



No. 12-019954- -00000-0000

Fecha: 2012-02-06 11:31:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11. PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 66



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO DERIVADOS DE N1-ACIL-5-FLUOROPYRIMIDINONA

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE DOW AGROSCIENCES LLC

DOMICILIO INDIANAPOLIS, INDIANA, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén

74. APODERADO _____

22. BOGOTÁ, D. C., _____

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-019954- -00000-0000

Fecha: 2012-02-06 11:31:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 66

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:		
1 ☒ Patente de Invención. ☒ Capítulo I. ☐ Patente de Modelo de Utilidad. ☐ Capítulo II.		
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: DOW AGROSCIENCES LLC Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: 9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana 46268, Estados Unidos de América Domicilio: Indianapolis, Indiana, Estados Unidos de América	IDENTIFICACIÓN C.C.☐ C.E.☐ NIT☐ Otro☐ Cual Número
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@cavelier.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C.☒ C.E.☐ NIT☐ Otro☐ Cual Número 35.456.344 T.P 23.555
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Timothy BOEBEL 5747 North Oxford Street, Indianapolis, Indiana 46220, Estados Unidos de América 3. Beth LORSBACH 6034 Haverford Avenue, Indianapolis, Indiana 46220, Estados Unidos de América 5. W. OWEN 12421 Pebblepointe Pass, Carmel, Indiana 46033, Estados Unidos de América 7. Scott THORNBURGH 13820 Springmill Ponds Circle, Carmel, Indiana 46032, Estados Unidos de América 9. Chenglin YAO 14178 Esprit Drive, Westfield, Indiana 46074, Estados Unidos de América 2. Kristy BRYAN 1502 Cool Creek Drive, Carmel, Indiana 46033, Estados Unidos de América 4. Timothy MARTIN 6095 Ramsey Drive, Noblesville, Indiana 46062, Estados Unidos de América 6. Mark POBANZ 4293 Sedge Ct., Zionsville, Indiana 46077, Estados Unidos de América 8. Jeffery WEBSTER 7581 W. Oakwood Court, New Palestine, Indiana 46163, Estados Unidos de América	

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/US2010/044576</u> Fecha: <u>05 de agosto de 2010</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2011/017538 A1</u> Fecha: <u>10 de febrero de 2011</u>		
6	Título (54) <u>DERIVADOS DE N1-ACIL-5-FLUOROPIRIMIDINONA</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 339/002</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>US</u>	(32) Fecha <u>07 de agosto de 2009</u>
			(31) Número de Solicitud <u>61/232,223</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>12-008232</u> Fecha: <u>27 de enero de 2012</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 590.000.oo. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poder de DOW AGROSCIENCES LLC. ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☐ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia de la carátula de la Publicación Internacional WO 2011/017538 A1. ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☐ Arte final 12x12 ☐ 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. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS		

11

FIGURA CARACTERÍSTICA

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

FIRMA :

Luz Clemencia De Paez

C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P. 23.555

SCT

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2011/017538 A1

Descripción:

Páginas 43 en español

Reivindicaciones: Número (s) 4

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210.** Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

REPRESENTACION, RATIFICACION Y PODER

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION, RATIFICATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned /Yo (nosotros), abajo firmado (s)

Dow AgroSciences LLC

of/domiciliado (s) en 9330 Zionsville Road,
Indianapolis, Indiana 46268, United
States of America,

por el presente ratificamos la

presentada por

como agente oficioso ante

en

el

y por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mí (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades 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 y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa o judicial, nulidad,

hereby ratify the

filed without a Power of Attorney by

before

in

on

and do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, in due compliance with the terms of Paragraph 1st. of Article 543 of the Commercial Code, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may 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 and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

A la vuelta →

Over →

medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). 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.

Given and signed this/Dado y firmado hoy _____

February 6, 1998

In/en Indianapolis, Indiana 46268

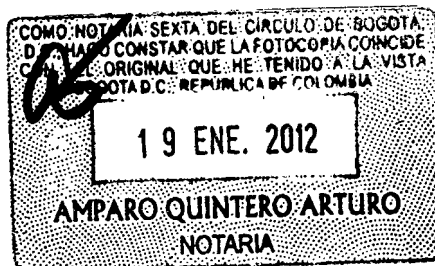
United States of America

Kenneth L. Loertscher

Signature

Firma

Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary
& General Patent Counsel





Consulado General de Colombia

500 NORTH MICHIGAN AVENUE, SUITE 2040
CHICAGO, ILLINOIS 60611

TEL (312) 923-1196 FAX (312) 923-1197

No. 254

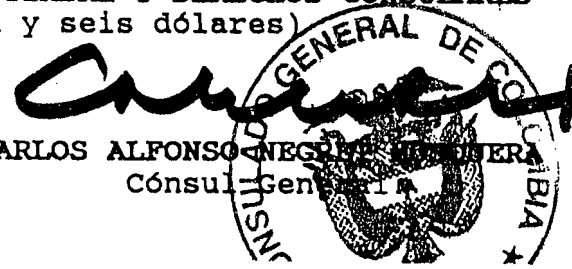
Chicago, FEB 20 1998

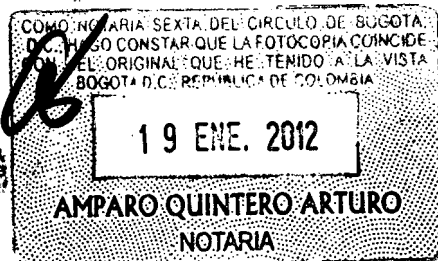
El suscrito Cónsul General de Colombia, CERTIFICA, que el señor (a)
MARY REEVER, quien como

SECRETARIA DELEGADA ESTADO, IN., autenticó la
firma del signatario del poder precedente, ejercía en la fecha las
funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este
Consulado; que la compañía DOW AGROSCIENCES LLC
es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de
DELAWARE y cumple su objeto conforme a las mismas;
que el (a) señor (a) KENNETH L. LOERTSCHER,
quien en su carácter de REPRESENTANTE LEGAL
de la citada compañía confiere el poder precedente, es su
representante legal en este país.

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

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE Y DERECHOS CONSULARES
US\$56.00 (Cincuenta y seis dólares)


CARLOS ALFONSO NEGRETE
Cónsul General



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

Carlos

221220

Dejust

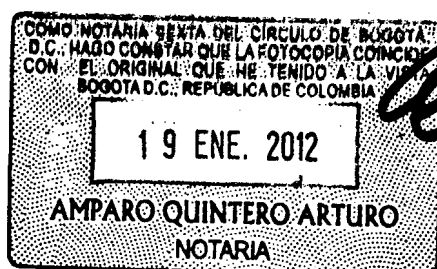
SE FIRMARÁ POR EL
MINISTRO DE EMPLEO Y
PREVISIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

1998 MAR 11 A 11:55

W
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTÁ D.C.

Bernarda R. de Martinez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1991



UNITED STATES OF AMERICA
CERTIFICATE OF OFFICE
STATE OF INDIANA

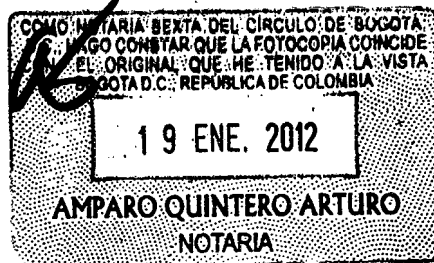
I, Sue Anne Gilroy, Secretary of State of Indiana, DO HEREBY CERTIFY: That,
according to records on file in my office, Lydia S. Owens was duly elected
or appointed to the office of Notary Public in and for Hendricks County
and that the term of said office included the date of February 6, 1998: that to all his/her official acts as said offi-



cial, full faith and credit ought to be given in all Courts of
Justice and elsewhere. In testimony whereof, I have here unto
set my hand and affixed the Great Seal of the State of Indiana,
at Indianapolis, this Tenth day of
February, 1998

Sue Anne Gilroy
Secretary of State

by: *Mary Beever*
Deputy



CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO)

A los 6 días del mes de FEBRERO de 19 98
ante mí, Notario Público de ESTADO DE INDIANA
compareció(eron) personalmente KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y quien(es)
tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.

Notario Público — Notary Public

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy, 6 de FEBRERO de 19 98
compareció(eron) ante mí
KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) conozco personalmente y que firma(n) este documen
to en representación de la Sociedad/compañía

denominada Dow AgroSciences LLC

Certifico:

1. Que he visto los siguientes documentos:*

CERTIFICADO DE CONSTITUCION, FECHADO 1 JULIO 1997
CERTIFICADO DE MODIFICACION, FECHADO 1 OCT. 1997
RESOLUCION JUNTA DIRECTIVA, FECHADO 23 OCT, 1997
CONSENTIMIENTO ESCRITO DE LA JUNTA, 1 JULIO 1997

2. Que dichos documentos prueban lo siguiente:

2.1. Que Dow AgroSciences LLC
es una Sociedad/Compañía legalmente constituida y existente
de acuerdo con las leyes de 1 Estado de Delaware,
Estados Unidos de América

2.2. Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, Estados Unidos de America.

2.3. Que el objeto u objeto para los cuales se otorga el presente
poder están comprendidos dentro del objeto social de la
mencionada Sociedad/Compañía.

2.4. Que el(los) Sr.(Sres.) KENNETH L. LOERTSCHER
SECRETARIO ASISTENTE Y ASESOR LEGAL PATENTES

está(n) autorizado(s) para otorgar el presente Poder.

Ciudad INDIANAPOLIS

Fado INDIANA

Hoy 6 FEB. de 19 98

Notario Público — Notary Public

* Los documentos deben identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL CERTIFICATE (INDIVIDUAL)

On this 6th day of February 19 98
before me, a Notary Public of State of Indiana
personally appeared Kenneth L. Loertscher

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has(have) legal
capacity to execute it.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this 6th day of February 19 98
appeared before me
Kenneth L. Loertscher

who(m) I know personally and who(m) signed this document as
representative(s) of the ~~CORPORATION/COMPANY~~ Limited
Liability
named Dow AgroSciences LLC Company.

I Certify:

1. That I have seen the following documents:*

Certificate of formation, dated July 1, 1997
Certificate of amendment, dated October 1, 1997
Board resolution, dated October 23, 1991
Board written consent, dated July 1, 1997

2. That the above documents duly prove the following:

2.1. That Dow AgroSciences LLC
Limited Liability
is a ~~Corporation/Company~~ Company legally constituted and in existence
in accordance with the laws of the State of Delaware,
United States of America

2.2. That the domicile of said ~~CORPORATION/COMPANY~~ Limited Liability Company is
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, United States of America.

2.3. That the purpose of purposes for which the present Power
of Attorney is granted are comprised within the corporation
purposes set forth in the charter of the mentioned
~~Corporation/Company~~ Limited liability company.

2.4. That Mr.(Messrs.) Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary and General Patent Counsel

is (are) authorized to grant the present Power of Attorney.

HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTÁ D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

City Indianapolis

State Indiana 9 ENE. 2012

This 6 FEB. 19 98

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

Lydia S. Owens
Notary Public, State of Indiana
Hendricks County
My Commission Expires 03/05/00

* Documents must be identified with date and origin.

10

LAW F. G. B. C. S. I.

**CERTIFICACION NOTARIAL
Y AUTENTICACION CONSULAR**

1. Es necesaria la legalización con certificado notarial. El Notario Público debe certificar:

1.1. Que la compañía está legalmente constituida y actualmente existente.

1.2. Su domicilio.

1.3. Que el propósito del poder está incluido en el objeto social de la compañía.

1.4. Que el poderdante está autorizado para dar el poder en nombre de la compañía.

2. Los documentos que hay que mostrarle al Notario Público para probar los puntos anteriores, deben estar expresados en el Certificado Notarial con fecha y origen:

2.1. Respecto a los puntos 1.1, 1.2 y 1.3 sugerimos referirse a los artículos de constitución con fecha y lugar de otorgamiento; y

2.2. Para el punto 1.4 sugerimos mencionar la resolución de la Junta Directiva o los estatutos, según los cuales la persona que otorga el poder está autorizada para ello.

3. Enseguida el Señor Cónsul de Colombia debe autenticar la firma del Notario Público.

**NOTARIAL CERTIFICATION AND
CONSULAR AUTENTIFICATION**

1. Notarial legalization is necessary. The Notary Public must certify:

1.1. That the company is legally constituted and presently existent.

1.2. Its place of business.

1.3. That the purpose of the Power-of-Attorney is included in the activities of the company.

1.4. That the grantor is empowered to give the Power of Attorney in the name of the company he represents.

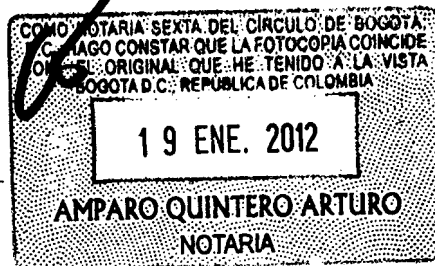
2. The documents which the Notary Public had before him to prove the above points must be listed by him in the Notarial Certificate with dated and origin:

2.1. In connection with points 1.1., 1.2. and 1.3 we suggest referring to the articles of incorporation with date and place of execution.

2.2. For point 1.4 we suggest to mention the resolution of the Board of Directors and/or the by-laws whereby the person who grants the Power of Attorney has been authorized to give it.

3. Then the Colombian Consul must legalize the signature of the Notary Public.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según el artículo 259 del C. de P.C. el Señor Cónsul debe autenticar la última precedente autenticación.



11

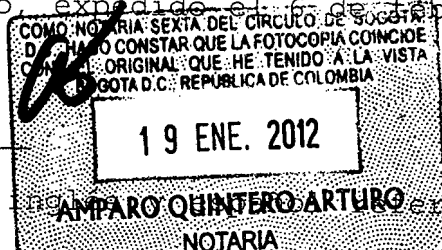
TRADUCCION OFICIAL No.03.075.98 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Dow AgroSciences LLC, otorga Poder a favor de GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, EMILIO FERRERO y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ.)

Dado y firmado hoy 6 de febrero de 1998, en Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., por Kenneth L. Loertscher, Subsecretario y Asesor General de Patentes.

(Sellos parciales en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO), en inglés y español referente a la capacidad legal que tenía KENNETH L. LOERTSCHER para otorgar el documento antes mencionado, expedido el 6 de febrero de 1998 en el Estado de Indiana.



CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD), en inglés referente a la existencia legal de la sociedad Dow AgroSciences LLC, expedido en la Ciudad de Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., el 6 de febrero de 1998.

(Firmado), Lydia S. Owens, Notario Público

(Sello notarial en tinta), LYDIA S. OWENS Notario Público,
Estado de Indiana, Condado de Hendricks Mi comisión expira el
03/05/00

(Sello notarial seco), LYDIA S. OWENS NOTARIO PUBLICO INDIANA

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en
Chicago.)

ESTADO UNIDOS DE AMERICA

CERTIFICADO DEL CARGO

ESTADO DE INDIANA

Yo, SUE ANN GILROY, Secretario de Estado de Indiana, POR EL
PRESENTE CERTIFICO: que, de acuerdo con los archivos que obran
en mi oficina, LYDIA S. OWENS fue debidamente elegido y
nombrado para el cargo de NOTARIO PUBLICO en y para el Condado
de Hendricks y que el término de dicho cargo incluía la fecha
del 6 de febrero de 1998: que a todos sus actos oficiales se
les debe dar completa fe y crédito dentro y fuera de todas las
Corte de Justicia. EN TESTIMONIO DE LO CUAL, he firmado y
estampado el Gran Sello del Estado de Indiana, en Indianápolis,
hoy 10 de febrero de 1998.

(Firma facsimilar), Sue Ann Gilroy

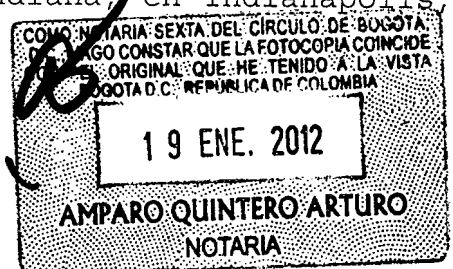
Secretario de Estado

(Firmado),

Por: Mary Reeve

Suplente

(Adherido se encuentra sello de oblea dorado con texto en
relieve), SELLO DEL ESTADO DE INDIANA 1816



(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(En español), Certificación de la firma y cargo de MARY REEVER, de la existencia legal de la compañía DOW AGROSCIENCES LLC y de la autoridad que tenía su representante Legal, KENNETH L. LOERTSCHER, para otorgar el poder mencionado arriba. Esta certificación fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA EN CHICAGO, ILLINOIS, bajo el N° 254, de fecha 20 de febrero de 1998 y firmada por Carlos Alfonso Negret Mosquera, Cónsul General. Pagados Impuesto de Timbre y Derechos Consulares por valor de veintiún dólares.

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

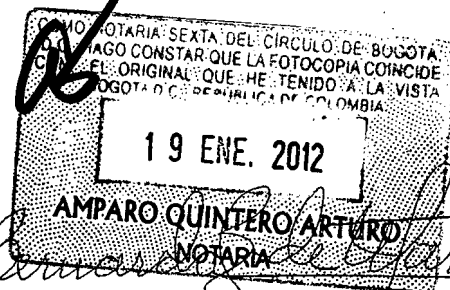
(al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES bajo el No. 221220, de fecha 11 de marzo de 1998 y firmada por el Jefe de Legalizaciones.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me remito.

Bogotá, 17 de marzo de 1998

COLO 6641-801-001-3

BRM.137



Bernarda R. de Martinez

Traductora e Interprete Oficial

Resolución 683 Minjusticia 1991

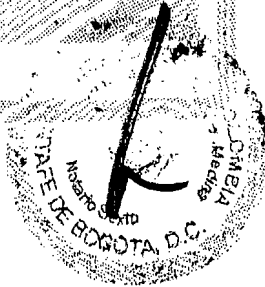
COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR

[Signature]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 17 MAR 1998



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 MAR 18 AMV 156

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

022686

CUYA FIRMA APARECE EN
DOCUMENTO DESEMPEÑANDO
LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIA SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA
HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

19 ENE. 2012

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

CAVELIER

ABOGADOS

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

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

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

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

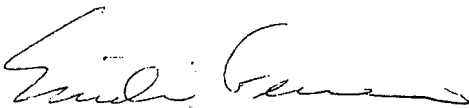
E. S. D.

Poderdante : DOW AGROSCIENCES LLC

Poder conferido el : 06/02/1998

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.



EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

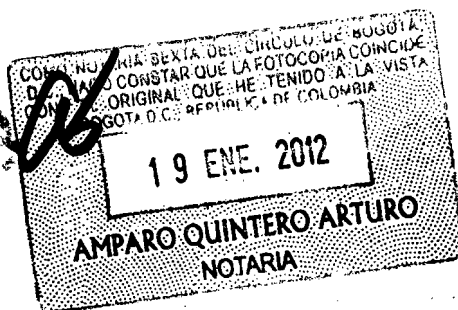
C.C. N° 438.019 de Usaquén

Acepto:


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

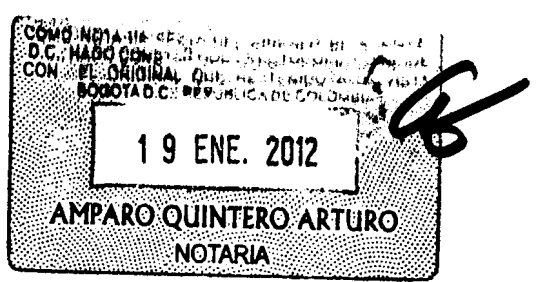
T.P.A. N° 23.555

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén



NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogotá, D.C. 22 OCT 2009
Ante mí AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA SEXTA DEL CÍRCULO DE
BOGOTÁ, D.C.
Comparado(ron) *Emilio Ferrero*
Williamson y Luz Clemencia
Guarez de Paez
Quiero(s) exhibir(en) la(s) C.C.
CC 438019 TP 31929
CC 35456344 TP 23555
Y declaré(ron) que la(s) firma(s) que se reco(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto.
En constancia se firma esta diligencia.

Emilio Ferrero
Luz Clemencia Guarez de Paez



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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
10 February 2011 (10.02.2011)

(10) International Publication Number
WO 2011/017538 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 339/02 (2006.01)

(74) Agent: ARNETT, Charles; 9330 Zionsville Rd, Indianapolis, Indiana 46268 (US).

(21) International Application Number:
PCT/US2010/044576

(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.

(22) International Filing Date:
5 August 2010 (05.08.2010)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
61/232,223 7 August 2009 (07.08.2009) US

(71) Applicant (for all designated States except US): DOW AGROSCIENCES LLC [US/US]; 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054 (US).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AL, 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).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): BOEBEL, Timothy [US/US]; 5747 North Oxford Street, Indianapolis, IN 46220 (US). BRYAN, Kristy [US/US]; 1502 Cool Creek Drive, Carmel, IN 46033 (US). LORSBACH, Beth [US/US]; 6034 Haverford Avenue, Indianapolis, IN 46220 (US). MARTIN, Timothy [US/US]; 6095 Ramsey Drive, Noblesville, IN 46062 (US). OWEN, W. [GB/US]; 12421 Pebblepointe Pass, Carmel, IN 46033 (US). POBANZ, Mark [US/US]; 4293 Sedge Ct., Zionsville, IN 46077 (US). THORNBURGH, Scott [US/US]; 13820 Springmill Ponds Circle, Carmel, IN 46032 (US). WEBSTER, Jeffery [US/US]; 7581 W. Oakwood Court, New Palestine, IN 46163 (US). YAO, Chenglin [US/US]; 14178 Esprit Drive, Westfield, IN 46074 (US).

Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))

Published:

— with international search report (Art. 21(3))

(54) Title: NI-ACYL-5-FLUOROPYRIMIDINONE DERIVATIVES

(57) Abstract: This present disclosure is related to the field of NI-acyl-5-fluoropyrimidinones and their derivatives and to the use of these compounds as fungicides.



WO 2011/017538 A1

DERIVADOS DE N1-ACIL-5-FLUOROPYRIMIDINONA

Referencia Cruzada con Solicitudes Relacionadas

La presente solicitud reclama el beneficio de la Solicitud
5 de Patente Provisional Norteamericana Serie No. 61/232,223
presentada el 7 de Agosto del 2009.

Antecedentes de la Invención

Los fungicidas son compuestos de origen natural o
sintético, que actúan para proteger y/o curar las plantas contra
10 daño originado por hongos agrícolaemente relevantes.
Generalmente un solo fungicida no es útil en todas las
situaciones. En consecuencia, la investigación está en curso
para producir fungicidas que puedan tener un mejor desempeño,
sean más fáciles de utilizar, y tengan menor costo.

15 Breve Descripción de la Invención

La presente invención se refiere a compuestos de N1-acil-
5-fluoropirimidinona y su uso como fungicidas. Los compuestos
de la presente descripción pueden ofrecer protección contra
ascomicetos, basidiomicetos, deuteromicetos y oomicetos.

20 Una modalidad de la presente descripción puede incluir
compuestos de la fórmula I:



Fórmula I

en donde R¹ es:

H;

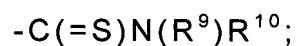
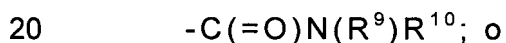
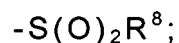
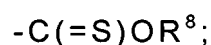
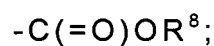
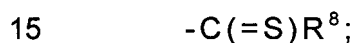
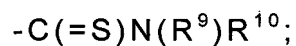
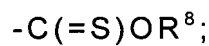
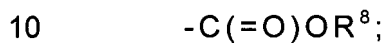
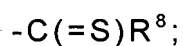
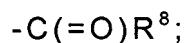
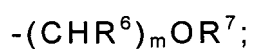
C₁-C₆ alquilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

C₁-C₆ alquenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

30 C₃-C₆ alquinilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo

puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 , o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contiene cada uno 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 ;



en donde m es un entero de 1 a 3;

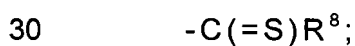
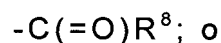
R^2 es:

H; o

25 C_1-C_6 alquilo opcionalmente sustituido con R^4 ;

como alternativa R^1 y R^2 se pueden tomar juntos para formar $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$;

R^3 :



R^4 es independientemente halógeno, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_4

haloalquilo, C₁-C₄ alcoxi, C₁-C₄ haloalcoxi, C₁-C₄ alquiltio, C₁-C₄ haloalquiltio, amino, halotio, C₁-C₃ alquilamino, C₂-C₆ alcoxicarbonilo, C₂-C₆ alquilcarbonilo, C₂-C₆ alquilaminocarbonilo, hidroxilo, o C₃-C₆ trialquilsililo;

5 R⁵ es independientemente halógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alquiltio, C₁-C₆ haloalquiltio, halotio, amino, C₁-C₆ alquilamino, C₂-C₆ dialquilamino, C₂-C₆ alcoxicarbonilo, o C₂-C₆ alquilcarbonilo, nitro, hidroxilo, o ciano;

10 R⁶ es H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ alcoxi, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R⁵;

 R⁷ es H, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆ alquenilo, C₃-C₆ alquinilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxialquilo, C₂-C₆ alquilcarbonilo, 15 fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R⁵, o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6 o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos en 20 donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵

 R⁸ es H, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆ alquenilo, C₃-C₆ alquinilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxialquilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente 25 sustituidos con 1 a 3 R⁵, o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵, bifenilo o 30 naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵;

 R⁹ es H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆

alcoxialquilo, C₂-C₆ alquilcarbonilo, fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R⁵, o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵

R¹⁰ es H, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxialquilo, C₂-C₆ alquilcarbonilo, bencilo, en donde el bencilo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵;

como alternativa R⁹ y R¹⁰ se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que contiene 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵;

R¹¹ es H o C₁-C₄ alquilo;

R¹² es H, ciano, hidroxilo, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₂-C₆, alquilcarbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R⁵;

como alternativa R¹¹ y R¹² se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que contienen 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵;

R¹³ es H, C₁-C₄ alquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₂-C₆, alquilcarbonilo, fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R⁵; y

como alternativa R¹² y R¹³ se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que contiene 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵.

Otra modalidad de la presente invención, puede incluir una composición fungicida para el control o prevención de ataque fúngico, en donde la composición comprende los compuestos que se describen más adelante y un material transportador fitológicamente aceptable.

Aún otra modalidad de la presente invención puede incluir un método para el control o prevención de ataque fúngico en una planta, en donde el método incluye los pasos de aplicar una cantidad fungicidamente efectiva de uno o más de los compuestos que se describen más adelante al menos a uno del hongo, la planta, un área adyacente a la planta y la semilla adaptada para producir la planta.

El término "alquilo" se refiere a una cadena de carbono ramificada, no ramificada, cíclica, que incluye metilo, etilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, butilo terciario, pentilo, hexilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y similares.

El término "alquenilo" se refiere a una cadena de carbono ramificada, no ramificada, cíclica que contiene uno o más enlaces dobles que incluyen etenilo, propenilo, butenilo, isopropenilo, isobutenilo, ciclohexenilo, y similares.

El término "alquinilo" se refiere a una cadena de carbono ramificada, no ramificada que contiene uno o más enlaces triples que incluyen propinilo, butinilo y similares.

Tal como se utiliza a lo largo de la presente especificación, el término 'R' se refiere al grupo que consiste en C₂₋₈ alquilo, C₃₋₈ alquenilo o C₃₋₈ alquinilo, a menos que se indique de otra manera.

El término "alcoxi" se refiere a un sustituyente -OR.

El término "alcoxicarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OR.

El término "alquilcarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-R.

El término "alquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R.

5 El término "haloalquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R en donde R es completa o parcialmente sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "alquiltio" se refiere a un sustituyente -S-R.

10 El término "halotio" se refiere a un azufre sustituido con tres a cinco sustituyentes F.

El término "haloalquiltio" se refiere a un alquiltio, el cual es sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

15 El término "alquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-N(H)-R.

El término "dialquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-NR₂.

20 El término "alquilocicloalquilamino" se refiere a un sustituyente cicloalquilamino que es sustituido con un grupo alquilo.

El término "trialquilsililo" se refiere a -SiR₃.

El término "ciano" se refiere a un sustituyente -C≡N.

El término "hidroxilo" se refiere a un sustituyente -OH.

El término "amino" se refiere a un sustituyente -NH₂.

25 El término "alquilamino" se refiere a un sustituyente -N(H)-R.

El término "dialquilamino" se refiere a un sustituyente -NR₂.

30 El término "alcoxialcoxi" se refiere a -O(CH₂)_nO(CH₂)_mCH₃ en donde n es un entero de 1 a 3 y m es de 0 a 2.

El término "alcoxialquilo" se refiere a una sustitución

alcoxi en un alquilo.

El término "haloalcoxialquilo" se refiere a una sustitución alcoxi en un alquilo que puede ser completa o parcialmente sustituido con Cl, F, Br, o I, o cualquier combinación de los
5 mismos.

El término "hidroxialquilo" se refiere a un alquilo el cual es sustituido con un grupo hidroxilo.

El término "haloalcoxi" se refiere a un sustituyente -OR-X, en donde X es Cl, F, Br, o I, o cualquier combinación de los
10 mismos.

El término "haloalquilo" se refiere a un alquilo, el cual es sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquenilo" se refiere a un alquenilo, el cual
15 es sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquinilo" se refiere a un alquinilo el cual es sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

20 El término "halógeno" o "halo" se refiere a uno o más átomos de halógeno, definidos como F, Cl, Br, y I.

El término "hidroxicarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OH.

El término "nitro" se refiere a un sustituyente -NO₂.

25 A lo largo de la descripción, se lee la referencia a los compuestos de la fórmula I, incluyendo también isómeros ópticos y sales de la fórmula I, e hidratos de los mismos. Específicamente, cuando la fórmula I contiene un grupo alquilo de cadena ramificada, quedará entendido, que dichos
30 compuestos incluyen isómeros ópticos y racematos de los mismos. Las sales de ejemplo incluyen: clorhidrato,

bromhidrato, yodihidrato, y similares. Además, los compuestos de la fórmula I puede incluir formas tautoméricas.

Ciertos compuestos aquí descritos en este documento pueden existir como uno o más isómeros. Los expertos en la
5 técnica apreciarán que un isómero puede ser más activo que los otros. Por claridad, las estructuras descritas en la presente descripción se esbozan únicamente en forma geométrica, pero pretenden representar todas las formas geométricas y tautoméricas de la molécula.

10 También quedará entendido por los expertos en la técnica, que la sustitución adicional es permitible, a menos que se indique lo contrario, siempre que se satisfagan las reglas de enlace químico y energía de deformación y el producto exhiba aún actividad fungicida.

15 Otra modalidad de la presente descripción es un uso de un compuesto de la fórmula I, para protección de una planta contra el ataque por parte de un organismo fitopatogénico o el tratamiento de una planta infectada por un organismo fitopatogénico, en donde el uso comprende la aplicación de un
20 compuesto de la fórmula I, o una composición que comprende el compuesto a la tierra, una planta, una parte de la planta, un follaje y/o semillas.

Además, otra modalidad de la presente descripción es una composición útil para proteger una planta contra ataque por
25 parte de un organismo fitopatogénico y/o tratamiento de la planta infectada por un organismo fitopatogénico que comprende un compuesto de la fórmula I y un material transportador fisiológicamente aceptable.

Las características y ventajas adicionales de la presente
30 invención, podrán ser apreciados por los expertos en la técnica al momento de la consideración de la siguiente descripción

detallada de las modalidades ilustrativas que ejemplifican el mejor modo de llevar a cabo la presente invención, tal como se percibe actualmente.

Descripción Detallada de la Invención

5 Los compuestos de la presente descripción pueden aplicarse a través de una variedad de técnicas conocidas, ya sea en la forma de compuestos o como formulaciones que comprenden los compuestos. Por ejemplo, los compuestos pueden ser aplicados a las raíces, semillas o follajes de las
10 plantas para el control de diversos hongos, sin dañar el valor comercial de las plantas. Los materiales se pueden aplicar en la forma de cualesquiera tipos de formulación generalmente utilizados, por ejemplo, en la forma de soluciones, polvos, polvos humedecibles, concentrados fluibles o concentrados
15 emulsificantes.

Preferentemente, los compuestos de la presente descripción se aplican en la forma de una formulación, que comprende uno o más de los compuestos de la fórmula I con un transportador fitológicamente aceptable. Las formulaciones
20 concentradas pueden ser dispersadas en agua, u otros líquidos, para aplicaciones, o las formulaciones pueden ser tipo polvo o granulares, que posteriormente se pueden aplicar sin tratamiento adicional. Las formulaciones se pueden preparar de acuerdo con los procedimientos que son convencionales en las
25 artes químicas agrícolas.

La presente descripción contempla todos los vehículos a través de los cuales, se pueden formular uno o más de los compuestos para suministro y uso como un fungicida. Normalmente, las formulaciones se aplican como suspensiones
30 o emulsiones acuosas. Dichas suspensiones o emulsiones están producidas a partir de formulaciones solubles en agua,

suspendibles en agua o emulsificables, las cuales son sólidas, normalmente conocidas como polvos humedecibles, o líquidas, normalmente conocidas como concentrados emulsificables, suspensiones acuosas, o concentrados en suspensión. Tal como
5 se podrá apreciar fácilmente, se puede utilizar cualquier material al cual se pueda agregar estos compuestos, siempre que produzca la utilidad deseada sin interferencia significativa con la actividad de estos compuestos como agentes antifúngicos.

10 Los polvos humedecibles, los cuales se pueden compactar para formar gránulos dispersibles en agua, comprenden una mezcla profunda de uno o más de los compuestos de la fórmula I, un transportador inerte y tensoactivos. La concentración del compuesto en el polvo humedecible puede ser de
15 aproximadamente 10% hasta aproximadamente 90% en peso con base en el peso total del polvo humedecible, más preferentemente aproximadamente 25% en peso hasta aproximadamente 75% en peso. En la preparación de las formulaciones de polvo humedecible, los compuestos pueden
20 elaborarse en compuesto con cualquier sólido finamente dividido, tal como profilita, talco, carbonato de calcio, yeso, tierra de Fuller, bentonitea, atapulgita, almidón, caseína, gluten, arcilla de montmorilonita, tierra diatomácea, silicatos purificados o similares. En dichas operaciones, el transportador
25 finamente dividido y los tensoactivos se combinan normalmente con el compuesto(s) y se muelen.

Los concentrados emulsificables de los compuestos de la fórmula I, pueden comprender una concentración conveniente, tal como de aproximadamente 10% en peso hasta
30 aproximadamente 50% en peso del compuesto, en un líquido adecuado, con base en el peso total del concentrado. Los

compuestos se pueden disolver en un transportador inerte, el cual es ya sea un solvente mezclable en agua o una mezcla de solventes orgánicos no mezclables en agua, y emulsificantes. Los concentrados se pueden diluir con agua y aceite para
5 formar mezclas de rocío en la forma de emulsiones de aceite en agua. Los solventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alta ebullición de petróleo, tal como nafta aromática pesada. Otros solventes orgánicos también pueden ser utilizados, por ejemplo,
10 solventes terpénicos incluyendo derivados de rosina, cetonas alifáticas, tales como ciclohexanona, y alcoholes complejos, tal como 2-etoxietanol.

Los emulsificantes que pueden ser empleados de manera conveniente en la presente invención, podrán ser determinados
15 fácilmente por los expertos en la técnica e incluir diversos emulsificantes no iónicos, aniónicos, catiónicos, anfotéricos o una combinación de dos o más emulsificantes. Los ejemplos de emulsificantes no iónicos útiles para preparar los concentrados de emulsificantes, incluyen ésteres de polialquilenglicol y
20 productos de condensación de fenoles de alquilo y arilo, alcoholes alifáticos, aminas alifáticas o ácidos grasos con óxido de etileno, óxidos de propileno tales como fenoles de alquilo etoxilado y ésteres carboxílicos solubilizados con el poliol o polioxialquileno. Los emulsificantes catiónicos incluyen
25 compuestos de amonio cuaternario y sales de amina grasa. Los emulsificantes aniónicos incluyen las sales solubles en aceite (por ejemplo, calcio) de ácidos sulfónicos de alquilarilo, sales solubles en aceite o poliglicol éteres sulfatados y sales adecuadas de poliglicol éter fosfatado.

30 Los líquidos orgánicos representativos que se pueden emplear para preparar los concentrados emulsificables de los

compuestos de la presente invención, son los líquidos aromáticos tales como fracciones de xileno, benceno de propilo; o fracciones de naftaleno mezcladas, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos, tales como ftalato de dioctilo; keroseno; dialquilamidas de diversos ácidos grasos, particularmente las dimetilamidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como *n*-butílico, éter etílico o éter metílico de dietilenglicol, y éter metílico de trietilenglicol y similares. Las mezclas de dos o más líquidos orgánicos también se pueden emplear en la preparación del concentrado emulsificable. Los líquidos orgánicos incluyen fracciones de xileno, y benceno de propilo, siendo el xileno el más preferido en algunos casos. Los agentes de dispersión de superficie activa generalmente se emplean en formulaciones líquidas en una cantidad de 0.1% a 20% en peso con base en el peso combinado del agente de dispersión con uno o más de los compuestos y las formulaciones también pueden contener otros aditivos compatibles, por ejemplo, reguladores de crecimiento de plantas y otros compuestos biológicamente activos utilizados en la agricultura.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de uno o más compuestos insolubles en agua de la fórmula I, dispersos en un vehículo acuoso en una concentración dentro del rango de 5 hasta aproximadamente 50% en peso, con base en el peso total de la suspensión acuosa. Las suspensiones se preparan moliendo finamente uno o más de los compuestos, y mezclando vigorosamente el material molido en un vehículo que comprende agua y tensoactivos elegidos de los mismos tipos descritos anteriormente. Otros componentes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas y naturales, se pueden agregar para incrementar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso.

Con frecuencia es más efectivo moler y mezclar al mismo tiempo, preparando la mezcla acuosa y homogeinizándola en un implemento tal como un molino de arena, molido de bola u homogeinizador tipo pistón.

5 Las emulsiones acuosas comprenden emulsiones de uno o más de los ingredientes pesticidamente activos insolubles en agua, emulsificados en un vehículo acuoso en una concentración normalmente dentro del rango de 5 hasta aproximadamente 50% en peso, con base en el peso total de la
10 emulsión acuosa. Si el ingrediente pesticidamente activo es un sólido debe ser disuelto en un solvente no mezclable en agua adecuado antes de la preparación de la emulsión acuosa. Las emulsiones se preparan emulsificando el ingrediente líquido pesticidamente activo o solución no mezclable en agua del
15 mismo en un medio acuoso normalmente con la inclusión de tensoactivo que ayudan a la formación y estabilización de la emulsión, tal como se describió anteriormente. Esto con frecuencia se logra con la ayuda de un mezclado vigoroso proporcionado mediante mezcladores y homogeinizadores de
20 corte superior.

Los compuestos de la fórmula I también se pueden aplicar como formulaciones granulares, las cuales son particularmente útiles para aplicaciones a la tierra. Las formulaciones granulares, generalmente contienen de aproximadamente 0.5
25 hasta aproximadamente 10% en peso, con base en el peso total de la formulación granular del compuesto(s), dispersando un transportador inerte que consiste enteramente o en gran parte de material inerte dividido en forma gruesa tal como atalpigita, bentonita, diatomita, arcilla o una sustancia no costosa similar.
30 Dichas formulaciones se preparan normalmente disolviendo los compuestos con un solvente adecuado y aplicándolo a un

transportador granular el cual ha sido formado previamente al tamaño de partícula adecuado, dentro del rango de aproximadamente 0.5 hasta aproximadamente 3 mm. Un solvente adecuado es un solvente en el cual el compuesto es sustancial o completamente soluble. Dichas formulaciones también pueden ser preparadas elaborando una masa o pasta del transportador y el compuesto y el solvente, y triturando y secando para obtener la partícula granulada deseada.

Los polvos que contienen los compuestos de la fórmula I, se pueden preparar mezclando completamente uno o más de los compuestos en forma pulverizada con un transportador agrícola de polvo adecuado, tal como por ejemplo, arcilla de caolina, roca volcánica molida y similares. Los polvos pueden contener en forma adecuada de aproximadamente 1 hasta aproximadamente 10% en peso de los compuestos, con base en el peso total del polvo.

Las formulaciones pueden contener adicionalmente tensioactivos adyuvantes para aumentar la deposición, humectación y penetración de los compuestos en la cosecha y organismo objetivo. Estos tensioactivos adyuvantes pueden ser empleados opcionalmente como un componente de la formulación o como una mezcla en tanque. La cantidad de tensioactivo adyuvante normalmente variará de 0.01% a 1.0% en volumen, con base en el volumen de rocío del agua, preferentemente 0.05% a 0.5% en volumen.

Los tensioactivos adyuvantes adecuados incluyen, pero no se limitan a fenoles de nonilo etoxilados, alcoholes sintéticos o naturales etoxilados, sales de ésteres o ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y combinaciones de tensioactivos con aceites minerales o vegetales. Las formulaciones también pueden incluir emulsiones.

de aceite en agua tal como las descritas en la Solicitud de Patente Norteamericana Serie No. 11/495,228, cuya descripción está incorporada expresamente en la presente invención como referencia.

5 Las formulaciones pueden incluir opcionalmente combinaciones que contienen otros compuestos pesticidas. Dichos compuestos pesticidas adicionales pueden ser fungicidas, insecticidas, herbicidas, nematocidas, miticidas, artropodicidas, bactericidas o combinaciones de los mismos,
10 que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonizan con la actividad de los compuestos de la presente invención. Por consiguiente, dichas modalidades, el otro compuesto pesticida se emplea como un tóxico suplementario
15 para el mismo o un diferente uso pesticida. Los compuestos de la fórmula I y el compuesto pesticida en la combinación generalmente pueden estar presentes en una composición en peso de 1:100 a 100:1.

Los compuestos de la presente descripción también se
20 pueden combinar con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y mezclas sinérgicas de las mismas. Los compuestos fungicidas de la presente descripción con frecuencia se aplican junto con uno o más otros fungicidas para controlar una mayor variedad de enfermedades no deseadas. Cuando se utiliza junto
25 con otro fungicida(s), los compuestos reivindicados en este momento pueden ser formulados con el otro fungicida(s), mezclados en tanque de otro fungicida(s) o aplicados en secuencias con el otro fungicida(s). Dichos otros fungicidas pueden incluir 2-(tiocianatometil)-benzotiazol, 2-fenilfenol,
30 sulfato de 8-hidroxiquinolina, ametoctradin, amisulbrom, antimicin, *Ampelomyces quisqualis*, azaconazol, azoxistrobin,

Bacillus subtilis, cepa *Bacillus subtilis* QST713, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb-isopropilo, sal de bencilaminobenceno-sulfonato (BABS), bicarbonatos, bifenilo, bismertiazol, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, bórax, mezcla de Bordeaux,
 5 boscalid, bromuconazol, bupirimato, polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbendazim, carboxin, carpropamid, carvona, clazafenona, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, *Coniotyrium minitans*, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido
 10 cuproso, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, diamonio de etilenbis-(ditiocarbamato), diclofluanid, diclorofen, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, ion de difenzoquat, diflumentorim, dimetomorf, dimoxistrobin,
 15 diniconazol, diniconazol-M, dinobuton, dinocap, difenilamina, ditianon, dodemorf, acetato de dodemorf, dodina, base libre de dodina, edifenfos, enestrobin, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquin, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanilo, fempiclonilo,
 20 fenpropidin, fenpropimorf, fenpirazamina, fentin, acetato de fentin, hidróxido de fentin, ferbam, ferimzona, fruazinam, fludioxonilo, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, formaldehído, fosetilo,
 25 fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, acetatos de guazatina, GY-81, hexaclorobenzeno, hexaconazol, himexazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, iminoctadina tris(albesilato), yodocarb, ipconazol, ipfenpirazolona,
 30 iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, hidrato de clorhidrato de

kasugamicina, kresoxim-metilo, laminarin, mancobre, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipirim, mepronilo, meptil-dinocap, cloruro mercúrico, óxido mercúrico, cloruro mercurioso, metalaxilo, mefenoxam, metalaxil-M, metam, metam-amonio, 5 metam-potasio, metam-sodio, metconazol, metasulfocarb, yoduro de metilo, metilesotiocianato, metiram, metominostrobin, metrafenona, mildiomicin, miclobutanilo, nabam, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octilinona, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobin, oxadixilo, oxina-cobre, fumarato de 10 oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicuron, penflufen, pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentiopirad, acetato fenilmercurio, ácido fosfónico, ftalida, picoxistrobin, polioxin B, polioxinas, polioxorim, bicarbonato de potasio, sulfato hidroxiquinolina de potasio, probenazol, 15 procloraz, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobin, pirametostrobin, piraoxistrobin, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, piriofenona, piroquilon, quinoclamina, quinoxifen, quintozeno, 20 extracto de *Reynoutria sachalinensis*, sedaxano, siltiofam, simeconazol, 2-fenilfenóxido sodio, bicarbonato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, espiroxamina, azufre, SYP-Z071, SYP-Z048, aceites de alquitrán, tebuconazol, tebufloquin, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato- 25 metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo, tolilfluanid, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobin, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicin, valifenalato, valifenal, vinclozolin, zineb, ziram, zoxamida, *Candida oleofila*, *Fusarium oxisporum*, *Gliocladium spp.*, *Phlebiopsis gigantea*, 30 *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma spp.*, (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano,

hidrato de 1,3-dicloro-1,1,3,3-tetrafluoroacetona, 1-cloro-2,4-
 dinitronaftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 2-(2-heptadecil-2-
 imidazolin-1-il)etanol, 1,1,4,4-tetraóxido de 2,3-dihidro-5-fenil-
 1,4-diti-ina, acetato de 2-metoxietilmercurio, cloruro de 2-
 5 metoxietilmercurio, 2-silicato de metoxietilmercurio, 3-(4-
 clorofenil)-5-metilrhodanina, tiocianatemo de 4-(2-nitroprop-1-
 enil)fenilo, ampropilfos, anilazina, azitiram, polisulfuro de bario,
 Bayer 32394, benodanilo, benquinox, bentaluron, benzamacrilo;
 benzamacril-isobutilo, benzamorf, binapacrilo,
 10 bis(metilmercurio) sulfato, óxido de bis(tributilestaño),
 butiobato, sulfato de cromato de zinc de cobre de calcio de
 cadmio, carbamorf, CECA, clobentiazona, cloraniformetan,
 clorfenazol, clorquinox, climbazol, ciclafuramid, cependazol,
 ciprofuram, decafentin, diclona, diclozolina, diclobutrazol,
 15 dimetirimol, dinocron, dinosulfon, dinoterbon, dipiritiona,
 ditalimfos, dodicin, drazoxolon, EBP, ESBP, etaconazol, etem,
 etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropan, 5-fluorocitosina y
 profungicidas de los mismos, fluotrimazol, furcarbanilo,
 furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, furofanato, gliodina,
 20 griseofulvin, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858,
 isopamfos, isovalediona, mebenilo, mecarbinzid, metazoxolon,
 metfuroxam, diciandiamida de metilmercurio, metsulfovax,
 milneb, anhidro de mucoclórico, miclozolin, N-3,5-diclorofenil-
 succinimida, N-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, N-
 25 etilmercurio-4-toluensulfonanilida, níquel de
 bis(dimetilditiocarbamato), OCH, fenilmercurio de
 dimetilditiocarbamato, nitrato de fenilmercurio, fosdifen,
 picolinamida UK-2A y derivados de los mismos, protiocarb;
 clorhidrato de protiocarb, piracarbolid, piridinitrilo, piroxiclor,
 30 piroxifur, quinacetol; sulfato de quinacetol, quinazamid,
 quinconazol, rabenzazol, salicilanilide, SSF-109, sultropen,

tecoram, tiadifluor, ticiofen, tioclorfenfim, tiofanato, tioquinox, tioximid, triamifos, triarimol, triazbutilo, triclamida, urbacid, zarilamida, y cualesquiera combinaciones de los mismos.

Además, los compuestos de la presente invención se
5 pueden combinar con otros pesticidas, incluyendo insecticidas, nematocidas, miticidas, artropodicidas, bactericidas o combinaciones de los mismos que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonizan con la actividad con los
10 compuestos de la presente invención para formar mezclas pesticidas y mezclas sinérgicas de los mismos. Los compuestos fungicidas de la presente descripción pueden aplicar junto con uno o más de otros pesticidas para controlar una mayor variedad de pestes indeseables. Cuando se utilizan junto con
15 otros pesticidas, los compuestos reivindicados en la presente invención se pueden formular con otros pesticida(s), mezclarse en tanque con otro pesticida(s) o aplicarse en secuencias con el otro pesticida(s). Los insecticidas típicos incluyen pero no se limitan a *insecticidas antibióticos* tales como alosamidin y
20 *turingiensin*; *insecticidas de lactona macrocíclicos* tales como spinosad y spinetoram; *insecticidas de avermectin* tales como abamectin, doramectin, emamectin, eprinomectin, ivermectin y selamectin; *insecticidas de milbemycin* tales como lepimectin, milbemectin, oxima de milbemycin y moxidectina; *insecticidas*
25 *arsénicos* tales como arsenato de calcio, acetoarsenita de cobre, arsenato de cobre, arsenato de plomo, arsenita de potasio y arsenita de sodio; *insecticidas botánicos* tales como anabasina, azadiractin, *d*-limoneno, nicotina, piretrinas, cinerinas, cinerina I, cinerina II, jasmolin I, jasmolin II, piretrin
30 I, piretrin II, quassia, rotenona, riania y sabadilla; *insecticidas de carbamato* tales como bendiocarb y carbarilo; *insecticidas de*

metilcarbamato de benzofuranilo tales como benfuracarb, carbofuran, carbosulfan, decarbofuran y furatiocarb; *insecticidas de dimetilcarbamato* tales como dimitan, dimetilan, hiquincarb y pirimicarb; *insecticidas de carbamato de oxima* tales como alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, metomilo, nitrilacarb, oxamilo, tazimcarb, tiocarboxima, tiodicarb y tiofanox; *insecticidas de metilcarbamato de fenilo* tales como alixicarb, aminocarb, bufencarb, butacarb, carbanolato, cloetocarb, dicresilo, dioxacarb, EMPC, etiofencarb, fenetacarb, fenobucarb, isoprocab, metiocarb, metolcarb, mexacarbato, promacilo, promecarb, propoxur, trimetacarb, XMC y xililcarb; *insecticidas disecantes* tales ácido bórico, tierra diatomácea y gel de sílice; *insecticidas de diamina* tales como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; *insecticidas de dinitrofenol* tales como dinex, dinoprop, dinosam y DNOC; *insecticidas de fluoro* tales como hexafluorosilicato de bario, criolita, fluoruro de sodio, hexafluorosilicato de sodio y sulfluramid; *insecticidas de formamidina* tales como amitraz, clordimeform, formetanato y formpamnato; *insecticidas fumigantes* tales como acrilonitrilo, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, cloroformo, cloropicrina, para-diclorobenzeno, 1,2-dicloropropano, formato de etilo, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, cianuro de hidrógeno, yodometano, bromuro de etilo, metilcloroformo, cloruro de metileno, naftaleno, fosfina, fluoruro de sulfurilo y tetracloroetano; *insecticidas inorgánicos* tales como bórax, polisulfuro de calcio, oleato de cobre, cloruro mercurioso, tiocianato de potasio y tiocianato de sodio; *inhibidores de síntesis de quitin* tales como bistrifluron, buprofezin, clorfluazuron, ciromazina, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron,

noviflumuron, penfluron, teflubenzuron y triflumuron; *miméticos de hormona juvenil* tales como epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifen y tripreno; *hormona juveniles* tales como hormona juvenil I, hormona juvenil II y hormona juvenil III; *agonistas de hormona de cambio* tales como cromafenozida, halofenozida, metoxifenoza y tebufenoza; *hormonas de cambio* tales como α -ecdisona y ecdisterona; *inhibidores de cambio* tales como diofenolan; *precocenos* tales como precoceno I, precoceno II y precoceno III; *reguladores de crecimiento de insectos no clasificados* tales como diciclanilo; *insecticidas de análogo de nereistoxina* tales como bensultap, cartap, tiociclam y tiosultap; *insecticidas nicotinoides* tales como flonicamid; *insecticidas de nitroguanidina* tales como clotianidina, dinotefuran, imidacloprid y tiametoxam; *insecticidas de nitrometileno* tales como nitenpiram y nitiazina; *insecticidas de piridilmetil-amina* tales como acetamiprid, imidacloprid, nitenpiram y tiacloprid; *insecticidas de organocloro* tales como bromo-DDT, camfeclor, DDT, pp'-DDT, etil-DDD, HCH, gamma-HCH, lindano, metoxiclor, pentaclorofenol y TDE; *insecticidas de ciclodieno* tales como aldrin, bromociclen, clorbiciclen, clordano, clordecona, dieldrin, dilor, endosulfan, alfa-endosulfan, endrin, HEOD, heptaclor, HHDN, isobenzan, isodrin, kelevan y mirex; *insecticidas de organofosfato* tales como bromfenvinfos, clorfenvinfos, crotoxifos, diclorvos, dicrotofos, dimetilvinfos, fospirato, heptenofos, metocrotofos, mevinfos, monocrotofos, naled, naftalofos, fosfamidon, propafos, TEPP y tetraclorvinfos; *insecticidas de organotiofosfato* tales como dioxabenzofos, fosmetilan y fentoato; *insecticidas de organotiofosfato alifático* tales como acetion, amiton, cadusafos, cloretoxifos, clormefos, demefion, demefion-O, demefion-S, demeton, demeton-O,

demeton-S, demeton-metilo, demeton-O-metilo, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfon, disulfoton, etion, etoprofos, IPSP, isotioato, malation, metacrifos, oxidemeton-metilo, oxideprofos, oxidisulfoton, forato, sulfotep, terbufos y tiometon;

5 *insecticidas de organotiofosfato de amida alifática* tales como amidition, ciantoato, dimetoato, etoato-metilo, formotion, mecarbam, ometoato, protoato, sofamida y vamidotion; *insecticidas de organotiofosfato de oxima* tales como clorfoxim, foxim y foxim-metilo; *insecticidas de organotiofosfato*

10 *heterocíclico* tales como azametifos, zoumafos, coumitoato, dioxation, endotion, menazon, morfotion, fosalona, piraclofos, piridafention y quinotion; *insecticidas de organotiofosfato de benzotipirano* tales como diticrofos y ticrofos; *insecticidas de organotiofosfato de benzotriazina* tales como azinfos-etilo y

15 azinfos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de isoindol* tales como dialifos y fosmet; *insecticidas de organotiofosfato de isoxazol* tales como asesoxation y zolaprofos; *insecticidas de organotiofosfato de pirazolopirimidina* tales como clorprazofos y pirazofos; *insecticidas de organotiofosfato de piridina* tales

20 como clorpirifos y clorpirifos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de pirimidina* tales como butatiofos, diazinon, etrimfos, lirimfos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, primidofos, pirimitato y tebupirimfos; *insecticidas de organotiofosfato de quinoxalina* tales como quinalfos y quinalfos-metilo; *insecticidas*

25 *de organotiofosfato de tiadiazol* tales como atidation, litidation, metidation y protidation; *insecticidas de organotiofosfato de triazol* tales como asesazofos y triazofos; *insecticidas de organotiofosfato de fenilo* tales como azotoato, bromofos, bromofos-etilo, carbofenotion, clortiofos, cianofos, citioato,

30 dicapton, diclofention, etafofos, famfur, fenclorfos, fenitroton, fensulfotion, fention, fention-etilo, heterofos, jodfenfos,

mesulfenfos, paration, paration-metilo, fenkapton, fosniclor, profenofos, protiofos, sulprofos, temefos, triclormetafos-3 y trifenofos; *insecticidas de fosfonato* tales como butonato y triclorfon; *insecticidas de fosfonotioato* tales como mecarfon;

5 *insecticidas de etilfosfonotioato de fenilo* tales como fonofos y tricloronat; *insecticidas de fenilfosfonotioato de fenilo* tales como cianofenfos, EPN y leptofos; *insecticidas de amidato de fósforo* tales como crufomato, fenamifos, fostietan, mefosfolan, fosfolan y pirimetafos; *insecticidas de fosforamidotioato* tales

10 como acefato, isocarbofos, isofenfos, isofenfos-metilo, metamidofos y propetamfos; *insecticidas de fosforodiamida* tales como dimefox, mazidox, mipafox y scradan; *insecticidas de oxadiazina* tales como indoxacarb; *insecticidas de oxadiazolina* tales como metoxadiazona; *insecticidas de*

15 *ftalimida* tales como dialifos, fosmet y tetrametrin; *insecticidas de pirazol* tales como tebufenpirad, tolefenpirad; *insecticidas de fenilpirazol* tales como acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, piriprol y vaniliprol; *insecticidas de éster piretroide* tales como acrinatrin, aletrin, bioaletrin, bartrin, bifentrin, bioetanometrin,

20 ciclettrin, cicloprotrin, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrin, gamma-cihalotrin, lambda-cihalotrin, cipermetrin, alfa-cipermetrin, beta-cipermetrin, teta-cipermetrin, zeta-cipermetrin, cifenotrin, deltametrin, dimeflutrin, dimetrin, empentrin, fenflutrin, fenpiritrin, fenpropatrin, fenvalerato, esfenvalerato, flucitrinato,

25 fluvalinato, tau-fluvalinato, furetrin, imiprotrin, meperflutrin, metoflutrin, permetrin, biopermnetrin, transpermnetrin, fenotrin, pralletrin, proflutrin, piresmetrin, resmetrin, bioresmetrin, cismetrin, teflutrin, teralletrin, tetrametrin, tetrametilflutrin, tralometrin y transflutrin; *insecticidas de piretroide* tales como

30 etofenprox, flufenprox, halfenprox, protrifenbuto y silafluofen; *insecticidas de pirimidinamina* tales como flufenerim y

pirimidifen; *insecticidas de pirrol* tales como clorfenapir; *insecticidas de ácido tetrámico* tales como espirotetramat; *insecticidas de ácido tetrónico* tales como espiromesifen; *insecticidas de tiourea* tales como diafentiuron; *insecticidas de*
5 *urea* tales como flucofuron y sulcofuron; *insecticidas no*
clasificados tales como closantel, naftenato de cobre, crotamiton, EXD, fenazaflor, fenoxacrim, hidrametilnon, isoprotilano, malonoben, metaflumizona, nifluridida, plifenato, piridaben, piridalilo, pirifluquinazon, rafoxanida, sulfoxaflor,
10 triarateno y triazamato, y combinaciones de los mismos.

Además, los compuestos de la presente invención se pueden combinar con herbicidas que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonizan con la actividad de los
15 compuestos de la presente invención para formar mezclas pesticidas y mezclas sinérgicas de los mismos. Los compuestos fungicidas de la presente descripción se pueden aplicar junto con uno o más herbicidas para controlar una amplia variedad de plantas indeseables. Cuando se utilizan junto con herbicidas,
20 los compuestos aquí reivindicados se pueden formular con el herbicida(s), mezclarse en tanque con el herbicida(s) o aplicarse en secuencias con el herbicida(s). Los herbicidas típicos incluyen pero no se limitan a: *herbicidas de amida* tales como alidoclor, beflubutamid, benzadox, benzipram,
25 bromobutida, cafenstrol, CDEA, ciprazol, dimetenamid, dimetenamid-P, difenamid, epronaz, etnipromid, fentrazamida, flupoxam, fomesafen, halosafen, isocarbamid, isoxaben, napropamida, naptalam, petoxamid, propizamida, quinonamid y tebutam; *herbicidas de anilida* tales como cloranocrilo,
30 cisanilida, clomeprop, cipromid, diflufenican, etobenzanid, fenasulam, flufenacet, flufenican, mefenacet, mefluidida,

metamifop, monalida, naproanilida, pentanoclor, picolinafen y propanil; *herbicidas de arilalanina* tales como benzoilprop, flamprop y flamprop-M; *herbicidas de cloroacetanilida* tales como acetoclor, alaclor, butaclor, butenaclor, delaclor, dietatilo, 5 dimetaclor, metazaclor, metolaclor, S-metolaclor, pretilaclor, propaclor, propisoclor, prinaclor, terbuclor, tenilclor y xilaclor; *herbicidas de sulfonanilida* tales como benzofluor, perfluidona, pirimisulfan y profluazol; *herbicidas de sulfonamida* tales como asulam, carbasulam, fenasulam y orizalin; *herbicidas de* 10 *tioamida* tales como clortiamid; *herbicidas antibióticos* tales como bilanafos; *herbicidas de ácido benzoico* tales como cloramben, dicamba, 2,3,6-TBA y tricamba; *herbicidas de ácido pirimidiniloxibenzoico* tales como bispiribac y piriminobac; *herbicidas de ácido pirimidiniltiobenzoico* tales como piritiobac; 15 *herbicidas de ácido ftálico* tales como clortal; *herbicidas de ácido picolínico* tales como aminopirialid, clopiralid y picloram; *herbicidas de ácido quinolincarboxílico* tales como quinclorac y quinmerac; *herbicidas arsénicos* tales como ácido cacodílico, CMA, DSMA, hexaflurato, MAA, MAMA, MSMA, arsenita de 20 potasio y arsenita de sodio; *herbicidas de benzoilciclohexanediona* tales como mesotriona, sulcotriona, tefuriltriona y tembotriona; *herbicidas de alquilsulfonato benzofuranilo* tales como benfuresato y etofumesato; *herbicidas de benzotiazol* tales como benzazolin; *herbicidas de carbamato* 25 tales como asulam, clorprocarb de carboxazol, diclormato, fenasulam, karbutilato y terbucarb; *herbicidas de carbanilato* tales como barban, BCPC, carbasulam, carbetamida, CEPC, clorbufam, clorprofam, CPPC, desmedifam, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, profam y swep; *herbicidas de* 30 *oxima de ciclohexeno* tales como aloxidim, butroxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim y

tralcoxidim; *herbicidas de ciclopropilisoxazol* tales como isoxaclortol e isoxaflutol; *herbicidas de dicarboximida* tales como cinidon-etilo, flumezin, flumiclorac, flumioxazin y flumipropin; *herbicidas de dinitroanilina* tales como benfluralin, 5 butralin, dinitramina, etalfluralin, flucloralin, isopropalin, metalpropalin, nitralin, orizalin, pendimetalin, prodiamina, profluralin y trifluralin; *herbicidas de dinitrofenol* tales como dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, DNOC, etinofen y medinoterb; *herbicidas de éter difenílico* tales como 10 etoxifen; *herbicidas de éter nitrofenílico* tales como acifluorfen, aclonifen, bifenox, clometoxifen, clornitrofen, etnipromid, fluorodifen, fluoroglucofen, fluoronitrofen, fomesafen, furiloxifen, halosafen, lactofen, nitrofen, nitrofluorfen y oxifluorfen; *herbicidas de ditiocarbamato* tales como dazomet y 15 metam; *herbicidas alifáticos halogenados* tales como alorac, cloropon, dalapon, flupropanato, hexacloroacetona, yodometano, bromuro de metilo, ácido monocloroacético, SMA y TCA; *herbicidas de imidazolinona* tales como imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin y imazetapir; 20 *herbicidas inorgánicos* tales como sulfamato de amonio, bórax, clorato de calcio, sulfato de cobre, sulfato ferroso, azida de potasio, cianato de potasio, azida de sodio, clorato de sodio y ácido sulfúrico; *herbicidas de nitrilo* tales como bromobonilo, bromoxinilo, cloroxinilo, diclobenilo, iodobonilo, ioxinilo y 25 piraclonilo; *herbicidas de organofosforosos* tales como amiprofos-metilo, anilofos, bensulida, bilanafos, butamifos, 2,4-DEP, DMPA, EBEP, fosamina, glufosinato, glufosinato-P, glifosato y piperofos; *herbicidas fenoxi* tales como bromofenoxim, clomeprop, 2,4-DEB, 2,4-DEP, difenopenten, 30 disul, erbon, etnipromid, fenteracol y trifopsima; *herbicidas de oxadiazolina* tales como metazol, oxadiargilo, oxadiazon;

herbicidas de oxazol tales como fenoxasulfona; *herbicidas de fenoxiacéticos* tales como 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-tioetilo y 2,4,5-T; *herbicidas de fenoxibutíricos* tales como 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB y 2,4,5-TB; *herbicidas de fenoxipropiónicos* tales como cloprop, 4-CPP, diclorprop, diclorprop-P, 3,4-DP, fenoprop, mecoprop y mecoprop-P; *herbicidas de ariloxifenoxipropiónico* tales como clorazifop, clodinafop, clofop, cihalofop, diclofop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentiafop, fluazifop, fluazifop-P, haloxifop, haloxifop-P, isoxapirifop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P y trifop; *herbicidas de fenilendiamina* tales como dinitramina y prodiamina; *herbicidas de pirazol* tales como piroxasulfona; *herbicidas de benzoilpirazol* tales como benzofenap, pirasulfotol, pirazolinato, pirazoxifen, y topramezona; *herbicidas de fenilpirazol* tales como fluazolato, nipiraclofen, pioxaden y piraflufen; *herbicidas de piridazina* tales como credazina, piridafol y piridate; *herbicidas de piridazinona* tales como brompirazon, cloridazon, dimidazon, flufenpir, metflurazon, norflurazon, oxapirazon y pidanon; *herbicidas de piridina* tales como aminopirialid, cliodinato, clopiralid, ditiofir, fluroxipir, haloxidina, picloram, picolinafen, piriclor, tiazopir y triclopir; *herbicidas de pirimidinodiamina* tales como iprimidam y tioclorim; *herbicidas de amonio cuaternario* tales como ciperquat, dietamquat, difenzoquat, diquat, morfamquat y paraquat; *herbicidas de tiocarbamato* tales como butilato, cicloato, di-alato, EPTC, esprocarb, etiolato, isopolinato, metiobencarb, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, piributicarb, sulfalato, tiobencarb, tiocarbazilo, tri-alato y vernolato; *herbicidas de tiocarbonato* tales como dimexano, EXD y proxan; *herbicidas de tiourea* tales como metiurón; *herbicidas de triazina* tales como dipropetrin, indaziflam,

triaziflam y trihidroxitriazina; *herbicidas de clorotriazina* tales como atrazina, clorazina, cianazina, ciprazina, eglinazina, ipazina, mesoprazina, prociazina, proglinazina, propazina, sebutilazina, simazina, terbutilazina y trietazina; *herbicidas de metoxitriazina* tales como atraton, metometon, prometon, secbumeton, simeton y terbumeton; *herbicidas de metiltiotriazina* tales como ametrin, aziprotrina, cianatrin, desmetrin, dimetametrin, metoprotrina, prometrin, simetrin y terbutrin; *herbicidas de triazinona* tales como ametridiona, amibuzin, hexazinona, isometiozin, metamitron y metribuzin; *herbicidas de triazol* tales como amitrol, cafenstrol, epronaz y flupoxam; *herbicidas de triazolona* tales como amicarbazona, bencarbazona, carfentrazona, flucarbazona, ipfencarbazona, propoxicarbazona, sulfentrazona y tiencarbazona-metilo; *herbicidas de triazolopirimidina* tales como cloransulam, diclosulam, florasulam, flumetsulam, metosulam, penoxsulam y piroxsulam; *herbicidas de uracilo* tales como benzfendizona, bromacilo, butafenacilo, flupropacil, isocilo, lenacilo, saflufenacilo y terbacilo; *herbicidas de urea* tales como benztiazuron, cumiluron, cicluron, dicloralurea, diflufenzopir, isonoruron, isouron, metabenztiazuron, monisouron y noruron; *herbicidas de fenilurea* tales como anisuron, buturon, clorbromuron, cloreturon, clorotoluron, cloroxuron, daimuron, difenoxuron, dimefuron, diuron, fenuron, fluometuron, fluotiuron, isoproturon, linuron, metiuron, metildiimron, metobenzuron, metobromuron, metoxuron, monolinuron, monuron, neburon, parafluron, fenobenzuron, siduron, tetrafluron y tidiazuron; *herbicidas de pirimidinilsulfonilurea* tales como amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, clorimuron, ciclosulfamuron, etoxisulfuron, flazasulfuron, flucetosulfuron, flupirsulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron, mesosulfuron,

metazosulfuron, nicosulfuron, ortosulfamuron, oxasulfuron, primisulfuron, propirisulfuron, pirazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron y trifloxisulfuron; *herbicidas de triazinilsulfonilurea* tales como clorsulfuron, cinosulfuron, 5 etametsulfuron, yodosulfuron, metsulfuron, prosulfuron, tifensulfuron, triasulfuron, tribenuron, triflusulfuron y tritosulfuron; *herbicidas de tiadiazolilurea* tales como butiuron, etidimuron, tebutiuron, tiazafluron y tidiazuron; herbicidas no clasificados tales como acrolein, alcohol alilo, 10 aminociclopiraclor, azafenidin, bentazona, benzobiciclon, biciclopirona, butidazol, cianamida de calcio, cambendiclor, clorfenac, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cinmetilin, clomazona, CPMF, cresol, cianamida, orto-diclorobenceno, dimepiperato, endotal, fluoromidina, fluridona, flurocloridona, 15 flurtamona, flutiacet, indanofan, metilesotiocianato, OCH, oxaziclomefona, pentaclorofenol, pentoxazona, acetato de fenilmercurio, prosulfalin, piribenzoxim, piriftalid, quinoclamina, rodetanilo, sulglucapin, tidiazimin, tridifano, trimeturon, tripropindan y tritac.

20 Otra modalidad de la presente descripción es un método para el control o prevención de ataque fúngico. Este método comprende aplicar a la tierra, plantas, raíces, follaje, semilla o área del hongo, o a un área en la cual se evitará la infestación (por ejemplo, aplicando a plantas de cereal), una cantidad 25 fungicidamente efectiva de uno o más de los compuestos de la fórmula I. Los compuestos son adecuados para el tratamiento de diversas plantas en niveles fungicidas, mientras exhiben baja fitotoxicidad. Los compuestos pueden ser útiles tanto en una forma protectora y/o erradicante.

30 Se ha descubierto que los compuestos tienen efectos fungicida significativo, particularmente para uso agrícola.

Muchos de los compuestos son particularmente efectivos para utilizarse con cosechas agrícolas y plantas de horticultura. Los beneficios adicionales pueden incluir, pero no se limitan a, mejoría de la salud de la planta; mejoría del rendimiento de la
5 planta (por ejemplo, biomasa incrementada y/o contenido incrementado en ingredientes valiosos), mejoría del vigor de la planta (por ejemplo, crecimiento de planta mejorada y/o hojas más verdes); mejoría de la calidad de una planta (por ejemplo, contenido o composición de ciertos ingredientes mejorados); y
10 mejoría de la tolerancia a tensión abiótica y/o biótica de la planta.

Los expertos en la técnica podrán apreciar que la eficacia del compuesto del hongo anterior, establece la utilidad general de los compuestos como fungicidas.

15 Los compuestos tienen amplios rangos de actividad contra patógenos fúngicos. Los patógenos de ejemplo pueden incluir, pero no se limitan a, enfermedad fúngica foliar en trigo (*Septoria tritici*, también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), roña de manzano (*Venturia inaequalis*), y Manchas
20 de *Cercospora* en hoja de remolacha (*Cercospora beticola*), manchas de hoja de cacahuete (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*) y otras cosechas, y sigatoka negra de plátanos (*Mycosphaerella fijiensis*). La cantidad exacta de material reactivo que será aplicada depende no únicamente del
25 material activo específico que esté siendo aplicado, sino también de la acción deseada en particular, la especie fúngica que será controlada, y la etapa de crecimiento de la misma, así como la parte de la planta u otro producto que se ponga en contacto con el compuesto. Por lo tanto, todos los compuestos y
30 formulaciones que contienen los mismos, pueden no ser iguales y efectivos en concentraciones similares o contra la misma

especie fúngica.

Los compuestos son efectivos para utilizarse con plantas en una cantidad para inhibir la enfermedad y fitológicamente aceptable. El término "cantidad para inhibir la enfermedad y fitológicamente aceptable" se refiere a una cantidad de un compuesto que extermina o inhibe la enfermedad de la planta para la cual se desea el control, pero no es significativamente tóxica para la planta. Esta cantidad generalmente será de aproximadamente 0.1 a aproximadamente 1000 ppm (partes por millón) con 1 a 500 siendo la cantidad preferida. La cantidad exacta de un compuesto requerido, varía con la enfermedad fúngica que será controlada, el tipo de formulación empleada, el método de aplicación, la especie de la planta en particular, condiciones climatológicas y similares. Un rango de aplicación adecuado normalmente es de aproximadamente 0.10 hasta aproximadamente 4 libras/acre (aproximadamente 0.01 a 0.45 gramos por metro cuadrado, g/m^2).

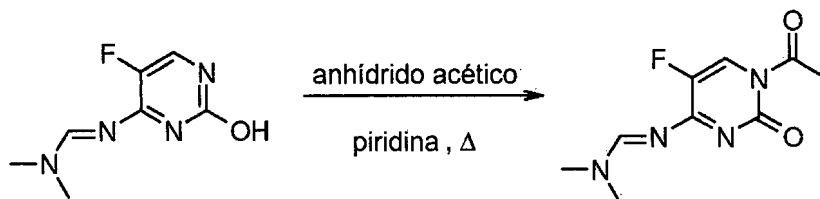
Cualquier rango o valor deseado aquí proporcionado, puede ser extendido o alterado sin perder los efectos observados, tal como lo podrán apreciar los expertos en la técnica, para una comprensión de las enseñanzas aquí presentadas.

Los compuestos de la fórmula I, pueden elaborarse utilizando procedimientos químicos bien conocidos. Los intermediarios no mencionados en forma específica en la presente invención, están ya sea comercialmente disponibles, o se pueden elaborar a través de las rutas descritas en la literatura química, o pueden ser fácilmente sintetizadas a partir de materiales de partida comerciales que utilizan procedimientos estándar.

Los siguientes ejemplos se presentan para ilustrar los

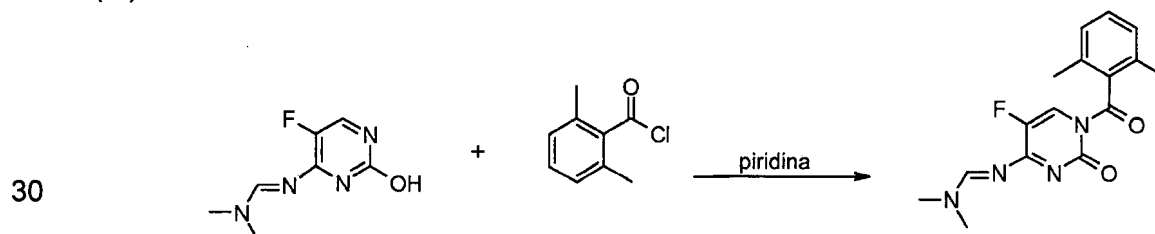
diversos aspectos de los compuestos de la presente descripción, y no deben ser construidos como limitaciones para las reivindicaciones.

Ejemplo 1: Preparación de *N'*-(1-acetil-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamidina (1)



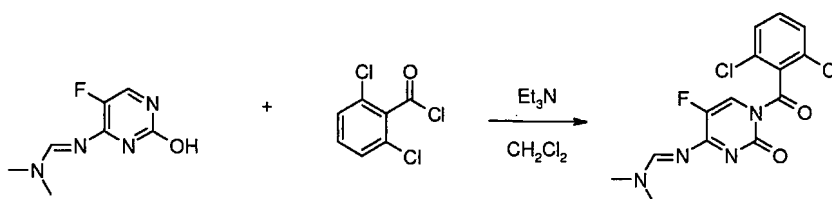
Se suspendió *N'*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamidina (70 miligramos (mg), 38 milimoles (mmoles)) en piridina (1 mililitro (mL)), y se agregó anhídrido acético (3 gotas, exceso). El frasco de reacción se agitó y se calentó brevemente con una pistola de calor hasta que se obtuvo una solución clara. Al momento del enfriamiento, la solución de reacción permaneció clara, y el análisis de Cromatografía Líquida de Ultradesepeño (UPLC) indicó el 100% de conversión a un material con el peso molecular (MW) del producto deseado. La evaporación produjo un residuo sólido el cual se tomó con una pequeña cantidad de éter dietílico (Et_2O) y heptano y se filtró para producir el compuesto del título en la forma de un sólido color blanco (57 mg, 65%): pf 125-130°C dec; ^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) δ 8.88 (s, 1H), 8.19 (d, 1H), 3.29 (br s, 6H), 2.81 (s, 3H); ESIMS m/z 227 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 2: Preparación de *N'*-[1-(2,6-dimetilbenzoil)-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidro-pirimidin-4-il]-*N,N*-dimetilformamidina (2)



A un frasco con tapa de tornillo de 7 mL se le agregaron piridinas (2 mL), *N'*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamida (100 mg, 0.54 mmoles), y cloruro de 2,6-dimetilbenzoilo (102 mg, 0.60 mmoles). La mezcla se calentó a una temperatura de 40°C durante 2 horas, se evaporó hasta secarse y se dividió entre acetato de etilo (EtOAc) y agua (H₂O). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio (MgSO₄), se filtró y se evaporó y el residuo se purificó mediante cromatografía de fase inversa para producir el compuesto del título en la forma de un sólido color blanco (63 mg, 37%): pf 120-150°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8.81 (s, 1H), 8.22 (d, J = 6.04 Hz, 1H), 7.23-7.17 (m, 1H), 7.07-7.01 (m, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 2.24 (s, 6H); ESIMS *m/z* 317 ([M+H]⁺).

Ejemplo 3: Preparación de *N'*-[1-(2,6-diclorobenzoil)-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidro-pirimidin-4-il]-*N,N*-dimetilformamida (3)

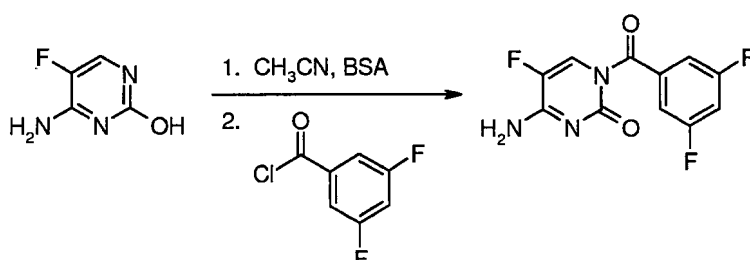


A un frasco con tapa de tornillo de 8 mL se le agregaron diclorometano (CH₂Cl₂; 4 mL), *N'*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamida (100 mg, 0.54 mmoles), y trietilamina (Et₃N; 120 mg, 1.2 mmoles). A esta mezcla se le agregó cloruro de 2,6-diclorobenzoilo (113 mg, 0.54 mmoles), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas. Después de la evaporación hasta secarse, el residuo se tomó en *N,N*-dimetilformamida (DMF; 2 mL), se filtró y se colocó directamente sobre una columna de cromatografía de fase inversa. Después de elución, el compuesto del título se aisló en la forma de un sólido amarillo pálido (75 mg, 39%): pf 185-187°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8.80 (s, 1H), 8.20 (d, J =

5.6 Hz, 1H), 7.31-7.20 (m, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.21 (s, 3H); ESIMS m/z 357 ($[M+H]^+$).

Los compuestos 4 a 12 en la tabla I se prepararon de acuerdo con el Ejemplo 3.

5 Ejemplo 4: Preparación de 4-amino-1-(3,5-difluorobenzoyl)-5-fluoro-1H-pirimidin-2-ona (13)



10

A un frasco con tapa de tornillo de 8 mL que contiene 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol* (100 mg, 0.775 mmoles) y acetonitrilo (CH_3CN ; 3 mL) se le agregó bis-*N,O*-trimetilsililacetamida (BSA; 378 microlitros (μL), 1.55 mmoles). La mezcla se calentó a una temperatura de 70°C durante 1 hora, dando como resultado una solución clara. Después de enfriarse a temperatura ambiente, se agregó cloruro de 3,5-difluorobenzoylo (182 μL , 1.55 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Se formó un precipitado color blanco y se recolectó mediante filtración al vacío. El sólido se lavó con Et_2O (1 x 10 mL) y se secó con aire durante la noche para proporcionar el producto final en la forma de un sólido color blanco (126 mg, 60%): pf $227-231^\circ\text{C}$; ^1H RMN (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.54 (br s, 1H), 8.27 (br s, 1H), 8.14 (d, $J = 6.8$ Hz, 1H), 7.80-7.35 (m, 3H); ESIMS m/z 270 ($M+H$), 268 ($M-H$).

20

25

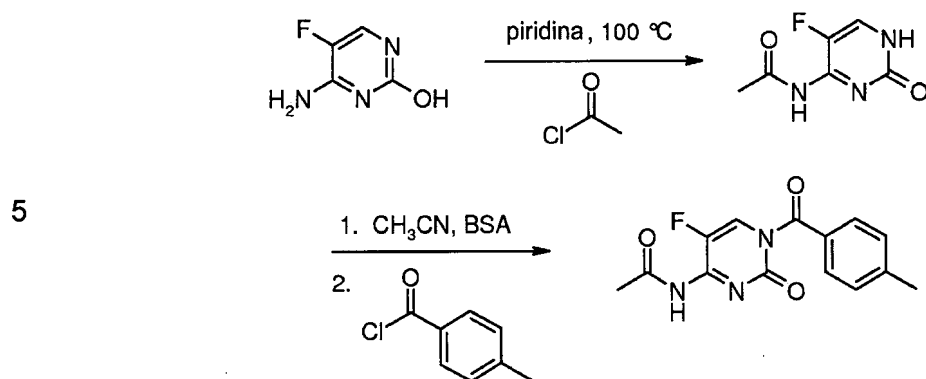
*El 4-Amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol se compró en el mercado.

Los compuestos 14 a 20 en la tabla I, se prepararon de acuerdo con el Ejemplo 4.

30

Ejemplo 5: Preparación de *N*-(5-fluoro-1-(4-metilbenzoyl)-

2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)acetamida (21)



A) A un frasco de fondo redondo a temperatura ambiente
 10 se le agregó 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol* (5.0 g, 38.7
 mmoles) y piridina seca (25 mL) seguido de cloruro de acetilo
 (3.35 mL, 42.6 mmoles). La mezcla se calentó a una
 temperatura de 100°C durante 90 minutos originando que el
 sólido se disolviera. La mezcla de reacción se enfrió a
 15 temperatura ambiente (tiempo durante el cual se precipitó un
 sólido de la solución). El sólido se filtró y se lavó en forma
 sucesiva con pequeñas cantidades de alcohol etílico (EtOH),
 agua de hielo y t-butil éter metílico (MTBE, 50 mL), para
 proporcionar un material sólido color blanco. El sólido crudo se
 20 recristalizó a partir de EtOH y se secó a temperatura ambiente
 en un horno de vacío durante 2 horas para proporcionar un
 sólido color blanco (4.3 g, 65%).

*El 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol se compró en el
 mercado.

25 B) A un frasco de fondo redondo que contiene N-(5-fluoro-
 2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)acetamida (350 mg, 2.04 mmoles)
 en CH_2Cl_2 (20 mL), se le agregó cloruro de 4-metilbenzoilo (316
 mg, 2.2 mmoles) y Et_3N (454 mg, 4.5 mmoles) a una
 temperatura de 0°C. La mezcla se agitó a temperatura ambiente
 30 durante 3 horas. La mezcla de reacción se diluyó con CH_2Cl_2
 (30 mL), se lavó con una solución de cloruro de sodio acuosa

saturada (NaCl acuoso saturado) (1 x 15 mL), se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró *in vacuo*. El sólido crudo se purificó mediante cromatografía de fase inversa para proporcionar *N*-(5-fluoro-1-(4-metilbenzoil)-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-

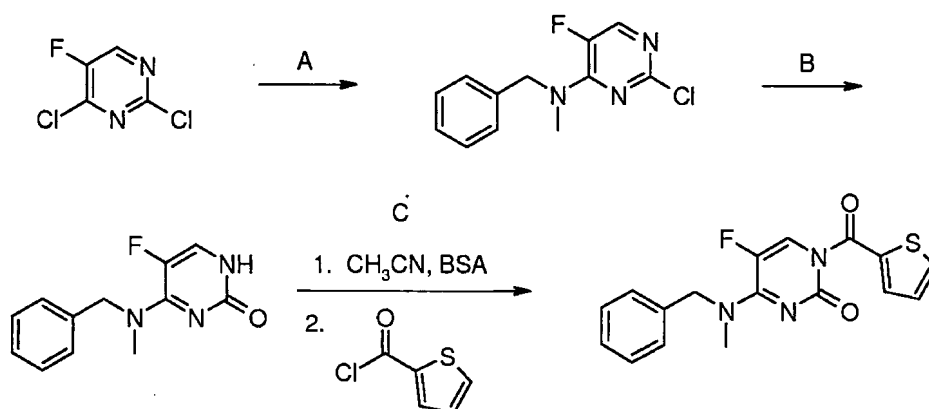
il)acetamida en la forma de un sólido color blanco (16 mg, 3%):
 pf 146.9-148.2°C; ^1H RMN (acetona- d_6) δ 9.75 (s, 1H), 8.64 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.44 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.32 (s, 3H).

Los compuestos 22 a 24 en la tabla I se prepararon de acuerdo con el Ejemplo 5.

Ejemplo 6: Preparación de 4-(bencilo(metil)amino)-5-fluoro-1-(tiofeno-2-carbonil)pirimidin-2(1H)-ona (25)

15

20



A) A una suspensión de 2,4-dicloro-5-fluoropirimidina
 25 (0.30 g, 1.80 mmoles) en dioxano (3.6 mL) se le agregaron *N*-etil-*N*-isopropilpropan-2-amina (0.23 g, 1.80 mmoles) y *N*-metil-1-fenilmethanamina (0.24 g, 1.98 mmoles), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La reacción se diluyó con EtOAc (15 mL), y la solución resultante
 30 se lavó con H_2O (2 x 5 mL). La fase orgánica se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y concentró hasta obtener un aceite color

amarillo claro el cual se purificó mediante cromatografía de fase normal (40 g SiO₂; gradiente, EtOAc/Hexanos) para proporcionar un aceite incoloro el cual se solidificó al momento del enfriamiento. El sólido se secó bajo alto vacío a una temperatura de 23°C durante 16 horas para proporcionar *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (0.34 g, 76%) en la forma de un sólido color blanco: pf 47-49°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8.18 (d, J = 6.4, 1H), 7.43-7.23 (m, 5H), 4.82 (s, 2H), 3.17 (d, J = 3.3, 3H); EIMS *m/z* 251 (M)⁺

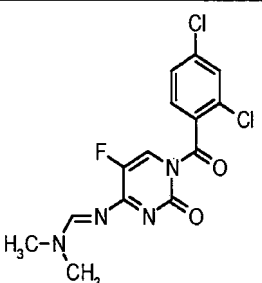
10 B) A una suspensión de *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (7.5 g, 27.1 mmoles) en dioxano/H₂O (1:1, 186 mL volumen total) se le agregó hidróxido de potasio (KOH; 1.7 g, 27.1 mmoles). La mezcla se templó a una temperatura de 100°C y se agitó durante 72 horas. La mezcla
15 de reacción se diluyó con H₂O (50 mL) y el pH se ajustó a 7 con 2 N HCl. El precipitado color blanco resultante se recolectó mediante filtración al vacío, aunque la mayoría del producto permaneció en la fase acuosa. El sólido y el filtrado se combinaron y el solvente se eliminó mediante destilado
20 azeotrópico con CH₃CN *in vacuo*. El residuo se disolvió/suspendió en CH₂Cl₂ (25 mL), se adsorbió sobre Celite (3.0 g) y se purificó mediante cromatografía instantánea (24 g SiO₂; gradiente, MeOH/CH₂Cl₂) para proporcionar 4-(bencilmetilamino)-5-fluoropirimidin-2-ol (4.4 g, 45%) en la
25 forma de un sólido color blanco: pf 122.8-123.6°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 12.72 (s, 1H), 7.42-7.14 (m, 6H), 4.88 (s, 2H), 3.20 (d, J = 3.2, 3H); ESIMS *m/z* 235 (M+2)⁺, 232 (M-H)⁻.

C) A un frasco de fondo redondo cargado con 4-(bencilo(metil)amino)-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona (250 mg, 1.06
30 mmoles) en CH₂Cl₂ (11 mL) y cloruro de carbonilo de 2-tiofeno (172 mg, 1.1 mmoles, 1.1 eq) se le agregó Et₃N (237 mg, 2.35

mmoles) a una temperatura de 0°C bajo N₂. La mezcla de reacción se templó a temperatura ambiente al término de la adición, y se agitó durante 12 horas. La mezcla de reacción se diluyó con CH₂Cl₂ (25 mL), se lavó con una solución NaCl acuosa saturada (10 mL), se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó hasta secarse *in vacuo* a temperatura ambiente. El producto crudo se purificó mediante cromatografía de fase inversa para proporcionar el producto en la forma de un sólido color blanco (23 mg, 6%): pf 101.3-102.4°C; ¹H RMN (metanol-*d*₄) δ 8.10 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.38-7.20 (m, 6H), 4.88 (s, 2H), 3.22 (d, J = 3.2 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 344 ([M+H]⁺).

Los compuestos 26 y 27 en la tabla I, se prepararon de acuerdo con el Ejemplo 6.

TABLA I: Compuestos y Datos de Caracterización Relacionados

Cmpd	Estructura	SM	pf (°C)	Apariencia	¹ H RMN ² (δ, solvente)
4		ESIMS ⁺ 357		aceite incoloro	(CDCl ₃) 8.85 (s, 1H), 8.04 (d, J = 5.06 Hz, 1H), 7.43-7.30 (m, 3H), 3.26 (s, 3H), 3.25 (s, 3H)

5

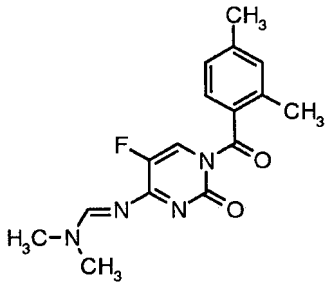
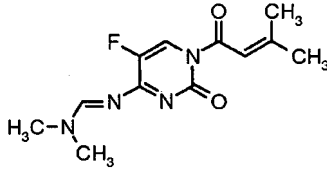
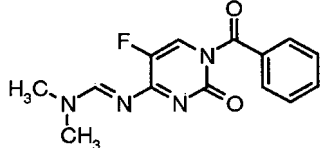
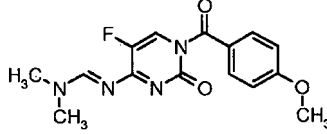
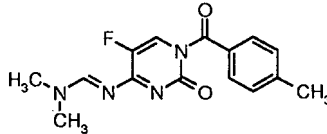
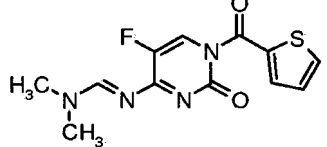
10

15

20

25

30

Cmpd	Estructura	SM	pf (°C)	Apariencia	¹ H RMN ² (δ, solvente)
5		ESIMS ⁺ 317		sólido pegajoso blanco	(CDCl ₃) 8.80 (s, 1H), 7.90 (d, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.97 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.31 (s, 3H)
6		ESIMS 289 (M+Na)	128– 130		(CDCl ₃) 8.85 (s, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 6.85 (br s, 1H), 3.24 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)
7		ESIMS <i>m/z</i> 289 ([M+H] ⁺)	137.3– 139.2	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.68 (s, 1H), 8.44 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.11 (dd, <i>J</i> = 8.3, 1.2 Hz, 2H), 7.83-7.75 (m, 1H), 7.63 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 3.20 (s, 3H), 3.11 (s, 3H)
8		ESIMS <i>m/z</i> 319 ([M+H] ⁺)	126.2– 128.3	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.67 (s, 1H), 8.42 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.09-8.03 (m, 2H), 7.19-7.09 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.11 (s, 3H)
9		ESIMS <i>m/z</i> 303 ([M+H] ⁺)	128.8– 130.5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.67 (s, 1H), 8.43 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 2H), 7.43 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 2.43 (s, 3H)
10		ESIMS <i>m/z</i> 295 ([M+H] ⁺)	154.8– 156.5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.68 (s, 1H), 8.43 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.14 (dd, <i>J</i> = 4.9, 1.2 Hz, 1H), 8.03 (dd, <i>J</i> = 3.8, 1.3 Hz, 1H), 7.33 (dd, <i>J</i> = 4.9, 3.8 Hz, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.11 (s, 3H)

5

10

15

20

25

Cmpd	Estructura	SM	pf (°C)	Apariencia	¹ H RMN ² (δ, solvente)
11		ESIMS <i>m/z</i> 325 ([M+H] ⁺)	130– 132	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.67 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.18–8.09 (m, 1H), 8.05–7.96 (m, 1H), 7.77–7.65 (m, 1H), 3.20 (s, 3H), 3.11 (s, 3H)
12		ESIMS <i>m/z</i> 323 ([M+H] ⁺)	95.3– 97.7	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.71 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 1H), 8.10 (dd, <i>J</i> = 4.4, 2.6 Hz, 2H), 7.94–7.86 (m, 1H), 7.68 (dd, <i>J</i> = 26.4, 18.3 Hz, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.14 (s, 3H)
14		ESIMS <i>m/z</i> 234 ([M+H] ⁺), 232 ([M-H] ⁻)	213.2– 215.3	sólido blanco	(metanol- <i>d</i> ₄) 8.04–7.97 (m, 2H), 7.90 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 7.64–7.52 (m, 1H), 7.51 – 7.40 (m, 2H)
15		ESIMS <i>m/z</i> 262 ([M-H] ⁻)	257.9– 259.6	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.28 (s, 1H), 8.08 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.74 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 7.03 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 2H), 3.85 (s, 3H)
16		ESIMS <i>m/z</i> 252 ([M+H] ⁺), 250 ([M-H] ⁻)	228.3– 229.7	sólido blanco	(metanol - <i>d</i> ₄) 7.90 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz, 1H), 7.80 (m, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 7.67 (d, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 7.60–7.49 (m, 1H), 7.34–7.04 (m, 3H)
17		ESIMS <i>m/z</i> 248 ([M+H] ⁺), 246 ([M-H] ⁻)	257– 259.5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.34 (s, 1H), 8.19–8.01 (m, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 2H), 7.30 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 2.38 (s, 3H)
18		ESIMS <i>m/z</i> 294 ([M+H] ⁺), 292 ([M-H] ⁻)	170– 172	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.35 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.11 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 7.39 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.05 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.80 (s, 3H)

5

10

15

20

25

Cmpd	Estructura	SM	pf (°C)	Apariencia	¹ H RMN ² (δ, solvente)
19		ESIMS m/z 240 ([M+H] ⁺), 238 ([M-H] ⁻)	223.1– 225.2	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.39 (dd, <i>J</i> = 2.9, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.08 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 5.1, 3.0 Hz, 1H), 7.42-7.35 (m, 1H)
20		ESIMS m/z 270 ([M+H] ⁺), 268 ([M-H] ⁻)	150– 152	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8.48 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.12 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 7.87 (ddd, <i>J</i> = 10.9, 7.7, 2.1 Hz, 1H), 7.66- 7.51 (m, 2H)
22		ESIMS m/z 276 ([M+H] ⁺), 274 ([M-H] ⁻)	122.8– 123.6	sólido blanco	(CDCl ₃) 8.43 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 1H), 8.20 (dd, <i>J</i> = 8.4, 1.3 Hz, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.67 (dd, <i>J</i> = 10.5, 4.4 Hz, 1H), 7.53 (dd, <i>J</i> = 9.8, 5.8 Hz, 2H), 2.57 (s, 3H)
23		ESIMS m/z 310 ([M+H] ⁺)	129.5– 131	sólido blancuzco	(acetona- <i>d</i> ₆) 9.78 (s, 1H), 8.65 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H), 8.20- 8.07 (m, 1H), 7.89- 7.79 (m, 1H), 7.70- 7.64 (m, 1H), 7.58- 7.44 (m, 1H), 2.32 (s, 3H)
24		ESIMS m/z 282 ([M+H] ⁺)		goma amarilla	(acetona- <i>d</i> ₆) 9.78 (s, 1H), 8.64 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H), 8.09- 8.02 (m, 2H), 7.37- 7.30 (m, 1H), 2.32 (s, 3H)
26		ESIMS m/z 374 ([M+H] ⁺)		líquido café	(acetona- <i>d</i> ₆) 8.16 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 8.08-8.01 (m, 2H), 7.58 (dt, <i>J</i> = 9.9, 7.9 Hz, 1H), 7.40- 7.32 (m, 5H), 4.91 (s, 2H), 3.24 (d, <i>J</i> = 3.4 Hz, 3H)
27		ESIMS m/z 368 ([M+H] ⁺)		líquido	(acetona- <i>d</i> ₆) 8.14 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 8.12-8.08 (m, 2H), 7.38-7.34 (m, 5H), 7.13-7.09 (m, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.83 (s, 3H)

Ejemplo 5: Evaluación de Actividad Fungicida: enfermedad
fúngica foliar en trigo (*Mycosphaerella graminicola*; anamorfa:
Septoria tritici; código Bayer SEPTTR)

Se crecieron plantas de trigo (variedad Yuma) desde
semillas en un invernadero en una mezcla de tierra mineral
50%/metro-tierra 50% hasta que la primera hoja se sumergió

completamente, con 7 a 10 sembradíos por tarro. Estas plantas se inocularon con una suspensión de esporas acuosas de *Septoria tritici*, ya sea antes o después de los tratamientos fungicidas. Después de la inoculación, las plantas se mantuvieron en una humedad relativa al 100% (un día en una cámara de oscuridad con rocío seguido de dos a tres días en una cámara con luz con rocío) para permitir que las esporas germinaran e infectaron la hoja. Posteriormente las plantas se transfirieron a un invernadero para que se desarrollara la enfermedad.

La siguiente tabla presenta la actividad de los compuestos típicos de la presente descripción, cuando se evalúan en estos experimentos. La efectividad de los compuestos de prueba para controlar la enfermedad, fue determinada evaluando la severidad de la enfermedad en las plantas tratadas, convirtiendo posteriormente la severidad en un porcentaje de control con base en el nivel de enfermedad en las plantas inoculadas, no tratadas.

En cada caso de la Tabla II, la escala de rangos como se indica a continuación:

% de Control de Enfermedad	Rango
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
No probado	E

TABLA II: Protección un Día (1DP) y Tres Días de Actividad Curativa (3DC) de los Compuestos en SEPTTR en 100 ppm

5

10

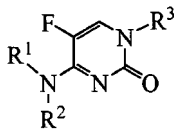
15

20

Compuesto	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
1	A	A
2	A	A
3	B	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	E	E
13	A	A
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A
21	E	E
22	E	E
23	E	E
24	E	E
25	E	E
26	E	E
27	E	E

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I:



Fórmula I

en donde R¹ es:

H;

C₁-C₆ alquilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

C₁-C₆ alquenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

10 C₃-C₆ alquinilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁴;

fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵, o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contiene cada uno 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

20 -C(=S)R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o

25 -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

-C(=S)R⁸;

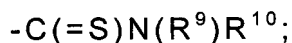
-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-S(O)₂R⁸;

30 -(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o



en donde m es un entero de 1 a 3;

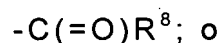
R^2 es:

H; o

5 C_1-C_6 alquilo opcionalmente sustituido con R^4 ;

como alternativa R^1 y R^2 se pueden tomar juntos para formar $=CR^{11}N(R^{12})R^{13}$;

R^3 :



R^4 es independientemente halógeno, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_4 haloalquilo, C_1-C_4 alcoxi, C_1-C_4 haloalcoxi, C_1-C_4 alquiltio, C_1-C_4 haloalquiltio, amino, halotio, C_1-C_3 alquilamino, C_2-C_6 alcoxycarbonilo, C_2-C_6 alquilcarbonilo, C_2-C_6 alquilaminocarbonilo, hidroxilo, o C_3-C_6 trialquilsililo;

R^5 es independientemente halógeno, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, C_1-C_6 alquiltio, C_1-C_6 haloalquiltio, halotio, amino, C_1-C_6 alquilamino, C_2-C_6 dialquilamino, C_2-C_6 alcoxycarbonilo, o C_2-C_6 alquilcarbonilo, 20 nitro, hidroxilo, o ciano;

R^6 es H, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 alcoxi, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R^5 ;

R^7 es H, C_1-C_6 alquilo, C_2-C_6 alquenilo, C_3-C_6 alquinilo, 25 C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxialquilo, C_2-C_6 alquilcarbonilo, fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R^5 , o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6 o con un sistema de anillo 30 fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3

R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5

R^8 es H, C_1-C_6 alquilo, C_2-C_6 alquenilo, C_3-C_6 alquinilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxialquilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente
5 sustituidos con 1 a 3 R^5 , o con un sistema de anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 , bifenilo o
10 naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 ;

R^9 es H, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxialquilo, C_2-C_6 alquilcarbonilo, fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R^5 , o con un sistema de anillo saturado o
15 insaturado de 5 ó 6 miembros, o con un sistema de anillo fusionado 5-6, o con un sistema de anillo fusionado 6-6, que contienen cada uno 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5

20 R^{10} es H, C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoxialquilo, C_2-C_6 alquilcarbonilo, bencilo, en donde el bencilo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 ;

como alternativa R^9 y R^{10} se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que
25 contiene 1 a 3 heteroátomos, en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 ;

R^{11} es H o C_1-C_4 alquilo;

R^{12} es H, ciano, hidroxilo, C_1-C_4 alquilo, C_1-C_6 alcoxi, C_2-C_6 , alquilcarbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno de
30 fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R^5 ;

como alternativa R^{11} y R^{12} se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que contienen 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 ;

5 R^{13} es H, C_1-C_4 alquilo, C_1-C_6 alcoxi, C_2-C_6 , alquilcarbonilo, fenilo o bencilo en donde cada uno de fenilo o bencilo pueden ser opcionalmente sustituidos con 1 a 3 R^5 ; y

como alternativa R^{12} y R^{13} se pueden tomar juntos para formar un anillo saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros que
10 contiene 1 a 3 heteroátomos en donde cada anillo puede ser opcionalmente sustituido con 1 a 3 R^5 .

2. Una composición para el control de un patógeno fúngico, caracterizada porque incluye el compuesto tal como se describe en la reivindicación 1 y un material transportador
15 fisiológicamente aceptable.

3. La composición tal como se describe en la reivindicación 2, caracterizada porque el patógeno fúngico es es roña de manzano (*Venturia inaequalis*), enfermedad fúngica foliar en trigo (*Septoria tritici*, también conocido como
20 *Mycosphaerella graminicola*), y Manchas de Cercospora en hoja de remolacha (*Cercospora beticola*), manchas de hoja de cacahuate (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*) y Sigatoka Negra de Plátano (*Mycosphaerella fijiensis*).

25 4. Un método para el control y prevención de ataque fúngico en una planta, en donde el método incluye los pasos de:
aplicar una cantidad fungicidamente efectiva de al menos uno de los compuestos tal como se describe en la reivindicación 1, al menos la planta, un área adyacente a la planta, tierra adaptada
30 para soportar el crecimiento de la planta, la raíz de una planta, follaje de la planta y una semilla adaptada para producir la planta.

RESUMEN

La presente descripción se refiere al campo de las *N1*-acil-5-fluoropirimidinonas y sus derivados, y al uso de estos compuestos como fungicidas.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 10/44576

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(8) - C07D 339/02 (2010.01) USPC - 544/322 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC												
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) USPC: 544/322 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched USPC: 544/243, 320, 319, 321, 316, 334 (text search) Find search terms below. Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) PubWEST (PGPB,USPT,EPAB,JPAB), Google Scholar, Patentscope pyrimidinone, pyrimidin-2-one, N-acylpyrimidinone, N-benzoylpyrimidinone, N-acetylpyrimidinone, N-acylpyrimidin-2-one, N-benzoylpyrimidin-2-one, N-acetylpyrimidin-2-one, fungicid\$, antifungal, anti-fungal, N-acylcytosine, N-acetylcytosine, N-benzoylcytosine												
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT												
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.										
Y	US 3,368,938 A (BERGER et al.) 13 February 1968 (13.02.1968) col 1, ln 16-20; col 4, ln 34-38.	1-4										
Y	WO 97/33890 A1 (WALTER) 18 September 1997 (18.09.1997) pg 1, para 1 to pg 2, para 3; pg 51, para 4 to pg 52, para 1.	1-4										
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐												
* Special categories of cited documents: <table><tr><td>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</td><td>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</td></tr><tr><td>"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date</td><td>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone</td></tr><tr><td>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</td><td>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</td></tr><tr><td>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</td><td>"&" document member of the same patent family</td></tr><tr><td>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</td><td></td></tr></table>			"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention	"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone	"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art	"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family	"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention											
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone											
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art											
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family											
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed												
Date of the actual completion of the international search 14 September 2010 (14.09.2010)		Date of mailing of the international search report 23 SEP 2010										
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. 571-273-3201		Authorized officer: Lee W. Young PCT Helpdesk: 571-272-4300 PCT OSP: 571-272-7774										

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT		
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 339/002		
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) DOW AGROSCIENCES LLC		
(30) Prioridad	(31) Prioridad 61/232,223	(32) Fecha 07/08/2009	(33) País US	
		(72) Inventor(es) TIMOTHY BOEBEL Y OTROS		
		(74) Apoderado: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ		
(85)	Fecha limite inicio fase nacional: 07/03/2012		(87)	Publicación internacional
(86)	Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT			Fecha: 10/02/2011
	Fecha de presentación de la solicitud: 05/08/2010			N° publicación: WO 2011/017538
	No. de solicitud PCT/US2010/044576			
(54) Título: DERIVADOS DE N1-ACIL-5-FLUOROPIRIMIDINONA				

Resumen:

La presente descripción se refiere al campo de las N1-acil-5-fluoropirimidinonas y sus derivados, y al uso de estos compuestos como fungicidas.

66

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO NIT : 800.176.089-2 - / -					
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA			No. 12 - 008232	
				Bogotá D.C., Enero 27 de 2012 - 16:00:24	
RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS				NI 860.041.367	
*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	157719693	27/01/2012	41.220.000.00
*** Conceptos Pagados ***					
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO	
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	590.000.00	590.000.00	
				\$590.000.00	
=====					
SON: **QUINIENTOS NOVENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***					
Responsable: _____					
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____					
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO					
					
No. 12-019954- -00000-0000					
Fecha: 2012-02-06 11:31:26 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR					
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL					
Act. 411 PRESENTACION Folios: 66					
Código: 10975-841-081-4.					
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia					
Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240					
Enero 27 de 2012 - 16:00:33					

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE UTILI ☐

Art 33 Decisión 486/00

☐ Indicación que se solicita una patente.

☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐ Descripción de la invención

☐ Dibujos de ser estos pertinentes

☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)

Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒ Indicación que se solicita una PCT

☒ Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)

☒ Dibujos de ser estos pertinentes

☒ Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)

Completa ☒ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐ Indicación que se solicita Diseño industrial

☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐ Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño

☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas

Completa ☐ Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐ Indicación que se solicita un esquema de trazado

☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐ Representación gráfica de un esquema de trazado

☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas

Completa ☐ Incompleta ☐