
siempre que:

(a) cuando Q^2 es un anillo de fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de -U-V-T, en donde U es un enlace directo y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24}, entonces V es distinto de C(=O); y

(b) cuando Q^1 es fenilo y Q^2 es 4-(trifluorometil)fenilo, entonces R^2 es distinto de metilo.

RESUMEN DE LA INVENCIÓN

La presente invención describe compuestos de la Fórmula (1) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, JV-óxidos y sales de estos,



1

en donde

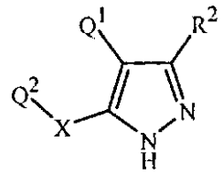
Q^1 es un anillo de fenilo, sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;

Q^2 es un anillo de fenilo, un sistema anular de naftalenilo, un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada uno tal como se describió con sustituyentes opcionales tal como se definió en la descripción;

X es O, $S(O)_m$, NR^4, $CR^{15}R^{16}$, C(=O) o C(=S);

y R^1, R^{1a}, R^2, R^4, R^{15}, R^{16} y m son como los definidos en la descripción.

Además, la presente invención describe composiciones que contienen los compuestos de la Fórmula (1) y métodos para controlar enfermedades de las plantas causadas por un patógeno fúngico; el método comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto o una composición de la invención. Además, la presente invención describe compuestos de la Fórmula (2) que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros y sales de estos,



2

en donde

X es NH; y

Q^1, Q^2 y R^2 son como los definidos para la Fórmula (1);

que son útiles como intermedios para preparar compuestos de la Fórmula (1).

PODERES

TRADUCCIÓN OFICIAL N° 2603081 al español de un documento escrito en inglés, efectuada por Jaime Armando Garavito Burgos, c.c. N° 19.130.702 de Bogotá, Traductor e Intérprete Oficial inglés-español-inglés según Resolución N° 034 de enero 11 de 1983 expedida por el Ministerio de Justicia de la República de Colombia

Traducción al español de legalizaciones en poder conferido por E.I. du Pont de Nemours and Company

---

APOSTILLA

1. País: Estados Unidos de América

   Este documento público

2. Ha sido firmado por Patricia Panariello

3. Quien actúa en calidad de Notario Público del Estado de Delaware

4. Lleva el sello de Patricia Panariello, Notario Público, Delaware

Certificado

5. En Dover, Delaware

6. El séptimo día de marzo 2008 A.D.

7. Por el Secretario de Estado, Departamento de Estado de Delaware

8. N° 0345347

9. Sello (Aparece adherido sello dorado)

10. Firma (firmado) Harriet Smith Windsor, Secretario de Estado

JAIME A. GARAVITO B.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
Res. 034 de Enero 11 de 1983
MINISTERIO DE JUSTICIA

[No se traduce texto del poder por estar en inglés y en español]

Se traduce lo siguiente después del texto del poder:

Dado y suscrito en Wilmington, Delaware, Estados Unidos el

El 26 de febrero de 2008

Firma de la persona que expide el poder
[Firmado] Miriam A. Mecoxnahey

AUTENTICACIÓN COPIA DE ORIGINAL
COMO NOTARIO TREINTA Y OCHO DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.
CERTIFICO QUE PREVIO EL COTEJO RESPECTIVO LA
PRESENTE COPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA, D.C.

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

TRADUCCIÓN OFICIAL N° 2603081 al español de un documento escrito en inglés, efectuada por Jaime Armando Garavito Burgos, c.c. N° 19.130.702 de Bogotá, Traductor e Intérprete Oficial inglés-español-inglés según Resolución N° 034 de enero 11 de 1983 expedida por el Ministerio de Justicia de la República de Colombia

El 26 de febrero de 2008 el suscrito Notario

DA FE

1. Que **Miriam D. Meconnahey**, mayor y domiciliada en **1964 Lakeview Road, Wilmington, DE 19805**, suscribió de su puño y letra el documento que antecede.
2. Que conozco personalmente al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.
3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de **Subsecretario - Junta de Patentes** de la persona jurídica **E.I. du Pont de Nemours and Company**
4. Que la persona jurídica **E.I. du Pont de Nemours and Company** tiene sede en **1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898 Estados Unidos de América**, está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se otorga el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.
5. Que el otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta y que ésta es legítima.
6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhiben para este acto y que relaciono especificamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia:

Directrices de la Junta de Patentes de DuPont y Poder fechado junio 12, 2006.

AUTENTICACION DE COPIA DE ORIGINAL
EL SUSCRITO NOTARIO 38 DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.
CERTIFICA QUE PREVIO EL CUMPLIMIENTO DE LOS REQUISITOS LEGALES
PRESENTE COPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA, D.C.

JAIME A. GARAVITO B
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
Res. 034 de enero 11 de 1983
MINISTERIO DE JUSTICIA

TRADUCCIÓN OFICIAL N° 2603081 al español de un documento escrito en inglés, efectuada por Jaime Armando Garavito Burgos, c.c. N° 19.130.702 de Bogotá, Traductor e Intérprete Oficial inglés-español-inglés según Resolución N° 034 de enero 11 de 1983 expedida por el Ministerio de Justicia de la República de Colombia

[Firmado] Patricia Panariello, Notario Público

[Aparece adherido sello dorado]

La anterior es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

Jaime Armando Garavito Burgos
c.c. N° 19.130.702 de Bogotá
Traductor e Intérprete Oficial según Resolución N° 034 de enero 11 de 1983 expedida por el Ministerio de Justicia

BOGDM5 # 107285

AUTENTICACIÓN DE COPIA DE ORIGINAL
COMO NOTARIO TREINTA Y OCHO DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.
CERTIFICO QUE TUVE A LA VISTA EL COTEJO RESPECTIVO LA
PRESENTE COPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA.
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA, D.C.

JAIME A. GARAVITO B
TRADUCTOR E INTÉRPRETE OFICIAL
Res. 034 de enero 11 de 1983
MINISTERIO DE JUSTICIA

Apostille

(Convention de La Haye du 5 Octobre 1961)

1. Country: United States of America

This public document:

2. has been signed by Patricia Panariello

3. acting in the capacity of Notary Public of the State of Delaware

4. bears the seal/stamp of Patricia Panariello, Notary Public, Delaware

Certified

5. at Dover, Delaware

6. the seventh day of March, A.D. 2008

7. by Secretary of State, Delaware Department of State

8. No. 0345347

9. Seal/Stamp:

10. Signature:

Harriet Smith Windsor

Secretary of State

AUTENTICACION DE COPIA DE ORIGINAL
COMO NOTARIO TREINTA Y OCHO DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C.
CERTIFICO QUE PRESENTE EL COTEJO RESPECTIVO LA
PRESENTE COPIA CONCUERDA CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA, D.C

Av. 82 No. 10 - 62 6th Floor
Bogotá, Colombia

NIT: 900.034.906-9
Tel: +57 1 634 1500
Fax: +57 1 376 2211
www.bakernet.com

583

POWER OF ATTORNEY

The undersigned.

E.I. Du Pont de Nemours and Company
domiciled in

1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898 US

declares that it hereby grants to

ALVARO CORREA-ORDOÑEZ and/or
OLGA GEORGETTE OTERO and/or
RICARDO METKE and/or
JUAN PABLO CONCHA

with domicile at Av. 82 No. 10 – 62, 6Th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models, industrial designs, integrated circuits, layout-designs and vegetal varieties; the registration of trademarks, denominations of origin, commercial names, trade emblems, slogans and domain names; its renewal, assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b)Processes of protection to the consumer, unfair competition, oppositions, cancellations, nullity, precautionary injunctions, infringement, granting of licenses, writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, an administrative processes relating to those rights. And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

I hereby ratify all actions previously taken on behalf of this company by the aforementioned attorneys with respect to the mentioned matters.

Done and subscribed in Wilmington, DE USA

On the 26 day of February of 2008

Signature of the person issuing the Power

Miriam D. Macnamara

PODER DE ABOGADO

La abajo firmada,

E.I. Du Pont de Nemours and Company
domiciliada en

1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898 US

declara por el presente que otorga a

ALVARO CORREA-ORDOÑEZ y/o
OLGA GEORGETTE OTERO y/o
RICARDO METKE y/o
JUAN PABLO CONCHA

con domicilio en la Av. 82 No. 10 – 62 Piso 6 en Bogotá D. C., Colombia, poder especial amplio y suficiente, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera autoridades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, esquemas de trazado de circuitos integrados y variedades vegetales; el registro de marcas, denominaciones de origen, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales y nombres de dominio; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Los procesos para la protección del consumidor, competencia desleal, oposiciones, cancelaciones, nulidades, medidas cautelares, infracciones, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general procesos civiles, penales, administrativos relacionados con estos derechos. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del caso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

Igualmente, ratifico todo lo actuado hasta el momento en los mismos asuntos, por cualquiera de los mencionados apoderados en representación de ésta sociedad.

Dado y firmado en

A los días del mes de de 2008

Firma de la persona que firma el Poder

AUTENTICACIÓN DE COPIA
COMO NOTARIO TREINTA Y OCHO DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C. CERTIFICO QUE PREVIO EL COTEJO RESPECTIVO LA PRESENTE COPIA CORRESPONDE CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA D.C.

NOTARIAL CERTIFICATION

On this 26th day of February

2008 , the undersigned Notary

CERTIFIES

1. That **Miriam D. Meconnahey**

of legal age and domiciled in
1964 Lakeview Road, Wilmington, DE 19805

set his hand on the foregoing document.

2. That the grantor is to me personally known and that he/she has legal capacity to execute the instrument.

3. That the grantor has executed the foregoing document as

Assistant Secretary – Patent Board

of the judicial person **E. I. duPont de Nemours and Company**

4. That the judicial person **E. I. duPont de Nemours and Company**

having its home office in

1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898 USA

is duly organized, has present legal existence and that the purposes for which the power of attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.

5. That the grantor has in fact the referred to authority and that his/her representation is legal.

6. That I have based certifications 3, 4 and 5 above on the following authentic documents for such purpose exhibited to me and which I mention specifically, giving their dates and their origin or source:
DuPont Patent Board Guidelines and Power of Attorney dated June 12, 2006.

Patricia Panariello

Patricia Panariello, Notary Public

CERTIFICACION NOTARIAL

A los días del mes de

de 2008 , el suscrito Notario

DA FE

1 Que

mayor y domiciliado en

suscribió de su puño y letra el documento que antecede.

2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.

3 Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de

de la persona jurídica **E. I. duPont de Nemours and Company**

4 Que la persona jurídica **E. I. duPont de Nemours and Company**

con sede en

está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se otorga el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.

5 Que el otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta y que ésta es legítima.

6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia:

AUTENTICACIÓN DE COPIA DE ORIGINAL
COMO NOTARIO TREINTA Y OCHO DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.
CERTIFICO QUE PREVIO EL COTEJO RESPECTIVO LA
PRESENTE COPIA CONCUERDA CON EL ORIGINAL TENIDO A LA VISTA
30 AGO 2011
Eduardo Durán Gómez
NOTARIO 38 DE BOGOTA, D.C

El Notario Público

CESIÓN DEL INVENTOR
AL SOLICITANTE

Traducción oficial del inglés por Marlén Neira Castro, resolución 2117 del Ministerio de Justicia de Colombia

APOSTILLA

(Convención De La Haya del 5 octubre de 1961)

1. País Estados Unidos de América
2. Este documento Público ha sido firmado por Miriam T. Reed
3. Quien ejerce funciones de notario público del Estado de Delaware
4. Lleva el sello de Miriam T. Reed Notario público de Delaware

CERTIFICADO

5. En Dover, Delaware
6. El 11 de julio de 2011.
7. Por el secretario de estado- Departamento de estado de Delaware
8 No. 0446053
9. Sello del estado de Delaware
10. Firma ilegible J. B

BA9454 PCT Colombia

CESION

A E.I. Dupont de Nemours and Company, una Compañía de Delaware Estados Unidos de América referente a Fungicidas Pirazoles

Firma de los cedentes

Jefrey Keith Long Andrew Edmund Tagg y Wonpyo Hong

LEGALIZACIÓN NOTARIAL:

Estado de Delaware

Condado de New Castle) ss

El 16 de junio de 2011, comparecieron personalmente Jefrey Keith Long Andrew Edmund Tagg- Wonpyo Hong conocidos por mi o quienes demostraron ser las personas que firmaron el documento anterior y reconocieron haberlo suscrito en tal capacidad.

En testimonio mi firma y sello oficial

Firma ilegible de Miriam T. Reed

Notario público de Estado de Delaware.

Sello oficial. Notario público, Su comisión vence el 17-10 - 2011- Sello en relieve.

Es traducción conforme con copia para comparar- Bogotá. Agosto 30- 2011

MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987

Apostille

(Convention de La Haye du 5 Octobre 1961)

1. *Country: United States of America*

This public document:

2. *has been signed by Miriam T. Reed*

3. *acting in the capacity of Notary Public of the State of Delaware*

4. *bears the seal/stamp of Miriam T. Reed, Notary Public, Delaware*

Certified

5. *at Dover, Delaware*

6. *the eleventh day of July, A.D. 2011*

7. *by Secretary of State, Delaware Department of State*

8. *No. 0446053*

9. *Seal/Stamp:*

SECRETARY OF STATE
1776 · DELAWARE · 1970

10. *Signature:*

Secretary of State

ASSIGNMENT

Jeffrey Keith LONG, Wonpyo HONG, Andrew Edmund TAGGI

by means of this document assign to

E. I. du Pont de Nemours and Company

a corporation organized under the laws of

Delaware

domiciled in

1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898
United States of America

(hereinafter referred to as the "ASSIGNEE".), all my (our) rights, title and interest in and to my (our) invention for a new and useful improvement entitled and as fully set forth and described in:

FUNGICIDAL PYRAZOLES

so far as the Republic of Colombia is concerned.

Place: Newark, DE

Date: June 16, 2011

Jeffrey Keith LONG

Wonpyo HONG

CESION

Jeffrey Keith LONG, Wonpyo HONG, Andrew Edmund TAGGI

por medio de la presente cedo (cedemos) a

E. I. du Pont de Nemours and Company
una corporación organizada bajo las leyes de

Delaware

domiciliada en

1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898
Estados Unidos de América

(de ahora en adelante el "CESIONARIO".), todos mis (nuestros) derechos, título e interés sobre mi (nuestra) invención tal como describe en:

FUNGICIDAS PIRAZOLES

en lo que concierne a la República de Colombia.

Lugar y fecha: Newark, DE

Junio 16, 2011

Andrew Edmund TAGGI

LEGALIZATION REQUIRED – NOTARY SIGNATURE/SEAL ON PAGE 2

United States of America)
)
State of Delaware) ss.
)
County of New Castle)

On this 16 day of June, 2011, personally appeared before me Jeffrey Long, Wonpyo Hong, Andrew Taggi

to me known and known to me to be the individual__ described in and who executed the foregoing instrument, and who acknowledged to me that __he__ executed the same.

Miriam T. Reed
Notary Public MIRIAM T. REED
NOTARY PUBLIC
STATE OF DELAWARE
My Commission Expires October 17, 2011

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-112622- -00000-0000

Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 589

Fecha: 2011-09-01 16:20:50 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 588

PATENTE DE INVENCIÓN ☐ **MODELO DE U**

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

Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCIÓN PCT ☑ **MODELO DE UTILIDAD PCT** ☐ **Art.33 Decisión 486/00, Circular Única**

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

Completa ☐ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐ **(Art. 119 Decisión 486/00)**

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

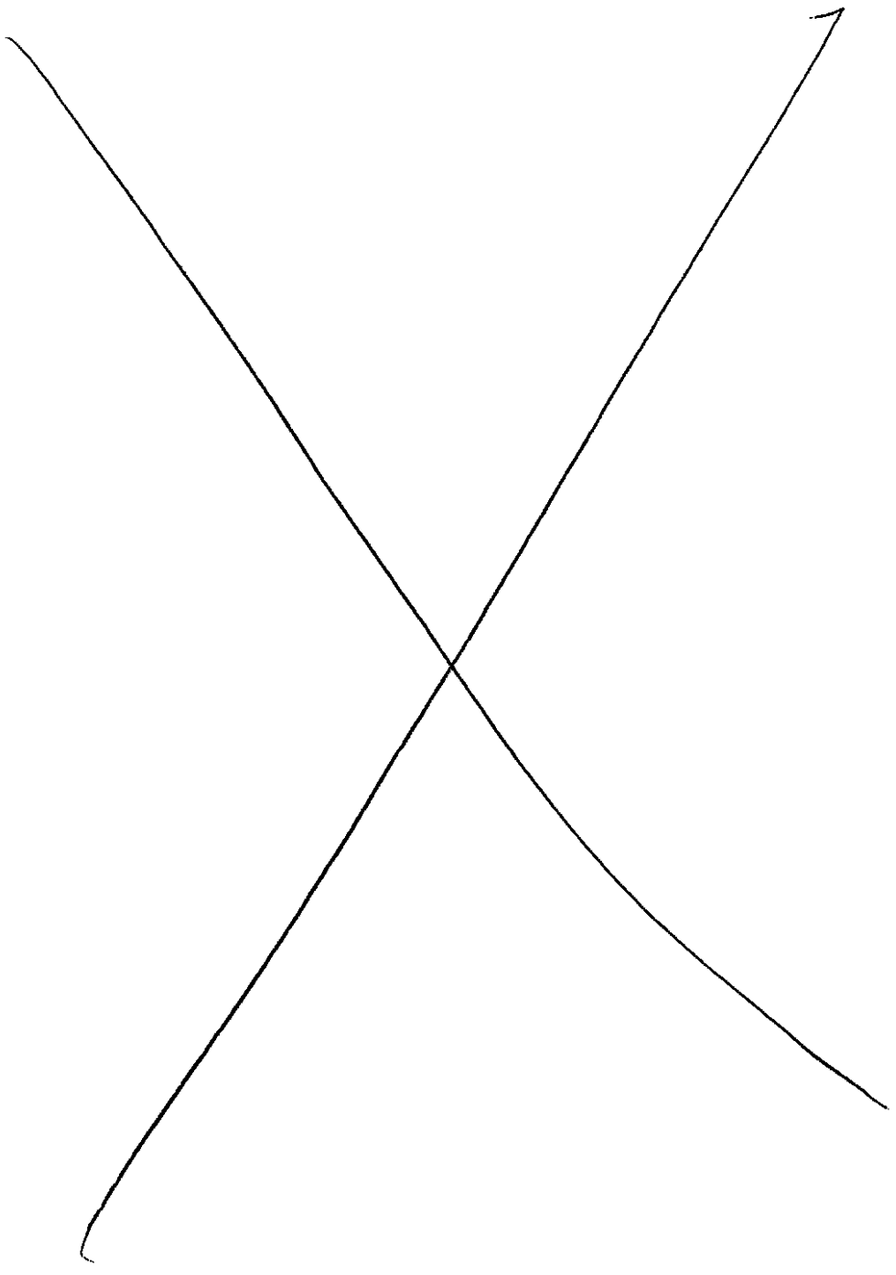
Completa ☐ Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐ **(Art. 92 Decisión 486/00)**

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

Completa ☐ Incompleta ☐

DOCUMENTOS A LA MANO



CONSTANCIA DE INASISTENCIA

Radicación:	10-159005
Trámite:	385
Evento:	362
Actuación:	571
Folios:	266

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 10-159005- -00015-0000

Fecha: 2011-09-01 17:13:48 Dep. 4000 DELEG.JURISDI
Tra. 385 JURISDICCIONAL Eve: 362 DEMANDA
Act. 571 CONSTANNOASIS Folios: 266

En la ciudad de Bogotá, D.C, al primer (1er.) día del mes de septiembre de dos mil once (2011), a las 16:00 h , ante la doctora JENNY PATRICIA MÉNDEZ SERRANO, en calidad de abogada adscrita a la Superintendencia Delegada para Asuntos Jurisdiccionales de la Superintendencia de Industria y Comercio, debidamente designada para actuar en calidad de conciliadora, de conformidad con las facultades establecidas por el artículo 34 de la Ley 640 de 2001, comparecieron de una parte, el señor **HÉCTOR ALEXANDER NIEL LÓPEZ**, identificado con la cédula de ciudadanía 79.619.476, con su apoderado, doctor **LUIS HERNÁN RODRÍGUEZ MANRIQUE**, identificado con la cédula de ciudadanía 88.170.363 y T.P. 152.776 del C. S. de la J., como parte reclamante, y la doctora **ANA VICENTA AGUILLON DE NIETO**, identificada con la cédula de ciudadanía 37.830.762 y T.P. 69.004 del C. S. de la J., en su calidad de apoderada de la sociedad **JAPY ITALIA LTDA. HOY JAPY ITALIA S.A.S.**, identificada con NIT 900.248.110-2, domiciliada en Bogotá, D.C., cuyo representante legal inscrito es el señor **CAMILO MATIZ OVALLE**, no se hace presente, tampoco se acredita que se encuentre él o el primer suplente inscrito fuera del territorio nacional, y

CONSIDERANDO

Que cumplida la fecha y hora se hace constar que se hicieron presentes el señor **HÉCTOR ALEXANDER NIEL LÓPEZ**, y su apoderado, doctor **LUIS HERNÁN RODRÍGUEZ MANRIQUE**, identificados como se anotó, parte reclamante.

Por su parte, no se hace presente señor **CAMILO MATIZ OVALLE**, representante legal inscrito de la sociedad **JAPY ITALIA LTDA. HOY JAPY ITALIA S.A.S.**, identificada con NIT 900.248.110-2, con domicilio en Bogotá, D.C., ni el primer suplente señor **JONÁS OLOF BERGFELDT**, se reitera, tampoco se acredita que se encuentre el representante legal principal inscrito fuera del territorio nacional. La doctora **ANA VICENTA AGUILLON DE NIETO**, identificada como se anotó, en su calidad de apoderada de la sociedad **JAPY ITALIA LTDA. HOY JAPY ITALIA S.A.S.**, no acredita las circunstancias contempladas en el parágrafo 2 del art. 1 de la Ley 640 de 2001, por consiguiente, la parte vinculada no se encuentra representada en la presente audiencia. No obstante, hace entrega del acta correspondiente a las verificaciones técnicas adelantadas el sábado 20 de agosto del presente año, tal y como se acordó al inicio de la audiencia de conciliación y constituyó el motivo de suspensión de la misma, en 2 fls.; acta de entrega del automotor y otros documentos del 27 de diciembre de 2008, copia auténtica, en 2 fls.; original manual de funcionamiento del bien en reclamación, en 109 fls.; y, original de un manual de garantía del mencionado bien, en 149 fls., los cuales se anexan a la presente constancia y hacen parte integral de la misma.

Para constancia se firma por el reclamante, su apoderado y por la abogada conciliadora, a las 17:00 h .

Reclamante,

HÉCTOR ALEXANDER NIEL LÓPEZ
C.C. 79.619.476

Apoderado reclamante,

LUIS HERNAN RODRIGUEZ MANRIQUE
C.C. 88.170.363 T.P. 152.776 del C. S. de la J.

Conciliadora,

JENNY PATRICIA MÉNDEZ SERRANO
C.C. 51.658.558 T.P. 36916 del C. S. de la J.

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 382 08 40
Fax: 382 26 95. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

(1)

ACTA ORDENADA POR LA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO ATENDIO LA DRA JENNY PATRICIA MENDEZ SERRANO; QUIEN EN ASESORIA DE LAS PARTES EN CONFLICTO, ACEPTARON REALIZAR UNA REVISION DEL RODANTE SIN COSTO ALGUNO PARA EL RECLAMANTE EN EL TALLER AUTORIZADO PARA COLOMBIA, UBICADO EN LA CRA 17 # 55A 24.

SIENDO EL DIA Y LA HORA ACORDADA NOS HICIMOS PRESENTES, SIENDO LA 8:55 AM, LA APODERADA AAN. DE LA SOCIEDAD JAPY ITALIA LIMITADA. HOY JAPY ITALIA S.A.S IDENTIFICADA CON NIT 900.248.110-2; Y A LAS NUEVE 9:20 AM SE HIZO PRESENTE EL RECLAMANTE SR HECTOR NIEL; EN ASOCIO CON SU TECNICO SR LUIS ALBERTO RODRIGUEZ CON CC 80.427.899 BTA QUIEN MANIFIESTA SER TECNICO EN MOTOCICLETAS DE DIVERSAS MARCAS, CON ENFASIS EN VESPA Y DUTECO. ACTO SEGUIDO SE PROCEDE A SOMETER EL RODANTE A REVISION TECNICA MECANICA, CON EL CONCURSO DEL TECNICO DE LA SOCIEDAD JAPY LTDA, HOY JAPY SAS. CON EL OBJETO DE OBTENER UN CONCEPTO TECNICO Y ACERTADO

PROCEDEMOS DE MUTUO ACUERDO A ELABORAR EL PROCEDIMIENTO TECNICO ASI:

1) ESCUCHAR AL SR: NIEL, SOBRE LAS INCONFORMIDADES DEL RODANTE, DESDE EL DIA DE LA COMPRA, HACIENDO EN PAPEL EN EL TIPO DE FALLAS MECANICAS Y LAS FECHAS EN QUE ESTAS SE PRESENTARON. Y EL PROCEDIMIENTO DE LA QUEJA QUE HAYA PRESENTADO ANTE EL CONCESIONARIO AUTORIZADO PARA COLOMBIA.

2) SOMETER EL RODANTE A LA INSPECCIÓN DEL NAVEGADOR DE DIAGNÓSTICO DE VESPA PARA COLOMBIA.

3) UNA VEZ OBTENIDO EL CONCEPTO DEL EQUIPO SE LE DA TRASLADO A LOS TECNICOS DE LAS PARTES, PARA QUE PRECISEN LAS POSIBLES CAUSAS DEL PRESUNTO ESTADO, DAÑOS E IRREGULARIDADES, PRESENTADAS DE FORMA CRONOLÓGICA.

4) CONCILIAR LOS CRITERIOS TECNICOMECANICOS Y PROPONER LA POSIBLE SOLUCIÓN AL CONFLICTO.

(3) SIENDO LAS 9.45 SE INICIA EL SONEO DEL RODANTE, EN CONEXIÓN CON EL EQUIPO DE PRUEBA operado por el TECNICO DE UESPA. y EN PRESENCIA DEL TECNICO DEL SR NIEL. OBSERVANDOSE LO SIGUIENTE:

A) PROBLEMAS DE TEMPERATURA DE AGUA ESTADO ACTUAL

B) BAJO SE ENCUENTRO EL LIQUIDO REFRIGERANTE

C) LA PARTE ~~ELECTRONICA~~ ELECTRONICA NO REGISTRA EL TESTIGO DE LECTURA DE TEMPERATURA.

ACTO SEGUIDO SE PROCEDE A SUBIR AL BANCO DE PRUEBAS EL RODANTE DE PLACAS OLN 90B DE PROPIEDAD DEL SR HECTOR NIEL ENCONTRANDO QUE EL RODANTE QUE

- EL KILOMETRAJE DEL EQUIPO ES DE 17945.9

- AL ENCENDER EL RODANTE SE COMPRUEBA QUE EL TUBO DE ESCAPE ESTA HUMEDO PORQUE TIENE ESCAPE DE AGUA; ~~LA QUE SE~~ PRESENTA FUE

- ~~EXP~~ CONCLUYE QUE REPARADA EN OTRO LUGAR

~~NO SE ENCUENTRA NINGUNA~~ SE DETECTA LA DERRAME DE LIQUIDO REFRIGERANTE SOBRE EL DESCANSA PIEZ DEL CONDUCTOR

- SE PROCEDE A HACER PRUEBA DE CARRETERA AL RODANTE, CON PARTICIPACIÓN DE LOS TECNICOS EN EL QUE EL PARTE TECNICO ES:

(4)

- MECANICAMENTE BUEN FUNCIONAMIENTO CON LA EXCEPCIÓN DEL VENTILADOR QUE SE MANTIENE PRENDIDO CONSTANTEMENTE.
- PRESENTA RECALENTAMIENTO; - ADICIONALMENTE PRESENTA, PRESENCIA ~~EN~~ DE AGUA EN EL ACEITE.
- EL TESTIGO DEL MOTOR PERMANECE PRENDIDO
- TRABAJA A MAYOR TEMPERATURA DE LA QUE CORRESPONDE, SEGÚN EL FABRICANTE (MANUAL)

EN ESTE MOMENTO EL TECNICO Luis ALBERTO RODRIGUEZ FIRMA

DESPUÉS DE VARIAS PROPUESTAS CONCILIATORIAS SE Y ANTE LA MANIFESTACIÓN DEL SR NIEL, EN LO RELACIONADO CON LA AFIRMACIÓN DE QUE A ÉL NO SE LE HIZO ENTREGA FORMAL, NI ACTA DE ENTREGA, NI MANUAL DE GARANTÍA Y/O OPERACIONES; LA APODERADA DE JAPY LTDA HOY JAPY SAS; PROPONE: QUE SI EL DIA 01 DE SEPTIEMBRE FECHA LIMITE FIJADA POR LA SUPERINTENDENCIA PARA CONTINUACIÓN DE LA DILIGENCIA DE CONCILIACIÓN, NO APORTA PRUEBAS JAPY ITALIA LTDA; HOY JAPY SAS. QUE SEA

SUFICIENTE QUE DEMUESTRE LA ENTREGA DE LA GARANTIA Y MANUAL DE INSTRUCCIONES (OPERACION) CASA VESPA - PIAGGIO. PAGARÁ LA REPARACION A QUE HAYA LUGAR, PARA PONER EN CORRECTO FUNCIONAMIENTO EL RODANTE. DE LO CONTRARIO HECTOR NIEL QUEDA EN LIBERTAD DE REALIZAR LOS ARREGLOS AL RODANTE YA RETENIDO Y REPETIR EJECUTIVAMENTE, LOS COSTOS QUE OCASIONEN LOS ARREGLOS, ESTO EN CONTRA DE LA CIA PIAGGIO SAS NIT 900 248 110-2 Y EL APODERADO DEL SR NIEL. Y EL PROPIETARIO (MISMO) RODANTE ACEPTAN LA PRESENTE PROPUESTA.

EN CONSTANCIA DE APROBACIÓN DEL PRESENTE ACUERDO FIRMAN DE CONFORMIDAD LAS PARTES

Por: Piaggio Italia SAS

La Apoderada.

El técnico de Piaggio Italia SAS

Mario Esquivel de Nicol

Dr Luis Stefan Rodriguez M.
C.C.#
T.P.#

Hector Alexander Niel Lopez
Comprador del
Rodante Placas GTV.25
Navi OLN-90B

Japy Ltda
NIT. 830.120.246-0
Dirección
Cr. 29 No. 39b-29
Bogotá, Colombia
Tel. +57 1 244 2346
Cel. +57 312 481 6165
E-mail: info@japygroup.com
www.japygroup.com

6

NOTARIA SETENTA Y UNO
REPUBLICA DE COLOMBIA
CIRCULO DE BOGOTA D.C.
29 AGO. 2011
Esta fotocopia coincide con el ORIGINAL que he tenido a la vista Art.74 Dec.960/70
HERNAN MOLINA DIAZ
NOTARIO(E)

ACTA DE ENTREGA

Carolina Gómez Correa identificada con cédula de ciudadanía No. 52.253.951 de Bogotá, obrando en mi calidad de Representante Legal de JAPY LTDA, hago entrega real y material de la moto Vespa **GTV NAVY 250ie de color azul oscuro,** placas **OLN90B** anexo a la presente acta la siguiente documentación:

1. Copia de la nacionalización **# 032008101112718-4**
2. Matricula de inscripción Ministerio de Transporte **#2012983-08-11001**
3. Certificado de Empadronamiento.
4. Copia de la factura **# 177.**
5. Formulario único de impuestos sobre vehículos automotores # **103010002867610**
6. Póliza de Seguro Obligatorio **AT1329-20563189-3** de la compañía Seguros del Estado S.A.
7. Matricula y licencia de Tránsito **3611050**
8. Placas **OLN90B**
9. Manual operativo de la moto **Vespa GTV NAVY 250ie de color azul oscuro.**
10. Manual de Garantía.
11. Kit de llaves (2) y tarjeta de código de seguridad. 3346
12. Kit de Herramientas,

Con la firma de este documento el señor **Héctor Alexander Niel López,** declara haber recibido a entera conformidad el vehículo y los anexos enunciados.

Dado en Bogotá D.C. a los 27 días del mes de Diciembre de 2008

Carolina Gómez Correa
Representante Legal
C.C. 52.253.951

Recibí a satisfacción
Héctor Alexander Niel López
C.C. 79.619.476

CONTROL DE ENTREGA PARA LA GARANTÍA (2 AÑOS)

(Llenar completamente. Se solicita escribir con letra mayúscula)

7.

Datos del vehículo

Prefijo chasis 9 A P M 4 5 1 0 2

Número chasis 0 0 0 0 5 5 4 6

Nombre del modelo GRV 250 IE

Matrícula .....

Datos del propietario

Apellido NIEL LOPEZ

Nombre HECTOR ALEXANDER

Calle 98 # 9-03 OF. 202

Ciudad BOGOTA

Prov. CUNDINAMARCA CP COLOMBIA

Tel. 310-241-7929

Declaro haber tomado conocimiento y aceptar las condiciones de garantía presentes en este manual **"2 Años de garantía"** (de pág. 9 a pág. 14) y de retirar el vehículo en perfectas condiciones.

Firma del Cliente: .....

El Concesionario/Tall. Aut., confirma que las operaciones y los controles previstos en el plan de Pre-entrega han sido realizados correctamente y que el vehículo se encuentra en perfectas condiciones de funcionamiento.

Sello y firma del Concesionario/Tall. Aut.

Japy Ltda
NIT. 830.120246-0

Fecha de venta: .....

Código Concesionario/Tall. Aut.

.....

ES

El abajo firmante autoriza, dentro de los límites indicados en el informe recibido (ver pág. 4-5), el tratamiento de los datos personales que le competen, declarando de tener conocimiento de los derechos que se le reconocen en el art. 7 D. L. 196/2003.

Firma del cliente .....

7

NOTARIA SETENTA Y UNA
REPUBLICA DE COLOMBIA
CIRCULO DE BOGOTA D.C.
29 AGO. 2011
Esta fotocopia coincide con el ORIGINAL que he tenido a la vista Art.74 Dec.960/70
HERNAN MOLINA DIAZ
NOTARIO(E)

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PLANILLA DE RADICACION - DIGITALIZACION DIARIA RELACION DE ANEXOS

Dependencia:			Fecha:		Recorrido:
Tipo de Radicación:	Entrada:	Salida:	Traslado:		Convenio:
Radicador:					Planilla:

ID	No Radicación	Cons	Item
1	1		1
2			
3		-	1
4	10-159005-15		1
5			
6			
7			
8			
9			
10			
11			
12			
13			
14			
15			
16			
17			
18			
19			
20			
21			
22			

Item	Unidad de Conservación
X	CD
2	Disquetes
3	DVD
4	Fotos
5	Libro
6	Muestra Fisica
7	Otros
8	Planos
9	Periodico
10	Pubicación Periodica
11	Sobre blanco tamaño carta
12	Sobre blanco tamaño oficio
13	Sobre de manila

Observaciones
del folio 8
al folio 286
dos manuales.