



CSA716679
Digitalización CSA Ltda.

Superintendencia de Industria y Comercio
INVENTARIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD DE

PCT

PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

09-22189

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO: FUNGICIDAS

62. CLASIFICACION INTERNACIONAL: A01N 43/42, C07D 215/18

71. SOLICITANTE: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO: Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea -
SUIZA

74. APODERADO: Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.

22. BOGOTA, D.C.,

- 4 MAR. 2009

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

**REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION
DEL TRÁMITE**

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION (X) MODELO DE UTILIDAD ()	(X)	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente	(X)	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	(X)	()
- Descripción de la invención	(X)	()
- Dibujos de ser estos pertinentes	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	(X)	()
COMPLETA (X) INCOMPLETA ()		

DISEÑO INDUSTRIAL ()

- Indicación de que se solicita el registro de 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	()	()

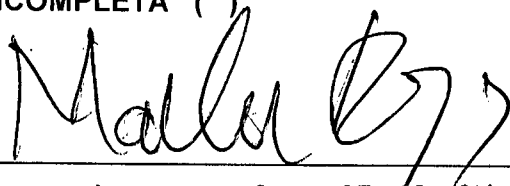
COMPLETA () INCOMPLETA ()

EZQUEMA DE TRAZADO ()

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
- Representación gráfica del Esquema de Trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()

COMPLETA () INCOMPLETA ()

Firma responsable:



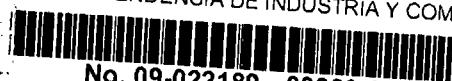
Fecha: _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-022189- -00000-0000

Fecha: 2009-03-04 15:26:16 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 205



No. 09-022189-00000-0000

Clasificación

Fecha: 2009-03-04 15:26:16 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 205

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTES
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

①

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☒ Capítulo I

☐ Capítulo II

②

SOLICITANTE (71)

Nombre: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Dirección: Schwarzwaldallee 215,
CH-4058 Basilea - SUIZA

Nacionalidad o Domicilio: Basilea - SUIZA

Lugar de Constitución: SUIZA

Teléfono: Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número Cual

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección: CALLE 94A No. 7A-09

Teléfono: 610 7420 Fax: 610 0706

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número 39'779.654 TPA 70.819

④

INVENTOR (ES) (72)

VER ANEXO No. 1

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2007/007700

Fecha 04/09/2007

Publicación Internacional No. WO 2008/028624 A1

Fecha 13/03/2008

⑥

Título (54) FUNGICIDAS (Ver folios 202-203)

⑦

Clasificación Internacional (51) A01N 43/42, C07D 215/18,

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐

GB

06/09/2006

0617574.9

⑨

Comprobante de pago No. 09-15,368 y 09-15,369

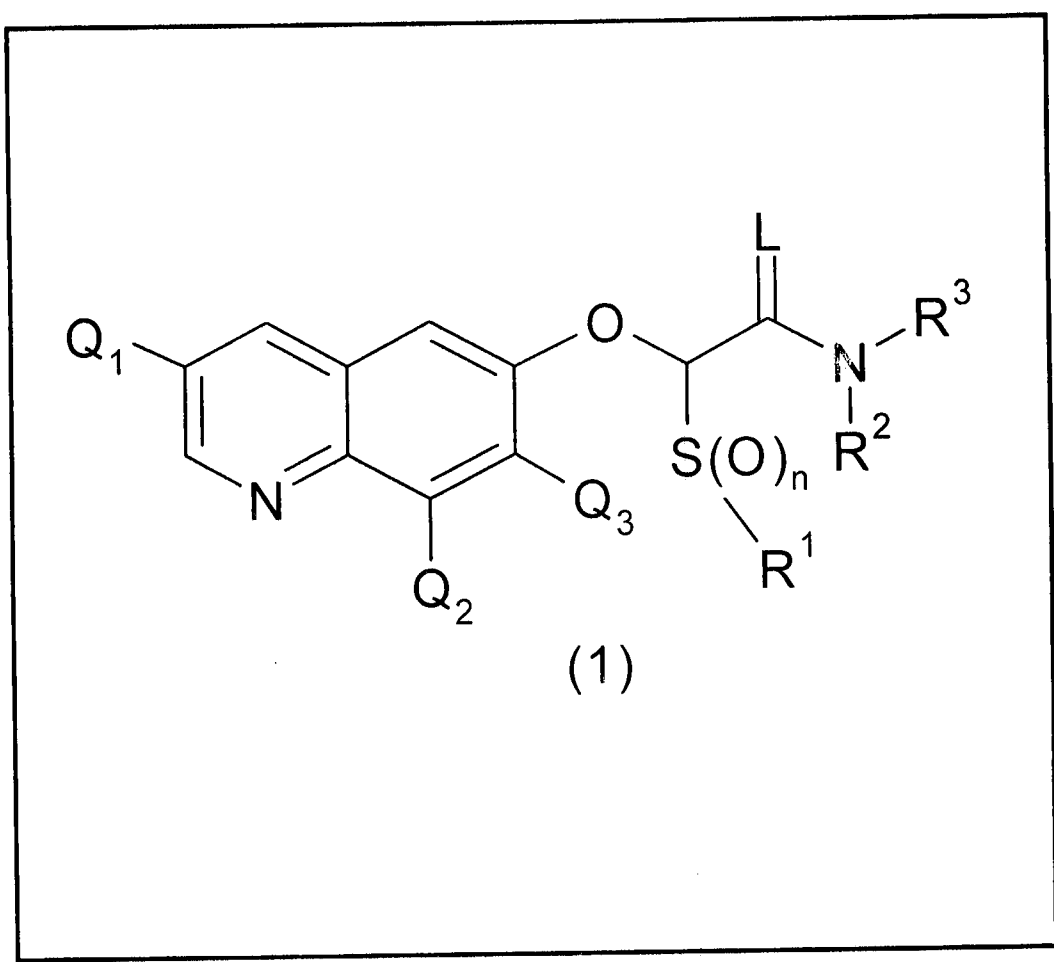
Fecha Febrero 25 de 2009

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

10 Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 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.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros: Tarjeta Propietario y Extracto para la publicación

11 FIGURA CARACTERISTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA: *Margarita Castellanos*

C.C. No. 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

- 4 MAR. 2009

CASTELLANOS & CO LTDA

A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1
INVENTORES

1. **FIONA MURPHY KESSABI**
Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basilea, SUIZA
2. **RENAUD BEAUDEGNIES**
Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basilea, SUIZA
3. **LAURA QUARANTA**
Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basilea, SUIZA
4. **HANS-GEORG BRUNNER**
Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basilea, SUIZA
5. **FREDRIK CEDERBAUM**
Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basilea, SUIZA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-022189- -00000-0000

Fecha: 2009-03-04 15:26:16 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 205

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 15,368
FECHA : FEBRERO 25 DE 2009

**** CONSIGNACION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANUS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	81241484	25/02/2009	4,645,000.00

**** CONCEPTO ****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	540,000.00
		TOTAL :	\$ 540,000.00

CON: QUINIENTOS CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-022189- -00000-0000

Fecha: 2009-03-04 15:26:16 Dep. 2020 NUECREACIONE
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 205

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 15,369
 FECHA : FEBRERO 25 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	81241484	25/02/2009	4,645,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
36	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		123 BUSQ.NAL.DISE#OS INDUSTRIALES (2	900,000.00
		TOTAL :	\$ 900,000.00

SON: NOVECIENTOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

6

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E. S. D.

Ref.: **PODER** conferido por la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente manifiesto a Uds. que sustituyo en la Dra. **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, con domicilio en **Schwarzwaldalle 215, CH-4058 Basilea, SUIZA**, debidamente legalizado por Apostilla, bajo el No. **8117** el día **1° de Abril de 2004**, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, en Colombia, para: **"FUNGICIDAS"**.

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C.C. No. **39.773.330** de Usaquén
T.P.A. No. **58.236** del C.S.J.
Carrera 9 No. 93-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480

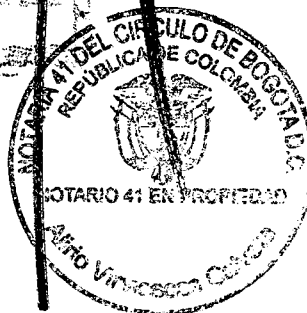

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. **39.779.654** de Usaquén
T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.
Carrera 9 No. 93-09 – Bogotá, D.C.
Teléfonos: 6107420 – 6107480

Bogotá, D.C.
XCA/MCA/P1716

NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA
REPÚBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: [Redacted] y tarjeta identificada (o) con: 39.272.300 y tarjeta profesional de abogado No. 582316 del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.
(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2282/89 mod. 36)

Bogotá D.C. 25 FEB. 2009
[Signature]
FIDELIA G. GONZALEZ



NOTARIA 41 DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ D.C.
DEPARTAMENTO DE CUNDINAMARCA
REPÚBLICA DE COLOMBIA

El Notario 41 del círculo de Bogotá, da fe de que compareció personalmente: [Redacted] y tarjeta identificada (o) con: 39.272.652 y tarjeta profesional de abogado No. 582316 del Consejo Superior de la Judicatura, quien autentica la firma puesta por ella (el) mismo en este escrito.
(Art. 84 C. P. C. Decreto. 2282/89 mod. 36)

Bogotá D.C. 25 FEB. 2009
[Signature]
FIDELIA G. GONZALEZ



PODER

El (los) Gregory W. Warren
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Nombran por el presente a **XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A.** abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso -administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fabrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Para la obtención de registros sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso - administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

en Research Triangle Park, Carolina
del Norte 27709
por Gregory W. Warren

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned Gregory W. Warren
Syngenta Participations AG

hereby grant(s) Power of Attorney to **XIMENA CASTELLANOS A. and/or MARGARITA CASTELLANOS A.** attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09, Bogota- Colombia, to prosecute

and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons, specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of trade names and ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights; b) For the obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights; actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court.

Given and signed this 24th March 2004

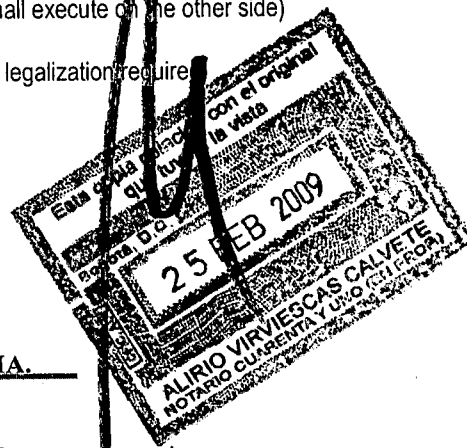
in Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren

Gregory W. Warren

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization requires)



ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

XC/cm

COLOMBIA

CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 24 de Marzo del año 2004

compareció (eron) personalmente Gregory W. Warren a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en representación de la Sociedad (Compañía denominada Certifico: Syngenta Participations AG

- a) Que es una sociedad/Compañía legalmente constituida y existente de acuerdo con las leyes de
- b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza
- c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el presente poder están comprendidos dentro del objeto social de la mencionada Sociedad /Compañía.
- d) Que el Sr. Gregory W. Warren esta autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior esta probado por medio de los siguientes documentos, que certifico he visto*

(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C. HAYES

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.



ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

NOTARIAL (Corporation)

On this 24th day of March of 2004 personally appeared Gregory W. Warren whom I know to be the person(s) who signed this document as representative(s) of the Corporation /Company named Syngenta Participations AG

I certify:

- a) That Syngenta Participations AG is a corporation (Company legally constituted and in existence in accordance with the laws of Basel, Switzerland
- b) That the domicile of said Corporation/Company is Basel, Switzerland
- c) That the purpose or purposes for which the present Power of Attorney is granted are comprised within the object set forth in the charter of the mentioned Corporation/Company.
- d) That Mr. Gregory W. Warren is (are) authorized to grant the present Power of Attorney. The aforementioned was duly proven through the following documents and I duly certify having seen them*: on the 24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North Carolina 27709.

(City) Research Triangle Park

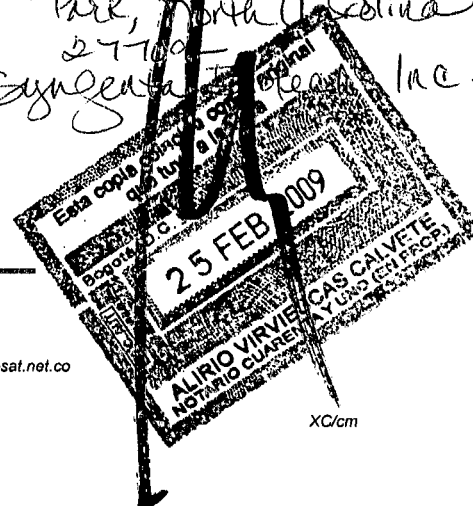
(State) North Carolina, 27709

this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public) *Laneisha C. Hayes*

*Documents must be identified with date and origin

3/24/04 - Research Triangle Park, North Carolina 27709 - Syngenta Participations AG



XC/cm



Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

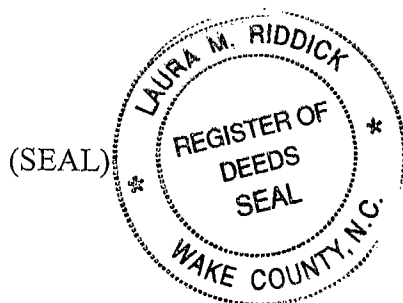
STATE OF NORTH CAROLINA

WAKE COUNTY

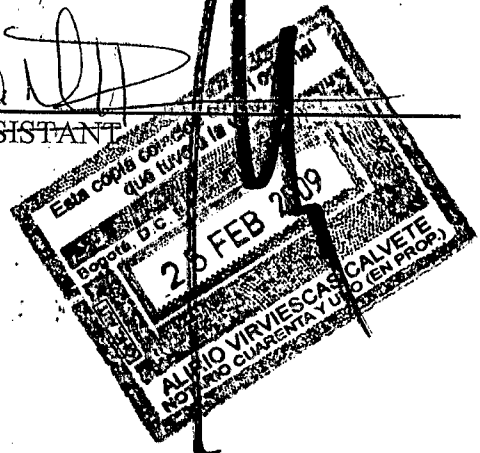
**CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT
NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY
AT TIME OF SIGNATURE**

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Laneisha C. Hayes WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS; AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING.

IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.



Laura M. Riddick
REGISTER OF DEEDS
Carla [Signature]
DEPUTY / ASSISTANT

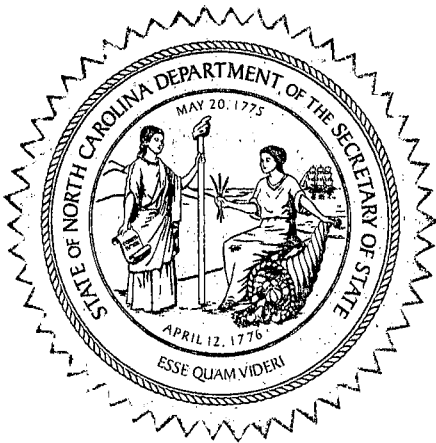


APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document
has been signed by CARLA N. BROWN
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 8117
9. Seal/Stamp:
10. Signature



Robyn S. M...

-----TRADUCCION OFICIAL No. -040417-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación
lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res. 2755/68 y
01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta

Participations AG)

(fdo) illegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado
antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C.
Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Público
debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake,
Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dars plena fe y crédito a
sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia
letra.

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sell
hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) illegible



Delegado

APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

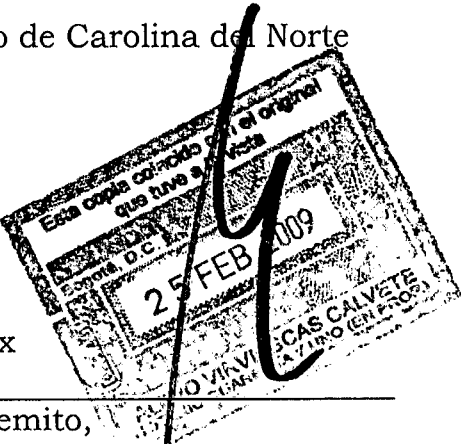
- 1. País: Estados Unidos de América
 - 2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN
 - 3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras
 - 4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras
- Condado de Wake, Carolina del Norte

CERTIFICADO

- 5. En Raleigh. Carolina del Norte
- 6. el día 1 de Abril de 2004
- 7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
- 8. No. 8117
- 9. Sello: (sello en oblea ocre)

10. Firma

(fdo) Rodney S. Maddox



ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
13 March 2008 (13.03.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/028624 A1

(51) International Patent Classification:

A01N 43/42 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)
C07D 215/18 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)

Basel (CH). CEDERBAUM, Fredrik [SE/—]; Syngenta
Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058
Basel (CH).

(21) International Application Number:

PCT/EP2007/007700

(22) International Filing Date:

4 September 2007 (04.09.2007)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

0617574.9 6 September 2006 (06.09.2006) GB

(71) Applicant (for all designated States except US): SYN-
GENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH]; Schwarzwald-
allee 215, CH-4058 Basel (CH).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MURPHY
KESSABI, Fiona [IE/CH]; Syngenta Crop Protec-
tion AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).
BEAUDEGNIES, Renaud [BE/CH]; Syngenta Crop
Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel
(CH). QUARANTA, Laura [IT/CH]; Syngenta Crop
Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel
(CH). BRUNNER, Hans-Georg [CH/CH]; Syngenta
Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058

(74) Common Representative: SYNGENTA PARTICIPA-
TIONS AG; Intellectual Property, P.O. Box, CH-4002
Basel (CH).

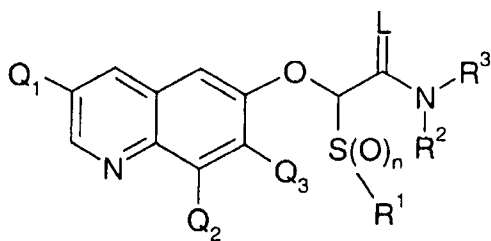
(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG,
ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, 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, PG, PH, PL,
PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA,
ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments

(54) Title: FUNGICIDES



(1)

(57) Abstract: Compounds of the
general formula wherein the substituents
are as defined in claim (1), are useful
as fungicides.

WO 2008/028624 A1

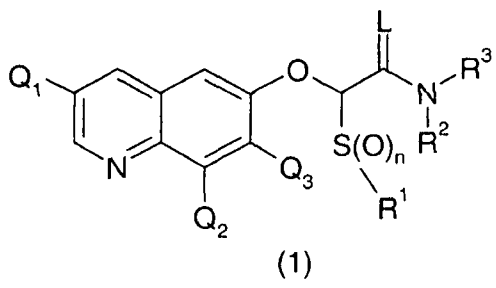
FUNGICIDES

This invention relates to novel quinolinylalkoxyalkanoic acid amides, processes for preparing them, to compositions containing them and to methods of using them to combat fungi, especially fungal infections of plants.

Certain quinolinylalkoxyalkanoic acid amide derivatives and their use as agricultural and horticultural bactericides are disclosed, for example, in WO 04/047538 and JP 2001-89453.

The present invention is concerned with the provision of particular substituted quinoline-6-yloxyalkanoic acid amides for use mainly as plant fungicides.

Thus according to the present invention there is provided a compound of the general formula I



wherein

Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are halogen, cyano, nitro, azido, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, optionally substituted C₃₋₆ - heterocyclyl, which contains at least one heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR⁰, where R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynyl, optionally substituted C₁₋₆ alkoxy, optionally substituted C₂₋₆ alkenyloxy, optionally substituted C₂₋₆ alkynyloxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted aryl(C₁₋₆)alkyl, optionally substituted aryl(C₁₋₆)alkoxy, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroaryl(C₁₋₆)alkyl, optionally substituted heteroaryl(C₁₋₆)alkoxy, -SF₅ or -S(O)_u(C₁₋₆)alkyl, wherein u is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

- Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are -CONR^uR^v, -COR^u, -CO₂R^u, -CR^u=NR^v, -NR^uR^v, -NR^uCOR^v, -NR^uCO₂R^v, -SO₂NR^uR^v or -NR^uSO₂R^w, wherein R^w is optionally substituted C₁₋₆ alkyl and R^u and R^v, independently of each other, are hydrogen or C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of -CONR^uR^v or -SO₂NR^uR^v, R^uR^v may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, or, in the case of -CR^u=NR^v, R^v is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy, optionally substituted aryloxy or optionally substituted heteroaryloxy, or
- Q¹ and Q², independently of each other, additionally denote hydrogen, R¹ is optionally substituted C₁₋₄ alkyl, optionally substituted C₂₋₄ alkenyl, optionally substituted C₂₋₄ alkynyl or optionally substituted C₃₋₄ cycloalkyl, R² is hydrogen, C₁₋₈ alkyl, C₃₋₄ cycloalkyl, C₂₋₈ alkenyl, cyano, hydroxy, alkoxy, cyano(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkoxy(C₁₋₄)alkyl or benzyloxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the phenyl ring is optionally substituted with C₁₋₄ alkoxy, R³ is -(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR⁴, wherein R^a, R^b, R^c, R^d, R^e and R^f, independently of each other, are hydrogen, C₁₋₄ alkyl, halogen, cyano, hydroxy, C₁₋₄ alkoxy or C₁₋₄ alkoxycarbonyl, or R^aR^b, R^cR^d or R^eR^f may join to form a 3 to 8 membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR^o, wherein R^o is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, X is (CO), (CO)O, O(CO), O, S(O)_t, wherein t is 0, 1 or 2, or X is NH or N(C₁₋₆)alkyl, p, r and s, independently of each other, are 0 or 1, q is 0, 1 or 2,
- R⁴ is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, -CR^{uu}=NR^{vv}, wherein R^{uu} is hydrogen or C₁₋₆ alkyl and R^{vv} is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy, optionally substituted aryloxy or optionally substituted heteroaryloxy, or -CH₂-C≡C-R⁵, wherein R⁵ is hydrogen, C₁₋₈ alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)-alkylaminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or R⁵ is C₃₋₆ cycloalkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy-(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)alkylaminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or R⁵ is C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl and/or cycloalkyl moiety is optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkyl-

carbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)alkylaminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or

R⁵ is optionally substituted aryl, optionally substituted aryl(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted aryloxy(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted heteroaryl(C₁₋₄)alkyl or optionally substituted heteroaryloxy(C₁₋₄)alkyl, or

R⁴ is optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, optionally substituted C₅₋₆ cycloalkenyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or an optionally substituted 5- to 8-membered ring optionally containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen or NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, or

10 when R³ is -(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR⁴, R² and R³ may join to form a 5- or 6-membered ring optionally substituted with halogen, C₁₋₄ alkyl, mono- or di-(C₁₋₄)alkylaminocarbonyl, and optionally containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen and NR⁰⁰, wherein R⁰⁰ is C₁₋₄ alkyl optionally substituted with halogen, C₁₋₆ alkoxy or cyano, or R⁰⁰ is phenyl optionally substituted with nitro, C₁₋₄ alkyl, halo(C₁₋₄)-alkyl, C₁₋₄ alkylcarbonyl or heteroaryl, or R² and R³ may join to form an optionally substituted 6,6-membered bicycle,

R³ is -(CR³⁰R⁴⁰)C≡CR⁵⁰, wherein

R³⁰ and R⁴⁰, independently of each other, are hydrogen, C₁₋₆ alkyl, halo(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₃)alkyl, C₂₋₃ alkenyl or C₂₋₃ alkynyl, or

20 R³⁰ and R⁴⁰ join with the carbon atom to which they are attached to form a 3 to 6 membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen or NR⁰⁰⁰, wherein R⁰⁰⁰ is hydrogen or C₁₋₄ alkyl, where the carbocyclic or heterocyclic ring is optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkyl,

25 R⁵⁰ is hydrogen, optionally substituted C₁₋₄ alkyl, optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR⁰⁰⁰, wherein R⁰⁰⁰ is hydrogen or C₁₋₆alkyl,

L is sulfur or oxygen, and

n is 0, 1 or 2, and

salts and N-oxides of the compounds of the formula I.

30

The compounds of the invention contain at least one asymmetric carbon atom and may exist as enantiomers (or as pairs of diastereoisomers) or as mixtures of such. Further, when n is 1, the compounds of the invention are sulfoxides, which can exist in two enantiomeric forms, and the adjacent carbon can also exist in two enantiomeric forms.

35 Compounds of general formula (I) can therefore exist as racemates, diastereoisomers, or single enantiomers, and the invention includes all possible isomers or isomer

17
mixtures in all proportions. It is to be expected that for any given compound, one isomer may be more fungicidally active than another.

N-oxides of the compounds of the formula I preferably denote the N-oxides formed by
5 the quinoline moiety.

The salts which the compounds of the formula I can form are preferably those formed by interaction of these compounds with acids. The term "acid" comprises mineral acids such as hydrogen halides, sulphuric acid, phosphoric acid etc. as well as organic acids,
10 preferably the commonly used alkanolic acids, for example formic acid, acetic acid and propionic acid.

Except where otherwise stated, alkyl groups and alkyl moieties of alkoxy, alkylthio, etc., suitably contain from 1 to 6, typically from 1 to 4, carbon atoms in the form of straight or
15 branched chains. Examples are methyl, ethyl, *n*- and *iso*-propyl and *n*-, *sec*-, *iso*- and *tert*-butyl. Where alkyl moieties contain 5 or 6 carbon atoms, examples are *n*-pentyl and *n*-hexyl. Examples of suitable optional substituents of alkyl groups and moieties include halo, hydroxy, C₁₋₄ alkoxy and C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkoxy, cyano, optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl. Where the optional substituent is halo, the
20 haloalkyl group or moiety is typically monochloromethyl, monofluoromethyl, dichloromethyl, difluoromethyl, trichloromethyl or trifluoromethyl.

Except where otherwise stated, alkenyl and alkynyl moieties also suitably contain from 2 to 6, typically from 2 to 4, carbon atoms in the form of straight or branched chains.
25 Examples are allyl, ethynyl and propargyl. Optional substituents include halo, alkoxy, optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl.

Halo includes fluoro, chloro, bromo and iodo.

30 Aryl is usually phenyl but also includes naphthyl, anthryl and phenanthryl.

Heteroaryl is typically a 5- or 6-membered aromatic ring containing one or more sulphur, oxygen or NR moieties as heteroatoms, which may be fused to one or more other aromatic or heteroaromatic rings, such as a benzene ring. Examples are thienyl,
35 furyl, pyrrolyl, isoxazolyl, oxazolyl, thiazolyl, oxadiazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, isothiazolyl, tetrazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl, triazinyl,

benzofuranyl, benzothienyl, dibenzofuranyl, dibenzothienyl, benzothiazolyl,
 benzoxazolyl, benzimidazolyl, indolyl, quinolyl, isoquinolyl, quinazolinyl and quinoxaliny
 groups and, where appropriate, N-oxides and salts thereof. Any of the aryl or heteroaryl
 values are optionally substituted. Except where otherwise stated, substituents which
 5 may be present include one or more of the following: halo, hydroxy, mercapto, C₁₋₆ alkyl
 (especially methyl and ethyl), C₂₋₆ alkenyl (especially allyl), C₂₋₆ alkynyl (especially
 propargyl), C₁₋₆ alkoxy (especially methoxy), C₂₋₆ alkenyloxy (especially allyloxy), C₂₋₆
 alkynyloxy (especially propargyloxy), halo(C₁₋₆)alkyl (especially trifluoromethyl), halo(C₁₋₆)
 10 alkoxy (especially trifluoromethoxy), -S(O)_m(C₁₋₆)alkyl wherein m is 0, 1 or 2 and the
 alkyl is optionally substituted with halo, hydroxy(C₁₋₆)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl,
 C₁₋₄alkoxy(C₁₋₄)alkoxy, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted
 aryl (especially optionally substituted phenyl), optionally substituted heteroaryl
 (especially optionally substituted pyridyl or pyrimidinyl), optionally substituted aryloxy
 (especially optionally substituted phenoxy), optionally substituted heteroaryloxy
 15 (especially optionally substituted pyridyloxy or pyrimidinyloxy), optionally substituted
 -S(O)_maryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted phenylthio), optionally
 substituted -S(O)_mheteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted
 pyridylthio or pyrimidinylthio), optionally substituted aryl(C₁₋₄)alkyl (especially optionally
 substituted benzyl, optionally substituted phenethyl and optionally substituted phenyl
 20 *n*-propyl) in which the alkyl moiety is optionally substituted with hydroxy, optionally
 substituted heteroaryl(C₁₋₄)alkyl (especially optionally substituted pyridyl- or pyrimidinyl-
 (C₁₋₄)alkyl), optionally substituted aryl(C₂₋₄)alkenyl (especially optionally substituted
 phenylethenyl), optionally substituted heteroaryl(C₂₋₄)alkenyl (especially optionally
 substituted pyridylethenyl or pyrimidinylethenyl), optionally substituted aryl(C₁₋₄)alkoxy
 25 (especially optionally substituted benzyloxy and phenethyloxy), optionally substituted
 heteroaryl(C₁₋₄)alkoxy (especially optionally substituted pyridyl(C₁₋₄)alkoxy or pyrimi-
 dinyl(C₁₋₄)alkoxy), optionally substituted aryloxy(C₁₋₄)alkyl (especially phenoxymethyl),
 optionally substituted heteroaryloxy-(C₁₋₄)alkyl (especially optionally substituted
 pyridyloxy or pyrimidinyloxy(C₁₋₄)alkyl), optionally substituted -S(O)_m(C₁₋₄)alkylaryl
 30 wherein m is 0, 1 or 2 (especially optionally substituted benzylthio and phenethylthio),
 optionally substituted -S(O)_m(C₁₋₄)alkylheteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially
 optionally substituted pyridyl(C₁₋₄)alkylthio or pyrimidinyl(C₁₋₄)alkylthio), optionally
 substituted -(C₁₋₄)alkylS(O)_maryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially phenylthiomethyl),
 optionally substituted -(C₁₋₄)alkyl S(O)_mheteroaryl wherein m is 0, 1 or 2 (especially
 35 optionally substituted pyridylthio(C₁₋₄)alkyl or pyrimidinylthio(C₁₋₄)alkyl), acyloxy,
 including C₁₋₄ alkanoyloxy (especially acetyloxy) and benzoyloxy, cyano, isocyano,

thiocyanato, isothiocyanato, nitro, NR^gR^h , $-\text{NHCOR}^g$, $-\text{NHCONR}^g\text{R}^h$, $-\text{CONR}^g\text{R}^h$, $-\text{CO}_2\text{R}^g$, $-\text{SO}_2\text{R}^i$, $-\text{OSO}_2\text{R}^i$, $-\text{COR}^g$, $-\text{CR}^g=\text{NR}^h$ or $-\text{N}=\text{CR}^g\text{R}^h$ in which R^i is C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with

5 halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy and R^g and R^h are independently hydrogen, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy.

10 Of particular interest are those compounds of the formula (I), wherein Q^2 is hydrogen, Q^1 and Q^3 are as above.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 is halogen, aryl or heteroaryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as above.

15 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 is aryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as defined above.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 is

20 heteroaryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as defined above.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 and Q^3 are halogen and Q^2 is hydrogen.

25 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein, Q^1 is aryl or heteroaryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is halogen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 and Q^2 are hydrogen and Q^3 is halogen or optionally substituted alkyl.

30 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 is halogen, Q^2 is hydrogen and Q^3 is optionally substituted alkyl.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q^1 and Q^2

35 are halogen and Q^3 is optionally substituted alkyl.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is bromo.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is iodo.

5 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is chloro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is fluoro.

10 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q³ is halogen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q³ is fluorine.

15 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is bromo, Q² is hydrogen and Q³ is fluoro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is bromo, Q² is hydrogen and Q³ is chloro.

20

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is iodo, Q² is hydrogen and Q³ is fluoro.

25 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is iodo, Q² is hydrogen and Q³ is chloro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is hydrogen, halogen, aryl or heteroaryl.

30 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R¹ is C₁₋₄ alkyl or halo(C₁₋₄)alkyl.

35 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R¹ is methyl.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R¹ is ethyl.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R² is hydrogen or methyl.

5 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R² is hydrogen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹, Q² and Q³ are halogen.

10 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is halogen.

15 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is chloro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is fluoro.

20 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is halogen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is chloro.

25 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

30 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is bromo, Q² is methyl and Q³ is chloro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is bromo, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

35 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is iodo, Q² is methyl and Q³ is chloro.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is iodo, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

- 5 Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein Q¹ is halogen, Q² and Q³ are C₁₋₄alkyl.

- Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R³ is tert-
- 10 butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1,1-dihalo-2-methylprop-2-yl, 1,1,1-trihalo-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkenyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkynyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-cyano-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxyalkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1,1-dihalo-3-methylbut-3-yl, 1,1,1-trihalo-3-methylbut-3-yl, 1-alkoxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkenyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkynyloxy-3-methylbut-3-yl,
- 15 1-cyano-3-methylbut-3-yl, 2-cyanoprop-2-yl, 2-methoxycarbonylprop-2-yl or 2-methylaminocarbonylprop-2-yl, 1-alkylthio-2-methylprop-2-yl, 1-alkylsulphinyl-2-methylprop-2-yl, 1-alkylsulphonyl-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-alkoxyprop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-hydroxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-alkoxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-aryloxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-
- 20 heteroaryloxyimino]-prop-2-yl, 1-alkoxy-prop-2-yl, 1-halo-prop-2-yl, 3-methyl-but-1-yn-3-yl, 1-alkyl-3-methyl-but-1-yn-3-yl, 4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-hydroxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxyalkoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxyalkoxyalkyl-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-cyanoalkyl-3-methylbut-3-yl, 1-haloalkyl-3-methylbut-3-yl, and more preferably, wherein R³ is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl,
- 25 1-fluoro-2-methylprop-2-yl, 1-methoxy-2-methylprop-2-yl, 1-ethoxy-2-methylprop-2-yl, 1-allyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-(prop-2-ynyloxy)-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-ethoxy-prop-2-yl, 2-cyano-1-methoxyprop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1-fluoro-3-methylbut-3-yl, 3-methylbut-1-yn-3-yl, 4-methylpent-2-yn-4-yl, 5-methyl-hex-3-yn-5-yl, 1-methoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-allyloxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-propargyloxy-4-methyl-pent-
- 30 2-yn-4-yl, 1-ethoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl.

- Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R⁴ is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with C₁₋₄alkoxy-(C₁₋₄)alkoxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino or tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is
- 35 C₁₋₆ alkyl optionally substituted with benzyloxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino or tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is

C₁₋₆ alkyl optionally substituted with C₂₋₆ alkenyloxy or -S(O)_x(C₁₋₆)alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino, -NH(C₁₋₄)alkyl=NOR, wherein R is hydrogen or C₁₋₄alkyl, or wherein the alkyl group is optionally substituted with tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is -CR^{uu}=NR^{vv}, wherein R^{uu} is hydrogen or C₁₋₆ alkyl and R^{vv} is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein the optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl rings or moieties of the R₅ values are optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C₁₋₆ alkyl, halo(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ alkenyl, halo(C₂₋₆)alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, halo(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkoxy, halo(C₁₋₆)alkoxy, C₂₋₆ alkenyloxy, halo(C₂₋₆)alkenyloxy, C₂₋₆ alkynyloxy, halo(C₂₋₆)alkynyloxy, aryl, aryloxy, aryl(C₁₋₆)alkyl, aryl-(C₁₋₆)alkoxy, heteroaryl, heteroaryloxy, heteroaryl(C₁₋₆)alkyl, heteroaryl(C₁₋₆)alkoxy, -SF₅, -S(O)_g(C₁₋₄)alkyl wherein g is 0, 1 or 2 and the alkyl is optionally substituted with halo, or R⁵ is optionally substituted with -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, or R⁵ is optionally substituted with -CONR^gR^h, -COR^g, -CO₂R^g, -R^g=NR^h, -NR^gR^h, -NR^gCOR^h, -NR^gCO₂R^h, -SO₂NR^gR^h or -NR^gSO₂Rⁱ, wherein Rⁱ is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen and R^g and R^h, independently of each other, are hydrogen or C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of -CONR^gR^h or -SO₂NR^gR^h, R^gR^h may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein the optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted 5- to 8-membered ring R⁴ is optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C₁₋₆ alkyl, halo(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ alkenyl, halo(C₂₋₆)alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, halo(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkoxy, halo(C₁₋₆)alkoxy, C₂₋₆ alkenyloxy, halo(C₂₋₆)alkenyloxy, C₂₋₆ alkynyloxy, halo(C₂₋₆)alkynyloxy, -SF₅, -S(O)_x(C₁₋₆)alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, or R⁴ is optionally substituted with -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, -CONR^xR^y, -CON(OR^x)R^y, -COR^x, -CO₂R^x, -CR^x=NR^y, -NR^xR^y, -NR^xCOR^y, -NR^xCO₂R^y, -SO₂NR^xR^y or -NR^xSO₂R^z, wherein R^z is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen and R^x and R^y, independently of each other, are hydrogen or C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R^{50} is C_{1-4} alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{2-6} alkenyl (especially allyl), C_{2-6} alkynyl (especially propargyl), C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylamino-carbonyloxy, $S(O)_p(C_{1-6})$ -alkyl, wherein p is 0, 1 or 2, triazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, tri(C_{1-4})-alkylsilyloxy, optionally substituted phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein R^{50} is C_{3-6} cycloalkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylamino-carbonyloxy, $S(O)_p(C_{1-6})$ -alkyl, wherein p is 0, 1 or 2, triazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, tri(C_{1-4})-alkylsilyloxy, optionally substituted phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein the optionally substituted aryl or the optionally substituted heteroaryl R^{50} is optionally substituted with halogen, hydroxy, mercapto, C_{1-4} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, C_{1-4} alkoxy, C_{2-4} alkenyloxy, C_{2-4} alkynyloxy, halo(C_{1-4})alkyl, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, halo(C_{1-4})-alkylthio, hydroxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl-(C_{1-4})alkyl, phenoxy, benzyloxy, benzoyloxy, cyano, isocyano, thiocyanato, isothiocyanato, nitro, NR^pR^q , $NHCOR^p$, $-NHCONR^pR^q$, $CONR^pR^q$, $-SO_2R^p$, OSO_2R^p , COR^p , $CR^p=NR^q$ or $N=CR^pR^q$, wherein R^p is C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy, and R^p and R^q are independently hydrogen, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein L is oxygen.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are those, wherein n is 0.

Another group of preferred compounds of the formula (I) are the N-oxides formed by the quinoline moiety in the compounds of the formula I.

Compounds that form part of the invention are illustrated in Tables 1 to 192 below. Melting points (mp) and/or diagnostic molecular ion (eg M^+ , $[M+1]^+$) values and/or spectroscopic (^1H NMR) data are provided in Examples 1-5 while biological activities are provided in Example 6.

Table 1

The compounds in Table 1 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R^1 is methyl, and R^2 and R^3 have the values given in the table.

Compound No.	R^2	R^3
1	H	CH_3
2	CH_3	CH_3
3	H	C_2H_5
4	C_2H_5	C_2H_5
5	H	prop-2-yl
6	CH_3	prop-2-yl
7	prop-2-yl	prop-2-yl
8	CH_3	<i>n</i> -butyl
9	H	but-2-yl
10	H	2-methyl-prop-1-yl
11	2-methyl-prop-1-yl	2-methyl-prop-1-yl
12	H	<i>tert</i> - C_4H_9
13	CH_3	<i>tert</i> - C_4H_9
14	H	pent-2-yl
15	H	pent-3-yl
16	H	2-methyl-but-2-yl
17	H	3-methyl-but-1-yl
18	H	3-methyl-pent-2-yl
19	H	4-methyl-pent-2-yl
20	H	3,3-dimethyl-but-2-yl
21	H	2-methyl-hex-2-yl
22	H	2,4-dimethyl-pent-2-yl
23	H	2,4,4-trimethyl-but-2-yl
24	H	2,4,4-trimethyl-pent-2-yl

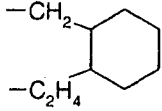
25	H	Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆ -
26	H	Cl-CH ₂ (CH ₃) ₂ C-
27	H	F ₃ C(CH ₃) ₂ C-
28	H	NC-CH ₂ -
29	CH ₃	NC-CH ₂ -
30	NC-CH ₂ -	NC-CH ₂ -
31	H	(NC) ₂ CH-
32	H	NC-C ₂ H ₄ -
33	CH ₃	NC-C ₂ H ₄ -
34	NC-C ₂ H ₄ -	NC-C ₂ H ₄ -
35	H	(CH ₃) ₂ C(CN)-
36	H	C ₂ H ₅ (CH ₃)C(CN)-
37	H	(C ₂ H ₅) ₂ C(CN)-
38	H	(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)C(CN)-
39	H	HO-CH ₂ (CH ₃) ₂ C-
40	H	HO-C ₂ H ₄ (CH ₃) ₂ C-
41	H	1-hydroxy-2-(hydroxymethyl)-prop-2-yl
42	H	1-hydroxy-2-(methoxymethyl)prop-2-yl
43	H	1-methoxy-2-(methoxymethyl)prop-2-yl
44	H	1-hydroxy-2-(hydroxymethyl)-but-2-yl
45	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ -	C ₂ H ₅ OC ₂ H ₄ -
46	CH ₃	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂ -
47	H	CH ₃ O-CH ₂ (CH ₃) ₂ C-
48	H	CH ₃ O-C ₂ H ₄ (CH ₃) ₂ C-
49	H	C ₂ H ₅ O-C ₂ H ₄ (CH ₃) ₂ C-
50	H	CH ₃ S-CH ₂ (CH ₃) ₂ C-
51	H	NC-(CH ₃ O)CH-
52	H	CH ₃ OCH ₂ (CH ₃)C(CN)-
53	H	CH ₃ SCH ₂ (CH ₃)C(CN)-
54	H	CH ₃ (CO)(CH ₃) ₂ C-
55	H	CH ₃ CHBr(CO)(CH ₃) ₂ C-
56	H	CH ₃ (CO)(OH)CH(CH ₃) ₂ C-

57	H	$\text{CH}_3\text{OC}_2\text{H}_4(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
58	H	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
59	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})(\text{CH}_3)\text{CH}-$
60	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
61	H	$\text{C}_2\text{H}_5\text{O}(\text{CO})\text{C}_2\text{H}_4-$
62	H	$\text{CH}_3\text{NH}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
63	H	$(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
64	H	$(\text{CH}_3)_3\text{SiCH}_2-$
65	H	<i>tert</i> - $\text{C}_4\text{H}_9(\text{CH}_3)_2\text{SiO}-\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
66	H	<i>tert</i> - $\text{C}_4\text{H}_9(\text{CH}_3)_2\text{SiO}-\text{C}_2\text{H}_4(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
67	H	$4\text{-FPhCH}_2\text{OCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
68	H	$\text{C}_2\text{H}_5\text{OCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
69	H	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
70	H	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$
71	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$
72	H	$\text{CH}_2=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$
73	H	$\text{CH}_2=\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}-$
74	H	$\text{CH}_2=\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
75	H	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}=\text{CH}-$
76	CH_3	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}=\text{CH}-$
77	H	pent-3-en-2-yl
78	H	2-methyl-hex-3-en-2-yl (E)
79	H	2-methyl-hex-3-en-2-yl (Z)
80	H	2-methyl-pent-4-en-3-on-2-yl
81	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})\text{CH}=(\text{Cl})\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
82	H	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
83	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OC}_2\text{H}_4-$
84	H	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2-$
85	CH_3	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2-$
86	H	cycloprop-1-yl
87	$\text{NC}-\text{C}_2\text{H}_4-$	cycloprop-1-yl
88	cycloprop-1-yl	cycloprop-1-yl
89	H	1-cyano-cycloprop-1-yl
90	H	2-cyano-cycloprop-1-yl
91	H	1-methoxycarbonyl-cycloprop-1-yl

92	H	1-[<i>N,N</i> -dimethylaminocarbonyl]-cycloprop-1-yl
93	H	1-[<i>N</i> -methyl- <i>N</i> -methoxyaminocarbonyl]-cycloprop-1-yl
94	H	1-cyano-1-cyclopropyl-eth-1-yl
95	H	cyclopent-1-yl
96	H	1-cyano-cyclopent-1-yl
97	H	cyclohex-1-yl
98	CH ₂ =CHCH ₂ -	cyclohex-1-yl
99	H	4-cyano-cyclohex-1-yl
100	H	1-cyano-4-methyl-cyclohex-1-yl
101	H	4- <i>tert</i> -butyl-1-cyano-cyclohex-1-yl
102	H	2-methyl-3-cyanotetrahydrofuran-3-yl
103	H	5-methyl-1,3-dioxolan-5-yl
104	H	5-ethyl-1,3-dioxolan-5-yl
105	H	3,5-dimethyl-1,3-dioxolan-5-yl
106	H	<i>N</i> -ethoxycarbonyl-piperid-4-yl
107	H	morpholino
108	H	cyclohex-1-yl-methyl
109	H	4-cyano-cyclopenten-3-yl
110	H	5- <i>tert</i> -butyl-2 <i>H</i> -1,3,4-thiadiazin-2-yl
111	H	2-(cyclohexen-1-yl)-eth-1-yl
112	H	fur-2-yl
113	H	5-methoxycarbonyl-fur-2-yl
114	H	thien-2-yl
115	H	2-methoxycarbonyl-thien-3-yl
116	H	4-methoxycarbonyl-thien-3-yl
117	H	oxazol-2-yl
118	H	5-methyl-isoxazol-3-yl
119	H	4-cyano-3-methyl-isoxazol-5-yl
120	H	thiazol-2-yl
121	H	5-ethylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
122	H	fur-2-ylmethyl
123	H	cyanofur-1-ylmethyl

124	H	thien-2-ylmethyl
125	H	C ₆ H ₅ -
126	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -
127	H	2-I-C ₆ H ₄ -
128	H	2-NC-C ₆ H ₄ -
129	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
130	H	3-CH ₃ S-C ₆ H ₄ -
131	H	3-CH ₃ O(CO)-C ₆ H ₄ -
132	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
133	H	4-F-C ₆ H ₄ -
134	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
135	H	4-(C ₂ H ₅) ₂ N-C ₆ H ₄ -
136	H	4-(N-methyl- N-acetyl-amino)-phenyl
137	H	2,4-dichlorophenyl
138	H	4-methoxy-2-methylphenyl
139	H	3,4-dichlorophenyl
140	H	3-chloro-4-fluorophenyl
141	H	2,5-difluorophenyl
142	H	5-fluoro-2-methylphenyl
143	H	5,6,7,8-tetrahydronaphth-2-yl
144	H	2,3-dihydrobenzofuran-5-yl-methyl
145	H	5-cyano-4,6-dimethoxy-pyrid-2-yl
146	H	2,6-dimethoxy-pyrid-3-yl
147	H	6-chloro-pyridazin-3-yl
148	H	4,6-dimethoxy-pyrimid-2-yl
149	H	2-chloro-5-fluoro-pyrimid-6-yl
150	H	C ₆ H ₅ CH ₂ -
151	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ -
152	H	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂ -
153	H	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
154	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
155	H	2-NO ₂ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
156	H	2-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
157	H	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
158	H	2-CHF ₂ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -

159	H	2-CH ₃ S-C ₆ H ₄ CH ₂ -
160	H	2-CF ₃ S-C ₆ H ₄ CH ₂ -
161	H	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
162	H	3-I-C ₆ H ₄ CH ₂ -
163	H	3-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
164	H	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
165	H	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂ -
166	H	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
167	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
168	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
169	H	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
170	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
171	H	2,6-di-F-C ₆ H ₃ CH ₂ -
172	3-methyl-but-2-en-1-yl	2,5-di-F-C ₆ H ₃ CH ₂ -
173	H	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
174	H	2-F-6-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
175	H	2,6-di-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
176	4-methyl-pent-2-en-1-yl	3,4-di-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
177	H	2-F-6-CH ₃ O-C ₆ H ₃ CH ₂ -
178	H	2,4,5-tri-F-C ₆ H ₂ CH ₂ -
179	H	2,4-di-Cl-6-CH ₃ -C ₆ H ₂ CH ₂ -
180	H	3,4,5-tri-CH ₃ O-C ₆ H ₂ CH ₂ -
181	H	C ₆ H ₅ -CH(CH ₃)-
182	H	4-F-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
183	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
184	H	4- <i>n</i> -pentyl-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
185	H	4-CH ₃ SO ₂ -C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
186	H	C ₆ H ₅ (CO)CH ₂ -
187	H	C ₆ H ₅ -CH(CN)-
188	H	C ₆ H ₅ -(CH ₃ O)CH-
189	H	C ₆ H ₅ -(CH ₃) ₂ C-
190	H	<i>m</i> -Cl-C ₆ H ₅ -(CH ₃) ₂ C-
191	H	3,5-di-Cl-C ₆ H ₃ -(CH ₃) ₂ C-
192	H	C ₆ H ₅ -(C ₂ H ₅ O(CO))CH-
193	H	phenethyl

194	H	3-methoxy-4-propargyloxy-phenethyl
195	H	3-methoxy-4-(pent-2-yn-1-yloxy)-phenethyl
196	H	2-methyl-3-phenyl-prop-2-yl
197	H	C ₆ H ₅ O-C ₂ H ₄ -
198	H	4-F-C ₆ H ₄ -CH ₂ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C-
199	H	C ₆ H ₅ -CH ₂ O(CO)C ₂ H ₄ -
200	H	naphth-2-yl-(CH ₃)CH-
201	NC-C ₂ H ₄ -	pyrid-3-ylmethyl
202	CH ₃	2-pyrid-2-yleth-1-yl
203	H	2-(3-chloro-5-trifluoromethyl-pyrid-2-yl)oxyeth-1-yl
204	H	2-methyl-4-pyrazin-2-yl-but-3-on-2-yl
205	-(CH ₂) ₄ -	
206	-(CH ₂) ₅ -	
207	-(CH ₂) ₄ CH(C ₂ H ₅)-	
208	- C ₃ H ₆ CH[(CO)N(C ₂ H ₅) ₂]CH ₂ -	
209	-CH(CH ₃)CH=CHCH(CH ₃)-	
210		
211	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ -	
212	-CH ₂ CH(CH ₃)OCH(CH ₃)CH ₂ -	
213	-C ₂ H ₄ SCH ₂ -	
214	-C ₂ H ₄ SC ₂ H ₄ -	
215	-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -	
216	-(CH ₂) ₂ N(<i>p</i> -NO ₂ -C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
217	-(CH ₂) ₂ N(<i>m</i> -CF ₃ -C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
218	-(CH ₂) ₂ N(<i>p</i> -CH ₃ CO-C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
219	-(CH ₂) ₂ N(pyrid-2-yl)(CH ₂) ₂ -	
220	H	(H ₂ C=CHCH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
221	H	(HCCHCH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
222	H	(CH ₃ CH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
223	H	((CH ₃) ₂ CHOCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
224	H	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C-

225	H	(CH ₃ CH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
226	H	4-F-C ₆ H ₄ -CH ₂ (CH ₃)C(CN)-
227	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ (CH ₃)C(CN)-
228	H	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ -CH ₂ CH ₂ (CH ₃)C(CN)-
229	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -CH ₂ (CH ₃)C(CN)-
230	H	(CH ₃) ₂ CH-CH ₂ (CH ₃)C(CN)-
231	H	1-methoxymethyl-cycloprop-1-yl
232	H	1-benzyloxymethyl-cycloprop-1-yl
233	H	1-methoxymethoxy-2- methyl-prop-2-yl
235	H	1-cyclopropyl-eth-1-yl
236	H	2-fluoro-eth-1-yl
237	H	2,2,2-trifluoro-1-methyl-eth-1-yl
238	H	HC≡CC(CH ₃) ₂ -
239	CH ₃	HC≡CC(CH ₃) ₂ -
240	H	HC≡CC(CH ₂ CH ₃)(CH ₃)-
241	CH ₃	HC≡CC(CH ₂ CH ₃)(CH ₃)-
242	H	HC≡CC(CH ₂ CH ₂)-
243	CH ₃	HC≡CC(CH ₂ CH ₂)-
244	H	(H ₃ C)C≡CC(CH ₃) ₂ -
245	CH ₃	(H ₃ C)C≡CC(CH ₃) ₂ -
246	H	(H ₃ C)C≡CC(CH ₂ CH ₃)(CH ₃)-
247	CH ₃	(H ₃ C)C≡CC(CH ₂ CH ₃)(CH ₃)-
248	H	(H ₃ C)C≡CC(CH ₂ CH ₂)-
249	CH ₃	(H ₃ C)C≡CC(CH ₂ CH ₂)-
250	H	(HOCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
251	H	(CH ₃ OCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
252	H	(HOCH ₂)C≡CC(CH ₃)(CH ₂ CH ₃) ₂ -
253	H	(CH ₃ CH ₂ OCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
254	H	(CH ₃ OCH ₂)C≡CC(CH ₃)(CH ₂ CH ₃) ₂ -
255	H	(CH ₃ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄)C≡CC(CH ₃) ₂ -
256	H	(Cl- <i>n</i> -C ₃ H ₆)C≡CC(CH ₃) ₂ -
257	H	(NC- <i>n</i> -C ₃ H ₆)C≡CC(CH ₃) ₂ -
258	H	(CH ₃ SCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
259	H	(C ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -

260	H	$(CH_3)_2(CH_3O)CC\equiv CC(CH_3)_2-$
261	H	$(H_2C=CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH-$
262	H	$(HC\equiv CHCH_2OCH_2)(CH_3)CH-$
263	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH-$
264	H	$(CH_3OCH_2)(CH_3)CH-$
265	H	$((CH_3)_2CHOCH_2)(CH_3)CH-$
266	H	$C_6H_5CH_2OCH_2(CH_3)CH-$
267	H	$(CH_3CH_2OCH_2)(CH_3)CH-$
268	H	$(cC_4H_7)CH-$
269	H	$(cC_4H_7)CH_3C-$
270	H	$FCH_2(CH_3)CH-$
271	H	$ClCH_2(CH_3)CH-$
272	H	$FCH_2CH_2(CH_3)CH-$
273	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)CH-$
274	H	$FCH_2(CH_3)_2C-$
275	H	$FCH_2CH_2(CH_3)_2C-$
276	H	$ClCH_2CH_2(CH_3)_2C-$
277	H	$CH_3O(C_2H_4)C\equiv CC(CH_3)_2-$
278	H	tetrahydro-furan-2-ylmethyl
279	H	1-(tetrahydro-furan-2-yl)ethyl
280	H	1-methyl-1-(tetrahydro-furan-2-yl)ethyl
281	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-ethyl
282	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-1-methyl-ethyl
283	H	2-[1,3]dioxolan-2-yl-1,1-dimethyl-ethyl
284	H	prop-1-yl
285	CH ₃	prop-1-yl
286	H	thiophen-3-ylmethyl
287	H	1-(thiophen-3-yl)-eth-1-yl
289	H	1-methyl-1-(thiophen-3-yl)-eth-1-yl
290	H	cyclopent-1-yl
291	H	3-F-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
292	H	3-F-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
293	H	3-F-C ₆ H ₄ -C(CH ₃) ₂ -
294	H	$C_2H_5C\equiv CC(CH_3)_2-$
294	H	$nC_3H_7C\equiv CC(CH_2CH_3)(CH_3)-$

296	H	$i\text{-C}_3\text{H}_7\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_2)\text{-}$
297	H	$n\text{-C}_4\text{H}_9\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
298	H	$sec\text{-C}_4\text{H}_9\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
299	H	$iso\text{-C}_4\text{H}_9\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
300	H	$tert\text{-C}_4\text{H}_9\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
301	H	$\text{HOC}_2\text{H}_4\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
302	H	$\text{CH}_3(\text{CH}_3\text{O})(\text{CH})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
303	H	$(n\text{C}_3\text{H}_7\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
304	H	$(n\text{C}_3\text{H}_7\text{OCH}_2\text{CH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
305	H	$(tert\text{-C}_4\text{H}_9\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
306	H	$(tert\text{-C}_4\text{H}_9\text{OCH}_2\text{CH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
307	H	$(\text{NCCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
308	H	$(\text{NCCH}_2\text{CH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
309	H	$(\text{C}_6\text{H}_5\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
310	H	$(\text{C}_6\text{H}_5\text{OCH}_2\text{CH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
311	H	$(4\text{-FC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
312	H	$(4\text{-ClC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
313	H	$(4\text{-BrC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
314	H	$(4\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
315	H	$(3\text{-FC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
316	H	$(3\text{-ClC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
317	H	$(3\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
318	H	$(2\text{-FC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
319	H	$(2\text{-ClC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
320	H	$(2\text{-BrC}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
321	H	$(2\text{-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
322	H	$(\text{thien-2-yl})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
323	H	$(\text{thien-3-yl})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$

Table 2

The compounds in Table 2 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 2 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 2 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 2 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1,

respectively, except that in the compounds of Table 2 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 3

The compounds in Table 3 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 3 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 3 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 3 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 3 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 4

The compounds in Table 4 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 4 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 4 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 4 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 4 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 5

The compounds in Table 5 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 5 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 5 Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 5 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 5 Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 6

The compounds in Table 6 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 6 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 6 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 6 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 6 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 7

The compounds in Table 7 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 7 is the same as compound 1 of Table 1 except
5 that in compound 1 of Table 7 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 7 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 7 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 8

10 The compounds in Table 8 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 8 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 8 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 8 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1,
15 respectively, except that in the compounds of Table 8 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 9

The compounds in Table 9 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in
20 Table 1. Thus, compound 1 of Table 9 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 9 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 9 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 9 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

25 Table 10

The compounds in Table 10 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 10 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 10 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly,
30 compounds 2 to 323 of Table 10 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 10 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 11

The compounds in Table 11 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is bromo, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in
35 Table 1. Thus, compound 1 of Table 11 is the same as compound 1 of Table 1 except

that in compound 1 of Table 11 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is bromo. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 11 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 11 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is bromo.

5 Table 12

The compounds in Table 12 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 12 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 12 Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, 10 compounds 2 to 323 of Table 12 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 12 Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

Table 13

The compounds in Table 13 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is 15 hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 13 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 13 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 13 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 13 Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 20 is methyl.

Table 14

The compounds in Table 14 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is 25 hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 14 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 14 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 14 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 14 Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 30 is methyl.

Table 15

The compounds in Table 15 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is 35 hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 15 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 15 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 15 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 15 Q1 is fluoro, Q2 is hydrogen, Q3 40 is methyl.

Table 16

The compounds in Table 16 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 16 is the same as compound 1 of Table 1 except
5 that in compound 1 of Table 16 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 16 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 16 Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

Table 17

10 The compounds in Table 17 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 17 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 17 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 17 are the same as compounds 2 to 323 of
15 Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 17 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 18

The compounds in Table 18 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in
20 Table 1. Thus, compound 1 of Table 18 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 18 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 18 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 18 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 19

25 The compounds in Table 19 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 19 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 19 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.
30 Similarly, compounds 2 to 323 of Table 19 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 19 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 20

The compounds in Table 20 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is
35 hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 20 is the same as compound 1 of Table 1 except

that in compound 1 of Table 20 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 20 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 20 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

5 Table 21

The compounds in Table 21 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 21 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 21 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

10 Similarly, compounds 2 to 323 of Table 21 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 21 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 22

15 The compounds in Table 22 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 22 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 22 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 22 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 22 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 23

25 The compounds in Table 23 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 23 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 23 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 23 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 23 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 24

30 The compounds in Table 24 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 24 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 24 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 24 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 24 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 25

The compounds in Table 25 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 25 is the same as compound 1 of Table 1 except
5 that in compound 1 of Table 25 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 25 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 25 R¹ is ethyl, Q1 is chloro, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

Table 26

10 The compounds in Table 26 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 26 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 26 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 26 are the same as compounds 2 to 323 of
15 Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 26 R¹ is ethyl, Q1 is bromo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

Table 27

The compounds in Table 27 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in
20 Table 1. Thus, compound 1 of Table 27 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 27 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 27 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 27 R¹ is ethyl, Q1 is iodo, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

25 Table 28

The compounds in Table 28 are of the general formula (I) where Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 28 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 28 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is
30 methyl. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 28 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 28 R¹ is ethyl, Q1 is hydrogen, Q2 is hydrogen, Q3 is methyl.

Table 29

The compounds in Table 29 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-3-yl, Q2
35 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 29 is the same as compound 1 of Table 1 except

that in compound 1 of Table 29 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.
Similarly, compounds 2 to 323 of Table 29 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 29 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

5 Table 30

The compounds in Table 30 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 30 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 30 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

10 Similarly, compounds 2 to 323 of Table 30 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 30 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 31

15 The compounds in Table 31 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 31 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 31 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Similarly, compounds 2 to 323 of Table 31 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 31 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

20 Table 32

The compounds in Table 32 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 32 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 32 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

25 Similarly, compounds 2 to 323 of Table 32 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 32 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 33

30 The compounds in Table 33 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 33 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 33 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

35 Similarly, compounds 2 to 323 of Table 33 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 33 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 34

The compounds in Table 34 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 34 is the same as compound 1 of Table 1 except
5 that in compound 1 of Table 34 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 34 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 34 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

Table 35

- 10 The compounds in Table 35 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 35 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 35 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 35 are the same as compounds 2 to 323 of
15 Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 35 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is chloro.

Table 36

The compounds in Table 36 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is ethyl, R² and R³ have the values listed in
20 Table 1. Thus, compound 1 of Table 36 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 36 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 36 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 36 Q1 is thiophen-2-yl, Q2 is hydrogen, Q3 is fluoro.

25 Table 37

The compounds in Table 37 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 37 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 37 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is chloro. Similarly,
30 compounds 2 to 323 of Table 37 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 37 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is chloro.

Table 38

- 35 The compounds in Table 38 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 38 is the same as compound 1 of Table 1 except

that in compound 1 of Table 38 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 38 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 38 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is chloro.

5 Table 39

The compounds in Table 39 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 39 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 39 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is chloro. Similarly,
10 compounds 2 to 323 of Table 39 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 39 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is chloro.

Table 40

The compounds in Table 40 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is chloro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in
15 Table 1. Thus, compound 1 of Table 40 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 40 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is chloro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 40 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 40 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is
20 chloro.

Table 41

The compounds in Table 41 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 41 is the same as compound 1 of Table 1 except
25 that in compound 1 of Table 41 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 41 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 41 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro.

Table 42

The compounds in Table 42 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 42 is the same as compound 1 of Table 1 except
30 that in compound 1 of Table 42 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 42 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 42 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is
35 fluoro.

Table 43

The compounds in Table 43 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 43 is the same as compound 1 of Table 1 except
5 that in compound 1 of Table 43 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 43 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 43 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is fluoro.

Table 44

10 The compounds in Table 44 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 44 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 44 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 44 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1,
15 respectively, except that in the compounds of Table 44 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is fluoro.

Table 45

The compounds in Table 45 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is bromo, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in
20 Table 1. Thus, compound 1 of Table 45 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 45 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is bromo. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 45 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 45 Q1 is chloro, Q2 is methyl, Q3 is bromo.

25 Table 46

The compounds in Table 46 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is bromo, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 46 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 46 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is bromo. Similarly,
30 compounds 2 to 323 of Table 46 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 46 Q1 is bromo, Q2 is methyl, Q3 is bromo.

Table 47

The compounds in Table 47 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is bromo, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in
35 Table 1. Thus, compound 1 of Table 47 is the same as compound 1 of Table 1 except

that in compound 1 of Table 47 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is bromo. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 47 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 47 Q1 is iodo, Q2 is methyl, Q3 is bromo.

5 Table 48

The compounds in Table 48 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is bromo, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 48 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 48 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is bromo. Similarly, 10 compounds 2 to 323 of Table 48 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 48 Q1 is fluoro, Q2 is methyl, Q3 is bromo.

Table 49

The compounds in Table 49 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 49 is the same as compound 1 of Table 1 except that in 15 compound 1 of Table 49 Q1 is chloro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 49 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 49 Q1 is chloro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro.

20 Table 50

The compounds in Table 50 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 50 is the same as compound 1 of Table 1 except that in 25 compound 1 of Table 50 Q1 is bromo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 50 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 50 Q1 is bromo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro.

Table 51

The compounds in Table 51 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 30 1. Thus, compound 1 of Table 51 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 51 Q1 is fluoro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 51 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 51 Q1 is fluoro, Q2 is chloro, Q3 is fluoro.

Table 52

35 The compounds in Table 52 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table

1. Thus, compound 1 of Table 52 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 52 Q1 is iodo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 52 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 52 Q1 is Q1 is iodo, Q2 is chloro, Q3 is fluoro.

5 Table 53

The compounds in Table 53 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 53 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 53 Q1 is chloro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 53 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 53 Q1 is Q1 is chloro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro.

Table 54

The compounds in Table 54 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 54 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 54 Q1 is bromo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 54 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 54 Q1 is Q1 is bromo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro.

Table 55

The compounds in Table 55 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 55 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 55 Q1 is fluoro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 55 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 55 Q1 is Q1 is fluoro, Q2 is bromo, Q3 is fluoro.

Table 56

The compounds in Table 56 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 56 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 56 Q1 is iodo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 56 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 56 Q1 is Q1 is iodo, Q2 is bromo, Q3 is fluoro.

Table 57

The compounds in Table 57 are of the general formula (I) where Q1 is chloro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 57 is the same as compound 1 of Table 1 except that in

compound 1 of Table 57 Q1 is chloro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 57 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 57 Q1 is chloro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro.

Table 58

5 The compounds in Table 58 are of the general formula (I) where Q1 is bromo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 58 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 58 Q1 is bromo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 58 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except
10 that in the compounds of Table 58 Q1 is bromo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro.

Table 59

The compounds in Table 59 are of the general formula (I) where Q1 is fluoro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 59 is the same as compound 1 of Table 1 except that in
15 compound 1 of Table 59 Q1 is fluoro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 59 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 59 Q1 is fluoro, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro.

Table 60

The compounds in Table 60 are of the general formula (I) where Q1 is iodo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1.
20 Thus, compound 1 of Table 60 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 60 Q1 is iodo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro. Similarly, compounds 2 to 323 of Table 60 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 60 Q1 is iodo, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro.

Table 61

25 The compounds in Table 61 are of the general formula (I) where Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro, n is 0, L is O, R¹ is methyl, R² and R³ have the values listed in Table 1. Thus, compound 1 of Table 61 is the same as compound 1 of Table 1 except that in compound 1 of Table 61 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro. Similarly,
30 compounds 2 to 323 of Table 61 are the same as compounds 2 to 323 of Table 1, respectively, except that in the compounds of Table 61 Q1 is thiophen-3-yl, Q2 is fluoro, Q3 is fluoro.

Tables 62 to 121

Tables 62 to 121 correspond exactly to Tables 1 to 61 (i.e. Table 62 corresponds exactly
35 to Table 1, Table 63 corresponds exactly to Table 2, and so on) the only difference being that in each of Tables 62 to 121, L is S instead of O.

Tables 122 to 181

Tables 122 to 181 correspond exactly to Tables 1 to 61 (i.e. Table 122 corresponds exactly to Table 1, Table 123 corresponds exactly to Table 2, and so on) the only difference being that in each of Tables 122 to 181, n is 1 instead of 0.

5 Tables 182 to 241

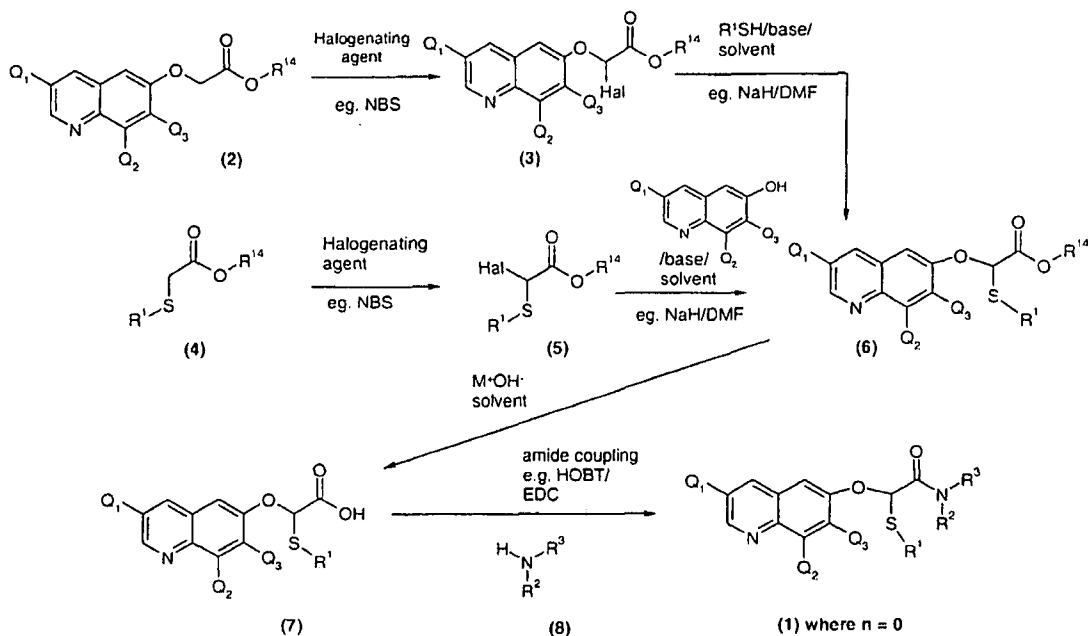
Tables 182 to 241 correspond exactly to Tables 1 to 61 (i.e. Table 182 corresponds exactly to Table 1, Table 183 corresponds exactly to Table 2, and so on) the only difference being that in each of Tables 182 to 241, n is 2 instead of 0.

The compounds of general formula (I) may be prepared as outlined in Schemes 1 to 8
 10 below, in which Q1, Q2, Q3, R¹, R² and R³ have the meanings given above, R¹⁴ is H or C₁₋₄ alkyl, as indicated, R¹⁰ is C₁₋₆ alkyl, optionally substituted benzyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₄ alkynyl, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹² and R¹³ are independently H or C₁₋₄ alkyl, R⁹ is H or C₁₋₃ alkyl, R^h is H or C₁₋₃ alkyl, Rⁱ is C₁₋₆ alkyl, optionally substituted benzyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted
 15 C₂₋₄ alkynyl, m is 0, 1 or 2, DMF is *N,N*-dimethylformamide, NBS is *N*-bromosuccinimide, NCS is *N*-chlorosuccinimide and MCPBA is *m*-chloroperbenzoic acid. Other abbreviations are defined in the text.

Where typical or preferred process conditions (reaction temperature, time, solvent, mole ratios of reactants) are given, unless otherwise stated other process conditions can also
 20 be used. While optimum reaction conditions may vary with the particular reactants or solvents used, such conditions can be determined by routine optimisation procedures by one skilled in the art.

Compounds of formula (1), where n is 0 and L is O, may be prepared as shown in Scheme 1. Esters of formula (2), where R⁵ is C₁₋₄ alkyl, may be halogenated to give
 25 haloesters of formula (3), where Hal is a halogen atom such as bromine, chlorine or iodine, by reaction with a halogenating agent such as *N*-bromosuccinimide, in a suitable solvent such as carbon tetrachloride or acetonitrile, in the presence of a radical initiator such as AIBN (azo-*isobutyronitrile*), and a light source, at between ambient temperature and the reflux temperature of the solvent. Compounds of general formula (3) are then
 30 reacted with alkanethiols of general formula R¹SH, in the presence of a base such as sodium hydride, in a suitable solvent such as DMF, to give compounds of general formula (6), or are reacted with alkanethiol salts R¹S⁻M⁺, where M is a metal such as sodium or lithium, in a suitable solvent such as DMF, to give compounds of general formula (6).

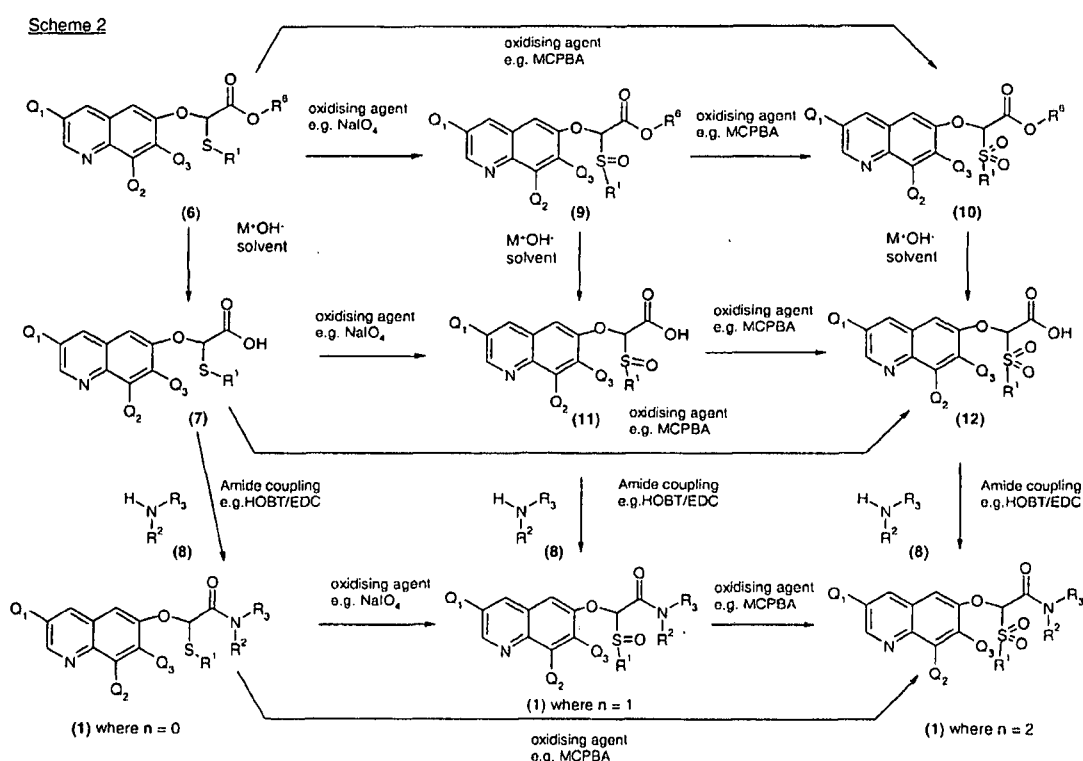
Scheme 1



Alternatively esters of general formula (4) are halogenated to give haloesters of formula (5), where Hal is a halogen atom such as bromine, chlorine or iodine, by reaction with a halogenating agent such as *N*-chlorosuccinimide or *N*-bromosuccinimide, in a suitable solvent such as carbon tetrachloride or acetonitrile, at between 0°C and the reflux temperature of the solvent. Haloesters of formula (5) are reacted with 6-hydroxy quinolines, where Q_1 , Q_2 and Q_3 are as defined above, in the presence of a base such as potassium *t*-butoxide, potassium carbonate, or sodium hydride in a suitable solvent such as *t*-butanol, 1,4-dioxane or DMF, at between ambient temperature and the reflux temperature of the solvent, to give compounds of formula (6). Compounds of formula (6) are hydrolysed to acids of formula (7) by reaction with an alkali metal hydroxide M^+OH^- , in a suitable solvent such as aqueous methanol, ethanol, or THF (tetrahydrofuran) at between ambient temperature and the reflux temperature of the solvent followed by acidification. Acids of formula (7) can be condensed with amines of formula (8), using suitable activating agents such as HOBT (1-hydroxybenzotriazole) and EDC (1-ethyl-3-*N,N*-dimethylaminopropylcarbodiimide hydrochloride), at between 0°C and ambient temperature in a suitable solvent such as DMF, to give compounds of general formula (1) where n is 0 and L is O.

Compounds of general formula (1), where n is 1 or 2, are prepared by oxidation of compounds (1) where $n = 0$ to the sulfoxide (n is 1) or sulphone (n is 2) oxidation state, as shown in Scheme 2. For example, esters of the general formula (6) where R^5 is C_{1-4} alkyl can be oxidised to sulfoxides of formula (9) with an oxidising agent such as

sodium periodate in a suitable solvent such ethanol, between 0°C and ambient temperature. Sulphones of formula (10) can be made either directly from compounds of formula (6) with two or more equivalents of an oxidising agent such as *m*-chloroperbenzoic acid (MCPBA), in a suitable solvent such as dichloromethane between 0°C and the reflux temperature of the solvent, or from sulfoxides of formula (9) with one or more equivalents of *m*-chloroperbenzoic acid. Sulphides of formula (6), sulfoxides of formula (9) or sulphones of formula (10) can be hydrolysed to the corresponding acids (7), (11) or (12) by reaction with an alkali metal hydroxide in a suitable solvent such as ethanol at between 0°C and the reflux temperature of the solvent followed by acidification. The acids of formula (7), (11) or (12) can be condensed with amines of formula (8), using suitable activating agents such as HOBt and EDC, at between 0°C and ambient temperature, to give compounds of general formula (1) where *n* is 0, 1 or 2.



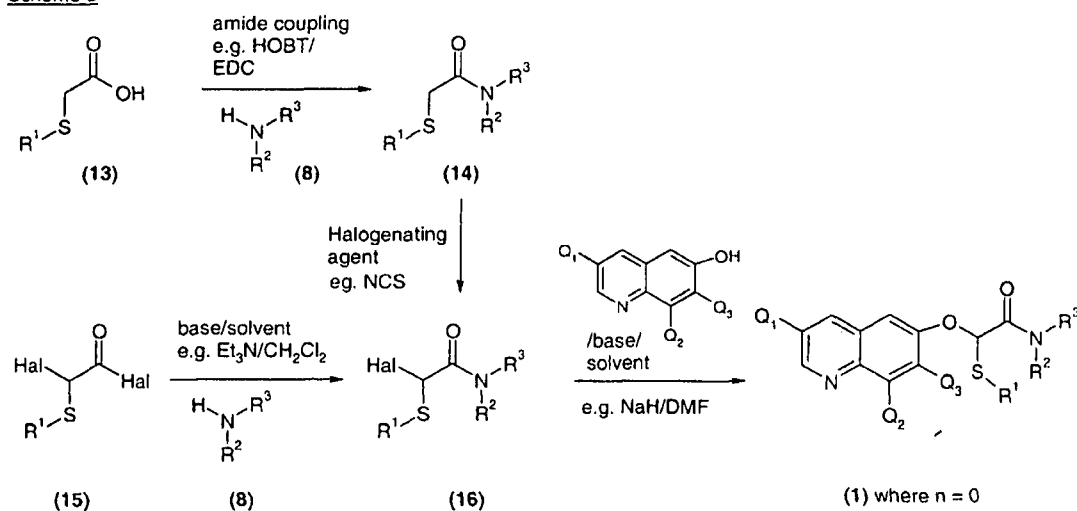
15

Similarly, sulfoxides of formula (11) and of formula (1) where *n* is 1 can be prepared from sulphides of formula (7) and of formula (1) where *n* is 0 respectively, using oxidising agents such as sodium metaperiodate or *m*-chloroperbenzoic acid as described above. Sulphones of formula (12) and of formula (1) where *n* is 2, can be

prepared either from sulphides of formula (7) and of formula (1) where n is 0, by using at least two equivalents of oxidising agents such as *m*-chloroperbenzoic acid, or from sulfoxides of formula (11) and of formula (1) where n is 1, using one or more equivalents of oxidising agents such as *m*-chloroperbenzoic acid, as described above.

- 5 Compounds of formula (1) can also be prepared as shown in Scheme 3. Acids of formula (13) can be condensed with amines of formula (8), using suitable activating agents such as HOBT and EDC, at between 0°C and ambient temperature, to give compounds of formula (14). Compounds of formula (14) can be halogenated to compounds of formula (16) using a halogenating agent such as *N*-chlorosuccinimide, in a suitable solvent such as carbon tetrachloride or acetonitrile, at between 0°C and ambient temperature. Amides of formula (16) can also be prepared from acid halides of formula (15) by reaction with amines of formula (8) in the presence of a base such as triethylamine in a suitable solvent such as dichloromethane, at between 0°C and ambient temperature.

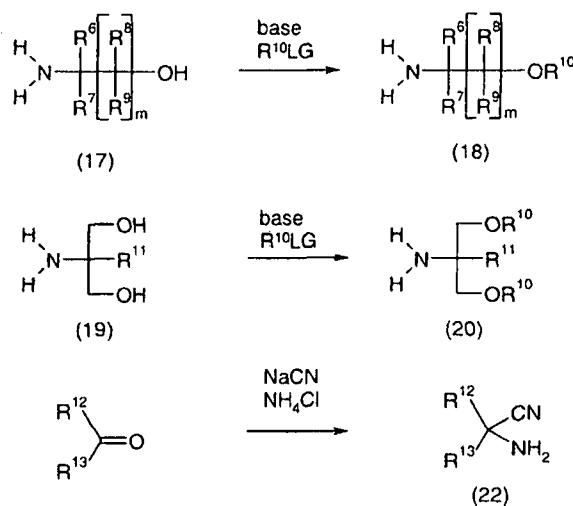
Scheme 3



- 15 Halosulphides of formula (16) can be reacted with substituted 6-hydroxy quinolines, in the presence of a base such as potassium carbonate or sodium hydride, in a suitable solvent such as DMF, at between 0°C and 80°C, to give compounds of formula (1) where n is 0.
- 20 As shown in Scheme 4, amines of the general formula (18) or (20), which are examples of amines of the general formula (8) wherein R^2 is H, may be prepared by alkylation of an aminoalcohol of the general formula (17) or (19) using a suitable base, such as *n*-butyl lithium or sodium hydride, followed by reaction with a suitable alkylating reagent R^{10}LG , such as an alkyl iodide, for example, methyl iodide, to form an alkylated

compound of the general formula (18) or (20), respectively. A carbonyl derivative $R^{12}COR^{13}$ (21), for example formaldehyde, can be reacted with ammonia, usually in form of ammonium chloride, and cyanide, conveniently in form of an aqueous solution sodium cyanide, to provide an α -aminoalkyne (22) (Strecker synthesis).

Scheme 4



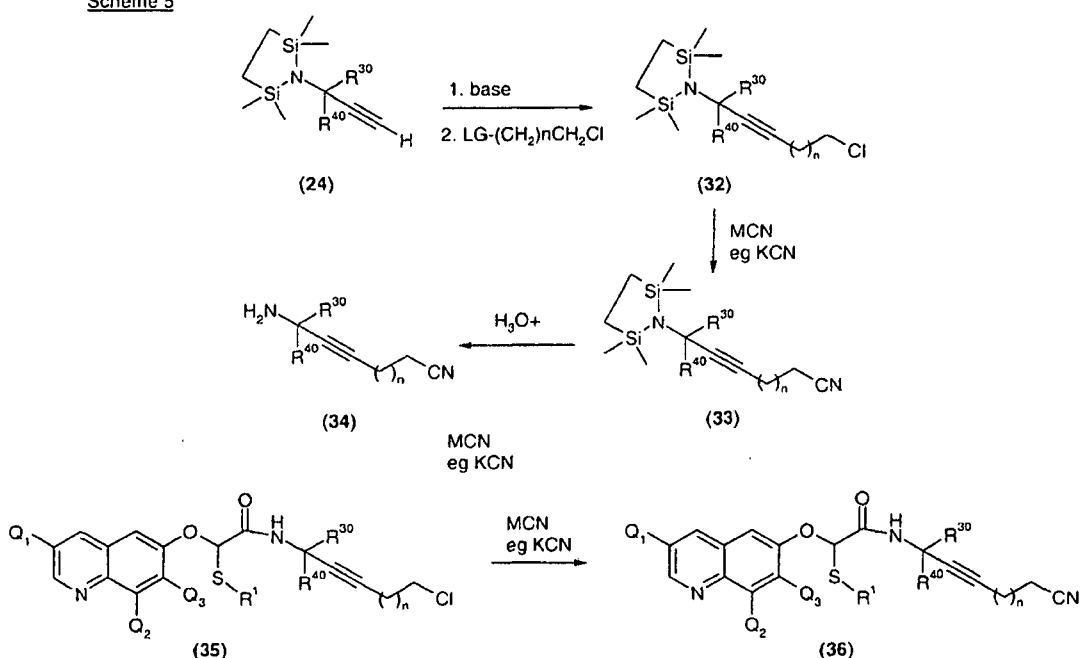
5

As shown in Scheme 5, silyl-protected aminoalkynes of the general formula (24) may be obtained by reacting amines of general formula (23) with 1,2-bis-(chlorodimethylsilyl)-ethane in the presence of a suitable base, such as a tertiary organic amine base, for example, triethylamine. Amines of the general formula (26), which are examples of

10 amines of the general formula (8) wherein R^2 is H and R^3 is $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$, may be prepared by alkylation of a silyl-protected aminoalkyne of the general formula (24) using a suitable base, such as *n*-butyl lithium, followed by reaction with a suitable alkylating reagent $R^{50}LG$, such as an alkyl iodide, for example, methyl iodide, to form an alkylated compound of the general formula (25). The silyl protecting group may then be removed

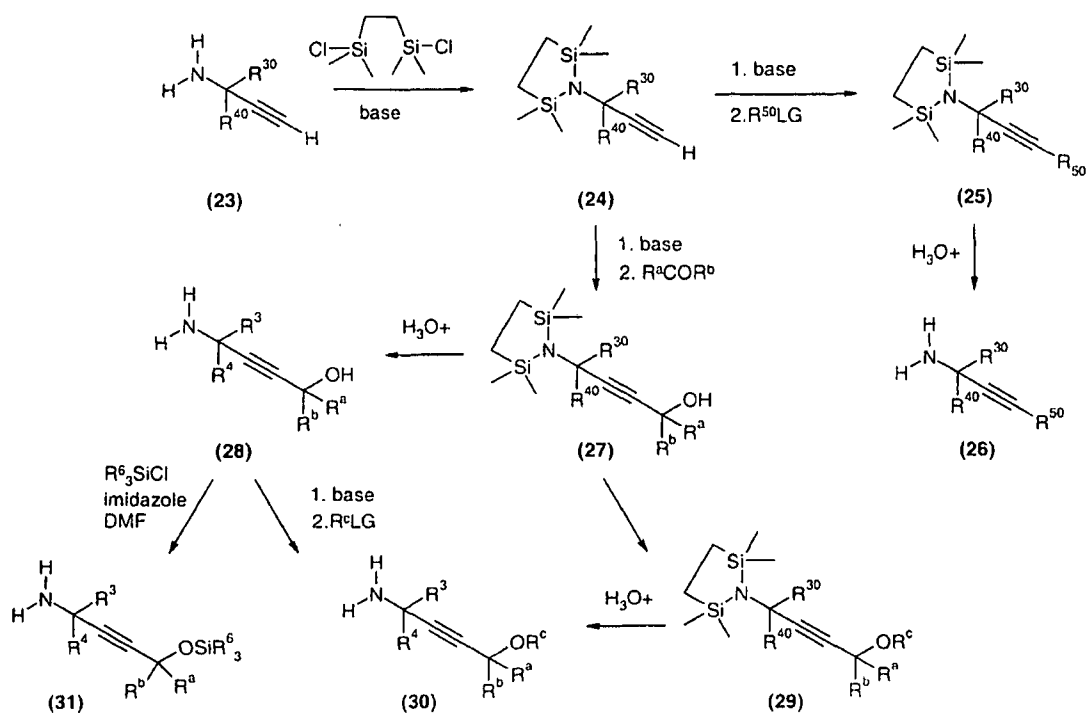
15 from a compound of the general formula (25) with, for example, an aqueous acid to form an aminoalkyne of the general formula (26).

Scheme 5



In a similar procedure, a silyl-protected aminoalkyne of the general formula (24) may be reacted with a carbonyl derivative R^aCOR^b, for example formaldehyde, using a suitable base, such as *n*-butyl lithium, to provide an aminoalkyne (27) containing a hydroxyalkyl moiety. A compound of the general formula (27) may either first be treated with a base, such as sodium hydride or potassium *bis*(trimethylsilyl)amide followed by a compound R^cLG, where LG represents a leaving group such as a halogen, or sulphonate ester such as OSO₂Me, or OSO₂-4-tolyl, for example ethyl iodide, to give a compound of the general formula (29). After removal of the silyl protecting group, compounds of general formula (30) are obtained. Alternatively, the silyl protecting group can first be removed to yield compounds of the general formula (28). Aminoalkynes of the general formula (28) may be further derivatised by reacting with a silylating agent, for example *t*-butyl-dimethylsilyl chloride, to give a derivative silylated on oxygen of the general formula (31).

Scheme 6



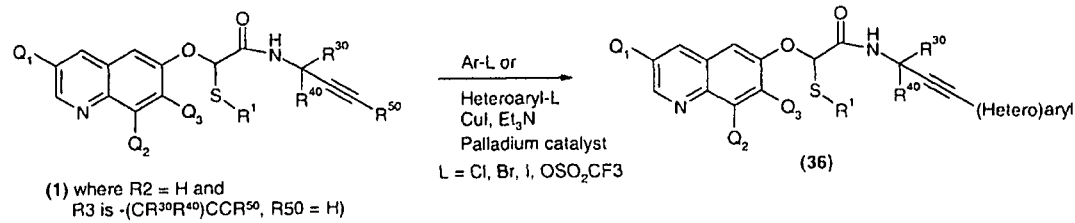
As shown in Scheme 6, silyl-protected aminoalkynes of the general formula (32) may be obtained by reacting silyl-protected amines of general formula (24) with chloroalkanes bearing a suitable leaving group, for example bromide or iodide, in the presence of a suitable base, such as asodium or lithium amide base, for example, sodium bis(trimethylsilyl)amide or sodium amide. Amines of the general formula (34), which are examples of amines of the general formula (8) wherein R^2 is H and R^3 is -

(CR³⁰R⁴⁰)C≡CR⁵⁰ may be prepared by displacement of chloride anion by cyanide, followed by removal of the silyl protecting group with, for example, an aqueous acid, to form a cyano compound of the general formula (34).

In a similar procedure, an amide of the general formula (35) can be reacted with, for example, potassium cyanide yielding a cyano amidoalkyne of the general formula (36).

As shown in Scheme 7, compounds of the general formula (1), wherein R^{50} is H, may be reacted under Sonogashira conditions with, for example, optionally substituted aryl or heteroaryl chlorides, bromides, iodides or triflates to form substituted aryl or heteroaryl compounds of general formula (1), wherein R^{50} is an optionally substituted aryl or heteroaryl group. A suitable palladium catalyst is bis(triphenylphosphine)palladium (II) chloride.

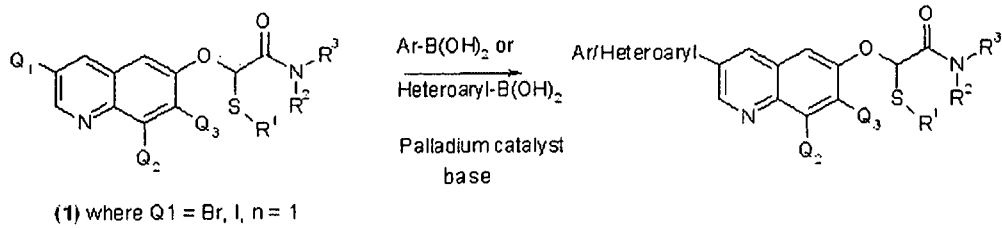
Scheme 7



Other amines of the general formula (8) are either commercially available or may be prepared by standard literature methods or standard modifications.

As shown in Scheme 8, compounds of the general formula (1), wherein Q₁ is bromine or iodine, may be reacted under Suzuki conditions with, for example, optionally substituted aryl or heteroaryl boronic acids to form substituted aryl or heteroaryl compounds of general formula (1), wherein Q₁ is an optionally substituted aryl or heteroaryl group. A suitable palladium catalyst is tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0).

Scheme 8



Thioamides (Compounds of the general formula (1) where L = S) may be prepared from the corresponding amides using thionating agents such as phosphorus pentasulphide, Lawesson's or Davy's reagents or prepared from the corresponding thionoacids or thionoesters using standard literature methods or standard modifications.

The substituted 6-hydroxy quinolines are available, or may be prepared using straightforward techniques of organic chemistry. When the compounds are not commercially available, they may be prepared from available precursors using straightforward transformations that are well known in the art that are well described in standard textbooks of heterocyclic chemistry. For example, substituted aromatic amines may be readily converted into substituted quinolin-6-ols with appropriate electrophiles, such as 2,2,3 tribromopropanal. Examples of such reactions are provided in Examples 1-3.

The compounds of formula (I) are active fungicides and may be used to control one or more of the following pathogens: *Pyricularia oryzae* (*Magnaporthe grisea*) on rice and

wheat and other *Pyricularia* spp. on other hosts; *Puccinia triticina* (or *recondita*), *Puccinia striiformis* and other rusts on wheat, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* and other rusts on barley, and rusts on other hosts (for example turf, rye, coffee, pears, apples, peanuts, sugar beet, vegetables and ornamental plants); *Erysiphe*

5 *cichoracearum* on cucurbits (for example melon); *Blumeria* (or *Erysiphe*) *graminis* (powdery mildew) on barley, wheat, rye and turf and other powdery mildews on various hosts, such as *Sphaerotheca macularis* on hops, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*) on cucurbits (for example cucumber), *Leveillula taurica* on tomatoes, aubergine and green pepper, *Podosphaera leucotricha* on apples and *Uncinula necator*

10 on vines; *Cochliobolus* spp., *Helminthosporium* spp., *Drechslera* spp. (*Pyrenophora* spp.), *Rhynchosporium* spp., *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) and *Phaeosphaeria nodorum* (*Stagonospora nodorum* or *Septoria nodorum*), *Pseudocercospora herpotrichoides* and *Gaeumannomyces graminis* on cereals (for example wheat, barley, rye), turf and other hosts; *Cercospora arachidicola* and

15 *Cercosporidium personatum* on peanuts and other *Cercospora* spp. on other hosts, for example sugar beet, bananas, soya beans and rice; *Botrytis cinerea* (grey mould) on tomatoes, strawberries, vegetables, vines and other hosts and other *Botrytis* spp. on other hosts; *Alternaria* spp. on vegetables (for example carrots), oil-seed rape, apples, tomatoes, potatoes, cereals (for example wheat) and other hosts; *Venturia* spp.

20 (including *Venturia inaequalis* (scab)) on apples, pears, stone fruit, tree nuts and other hosts; *Cladosporium* spp. on a range of hosts including cereals (for example wheat) and tomatoes; *Monilinia* spp. on stone fruit, tree nuts and other hosts; *Didymella* spp. on tomatoes, turf, wheat, cucurbits and other hosts; *Phoma* spp. on oil-seed rape, turf, rice, potatoes, wheat and other hosts; *Aspergillus* spp. and *Aureobasidium* spp. on wheat,

25 lumber and other hosts; *Ascochyta* spp. on peas, wheat, barley and other hosts; *Stemphylium* spp. (*Pleospora* spp.) on apples, pears, onions and other hosts; summer diseases (for example bitter rot (*Glomerella cingulata*), black rot or frog-eye leaf spot (*Botryosphaeria obtusa*), Brooks fruit spot (*Mycosphaerella pomi*), Cedar apple rust (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), sooty blotch (*Gloeodes pomigena*), flyspeck

30 (*Schizothyrium pomi*) and white rot (*Botryosphaeria dothidea*) on apples and pears; *Plasmopara viticola* on vines; other downy mildews, such as *Bremia lactucae* on lettuce, *Peronospora* spp. on soybeans, tobacco, onions and other hosts, *Pseudoperonospora humuli* on hops and *Pseudoperonospora cubensis* on cucurbits; *Pythium* spp. (including *Pythium ultimum*) on turf and other hosts; *Phytophthora infestans* on potatoes and

35 tomatoes and other *Phytophthora* spp. on vegetables, strawberries, avocado, pepper, ornamentals, tobacco, cocoa and other hosts; *Thanatephorus cucumeris* on rice and turf

- and other *Rhizoctonia* spp. on various hosts such as wheat and barley, peanuts, vegetables, cotton and turf; *Sclerotinia* spp. on turf, peanuts, potatoes, oil-seed rape and other hosts; *Sclerotium* spp. on turf, peanuts and other hosts; *Gibberella fujikuroi* on rice; *Colletotrichum* spp. on a range of hosts including turf, coffee and vegetables;
- 5 *Laetisaria fuciformis* on turf; *Mycosphaerella* spp. on bananas, peanuts, citrus, pecans, papaya and other hosts; *Diaporthe* spp. on citrus, soybean, melon, pears, lupin and other hosts; *Elsinoe* spp. on citrus, vines, olives, pecans, roses and other hosts; *Verticillium* spp. on a range of hosts including hops, potatoes and tomatoes; *Pyrenopeziza* spp. on oil-seed rape and other hosts; *Oncobasidium theobromae* on
- 10 cocoa causing vascular streak dieback; *Fusarium* spp., *Typhula* spp., *Microdochium nivale*, *Ustilago* spp., *Urocystis* spp., *Tilletia* spp. and *Claviceps purpurea* on a variety of hosts but particularly wheat, barley, turf and maize; *Ramularia* spp. on sugar beet, barley and other hosts; post-harvest diseases particularly of fruit (for example *Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* and *Trichoderma viride* on oranges,
- 15 *Colletotrichum musae* and *Gloeosporium musarum* on bananas and *Botrytis cinerea* on grapes); other pathogens on vines, notably *Eutypa lata*, *Guignardia bidwellii*, *Phellinus igniarius*, *Phomopsis viticola*, *Pseudopeziza tracheiphila* and *Stereum hirsutum*; other pathogens on trees (for example *Lophodermium seditiosum*) or lumber, notably *Cephalosporium fragrans*, *Ceratocystis* spp., *Ophiostoma piceae*, *Penicillium* spp.,
- 20 *Trichoderma pseudokoningii*, *Trichoderma viride*, *Trichoderma harzianum*, *Aspergillus niger*, *Leptographium lindbergi* and *Aureobasidium pullulans*; and fungal vectors of viral diseases (for example *Polymyxa graminis* on cereals as the vector of barley yellow mosaic virus (BYMV) and *Polymyxa betae* on sugar beet as the vector of rhizomania).
- 25 A compound of formula (I) may move acropetally, basipetally or locally in plant tissue to be active against one or more fungi. Moreover, a compound of formula (I) may be volatile enough to be active in the vapour phase against one or more fungi on the plant.

- The invention therefore provides a method of combating or controlling phytopathogenic
- 30 fungi which comprises applying a fungicidally effective amount of a compound of formula (I), or a composition containing a compound of formula (I), to a plant, to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other plant growth medium, e.g. nutrient solution.

The term "plant" as used herein includes seedlings, bushes and trees. Furthermore, the fungicidal method of the invention includes protectant, curative, systemic, eradicator and antisporulant treatments.

- 5 The compounds of formula (I) are preferably used for agricultural, horticultural and turfgrass purposes in the form of a composition.

In order to apply a compound of formula (I) to a plant, to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other growth medium, a compound of formula (I) is
10 usually formulated into a composition which includes, in addition to the compound of formula (I), a suitable inert diluent or carrier and, optionally, a surface active agent (SFA). SFAs are chemicals that are able to modify the properties of an interface (for example, liquid/solid, liquid/air or liquid/liquid interfaces) by lowering the interfacial tension and thereby leading to changes in other properties (for example dispersion,
15 emulsification and wetting). It is preferred that all compositions (both solid and liquid formulations) comprise, by weight, 0.0001 to 95%, more preferably 1 to 85%, for example 5 to 60%, of a compound of formula (I). The composition is generally used for the control of fungi such that a compound of formula (I) is applied at a rate of from 0.1g to 10kg per hectare, preferably from 1g to 6kg per hectare, more preferably from 1g to
20 1kg per hectare.

When used in a seed dressing, a compound of formula (I) is used at a rate of 0.0001g to 10g (for example 0.001g or 0.05g), preferably 0.005g to 10g, more preferably 0.005g to 4g, per kilogram of seed.

25 In another aspect the present invention provides a fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound of formula (I) and a suitable carrier or diluent therefor.

30 In a still further aspect the invention provides a method of combating and controlling fungi at a locus, which comprises treating the fungi, or the locus of the fungi with a fungicidally effective amount of a composition comprising a compound of formula (I). The compositions can be chosen from a number of formulation types, including dustable powders (DP), soluble powders (SP), water soluble granules (SG), water dispersible
35 granules (WG), wettable powders (WP), granules (GR) (slow or fast release), soluble concentrates (SL), oil miscible liquids (OL), ultra low volume liquids (UL), emulsifiable

concentrates (EC), dispersible concentrates (DC), emulsions (both oil in water (EW) and water in oil (EO)), micro-emulsions (ME), suspension concentrates (SC), aerosols, fogging/smoke formulations, capsule suspensions (CS) and seed treatment formulations. The formulation type chosen in any instance will depend upon the particular purpose envisaged and the physical, chemical and biological properties of the compound of formula (I).

Dustable powders (DP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents (for example natural clays, kaolin, pyrophyllite, bentonite, alumina, montmorillonite, kieselguhr, chalk, diatomaceous earths, calcium phosphates, calcium and magnesium carbonates, sulphur, lime, flours, talc and other organic and inorganic solid carriers) and mechanically grinding the mixture to a fine powder.

Soluble powders (SP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more water-soluble inorganic salts (such as sodium bicarbonate, sodium carbonate or magnesium sulphate) or one or more water-soluble organic solids (such as a polysaccharide) and, optionally, one or more wetting agents, one or more dispersing agents or a mixture of said agents to improve water dispersibility/solubility. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water soluble granules (SG).

Wettable powders (WP) may be prepared by mixing a compound of formula (I) with one or more solid diluents or carriers, one or more wetting agents and, preferably, one or more dispersing agents and, optionally, one or more suspending agents to facilitate the dispersion in liquids. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water dispersible granules (WG).

Granules (GR) may be formed either by granulating a mixture of a compound of formula (I) and one or more powdered solid diluents or carriers, or from pre-formed blank granules by absorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) in a porous granular material (such as pumice, attapulgite clays, fuller's earth, kieselguhr, diatomaceous earths or ground corn cobs) or by adsorbing a compound of formula (I) (or a solution thereof, in a suitable agent) on to a hard core material (such as sands, silicates, mineral carbonates, sulphates or phosphates) and drying if necessary. Agents which are commonly used to aid absorption or adsorption include solvents (such as aliphatic and aromatic petroleum solvents, alcohols, ethers, ketones and esters) and

sticking agents (such as polyvinyl acetates, polyvinyl alcohols, dextrans, sugars and vegetable oils). One or more other additives may also be included in granules (for example an emulsifying agent, wetting agent or dispersing agent).

- 5 Dispersible Concentrates (DC) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in water or an organic solvent, such as a ketone, alcohol or glycol ether. These solutions may contain a surface active agent (for example to improve water dilution or prevent crystallisation in a spray tank).
- 10 Emulsifiable concentrates (EC) or oil-in-water emulsions (EW) may be prepared by dissolving a compound of formula (I) in an organic solvent (optionally containing one or more wetting agents, one or more emulsifying agents or a mixture of said agents). Suitable organic solvents for use in ECs include aromatic hydrocarbons (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes, exemplified by SOLVESSO 100, SOLVESSO 150
- 15 and SOLVESSO 200; SOLVESSO is a Registered Trade Mark), ketones (such as cyclohexanone or methylcyclohexanone), alcohols (such as benzyl alcohol, furfuryl alcohol or butanol), *N*-alkylpyrrolidones (such as *N*-methylpyrrolidone or *N*-octylpyrrolidone), dimethyl amides of fatty acids (such as C₈-C₁₀ fatty acid dimethylamide) and chlorinated hydrocarbons. An EC product may spontaneously emulsify on addition
- 20 to water, to produce an emulsion with sufficient stability to allow spray application through appropriate equipment. Preparation of an EW involves obtaining a compound of formula (I) either as a liquid (if it is not a liquid at ambient temperature, it may be melted at a reasonable temperature, typically below 70°C) or in solution (by dissolving it in an appropriate solvent) and then emulsifying the resultant liquid or solution into water
- 25 containing one or more SFAs, under high shear, to produce an emulsion. Suitable solvents for use in EWs include vegetable oils, chlorinated hydrocarbons (such as chlorobenzenes), aromatic solvents (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes) and other appropriate organic solvents that have a low solubility in water.
- 30 Microemulsions (ME) may be prepared by mixing water with a blend of one or more solvents with one or more SFAs, to produce spontaneously a thermodynamically stable isotropic liquid formulation. A compound of formula (I) is present initially in either the water or the solvent/SFA blend. Suitable solvents for use in MEs include those hereinbefore described for use in ECs or in EWs. An ME may be either an oil-in-water or
- 35 a water-in-oil system (which system is present may be determined by conductivity measurements) and may be suitable for mixing water-soluble and oil-soluble pesticides

in the same formulation. An ME is suitable for dilution into water, either remaining as a microemulsion or forming a conventional oil-in-water emulsion.

Suspension concentrates (SC) may comprise aqueous or non-aqueous suspensions of finely divided insoluble solid particles of a compound of formula (I). SCs may be prepared by ball or bead milling the solid compound of formula (I) in a suitable medium, optionally with one or more dispersing agents, to produce a fine particle suspension of the compound. One or more wetting agents may be included in the composition and a suspending agent may be included to reduce the rate at which the particles settle. Alternatively, a compound of formula (I) may be dry milled and added to water, containing agents hereinbefore described, to produce the desired end product.

Aerosol formulations comprise a compound of formula (I) and a suitable propellant (for example *n*-butane). A compound of formula (I) may also be dissolved or dispersed in a suitable medium (for example water or a water miscible liquid, such as *n*-propanol) to provide compositions for use in non-pressurised, hand-actuated spray pumps.

A compound of formula (I) may be mixed in the dry state with a pyrotechnic mixture to form a composition suitable for generating, in an enclosed space, a smoke containing the compound.

Capsule suspensions (CS) may be prepared in a manner similar to the preparation of EW formulations but with an additional polymerisation stage such that an aqueous dispersion of oil droplets is obtained, in which each oil droplet is encapsulated by a polymeric shell and contains a compound of formula (I) and, optionally, a carrier or diluent therefor. The polymeric shell may be produced by either an interfacial polycondensation reaction or by a coacervation procedure. The compositions may provide for controlled release of the compound of formula (I) and they may be used for seed treatment. A compound of formula (I) may also be formulated in a biodegradable polymeric matrix to provide a slow, controlled release of the compound.

A composition may include one or more additives to improve the biological performance of the composition (for example by improving wetting, retention or distribution on surfaces; resistance to rain on treated surfaces; or uptake or mobility of a compound of formula (I)). Such additives include surface active agents, spray additives based on oils, for example certain mineral oils or natural plant oils (such as soy bean and rape seed

oil), and blends of these with other bio-enhancing adjuvants (ingredients which may aid or modify the action of a compound of formula (I)).

- A compound of formula (I) may also be formulated for use as a seed treatment, for example as a powder composition, including a powder for dry seed treatment (DS), a water soluble powder (SS) or a water dispersible powder for slurry treatment (WS), or as a liquid composition, including a flowable concentrate (FS), a solution (LS) or a capsule suspension (CS). The preparations of DS, SS, WS, FS and LS compositions are very similar to those of, respectively, DP, SP, WP, SC and DC compositions described above. Compositions for treating seed may include an agent for assisting the adhesion of the composition to the seed (for example a mineral oil or a film-forming barrier). Wetting agents, dispersing agents and emulsifying agents may be SFAs of the cationic, anionic, amphoteric or non-ionic type.
- Suitable SFAs of the cationic type include quaternary ammonium compounds (for example cetyltrimethyl ammonium bromide), imidazolines and amine salts. Suitable anionic SFAs include alkali metals salts of fatty acids, salts of aliphatic monoesters of sulphuric acid (for example sodium lauryl sulphate), salts of sulphonated aromatic compounds (for example sodium dodecylbenzenesulphonate, calcium dodecylbenzenesulphonate, butylnaphthalene sulphonate and mixtures of sodium di-*isopropyl*- and tri-*isopropyl*-naphthalene sulphonates), ether sulphates, alcohol ether sulphates (for example sodium laureth-3-sulphate), ether carboxylates (for example sodium laureth-3-carboxylate), phosphate esters (products from the reaction between one or more fatty alcohols and phosphoric acid (predominately mono-esters) or phosphorus pentoxide (predominately di-esters), for example the reaction between lauryl alcohol and tetraphosphoric acid; additionally these products may be ethoxylated), sulposuccinamates, paraffin or olefin sulphonates, taurates and lignosulphonates. Suitable SFAs of the amphoteric type include betaines, propionates and glycines. Suitable SFAs of the non-ionic type include condensation products of alkylene oxides, such as ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof, with fatty alcohols (such as oleyl alcohol or cetyl alcohol) or with alkylphenols (such as octylphenol, nonylphenol or octylcresol); partial esters derived from long chain fatty acids or hexitol anhydrides; condensation products of said partial esters with ethylene oxide; block polymers (comprising ethylene oxide and propylene oxide); alkanolamides; simple esters (for example fatty acid polyethylene glycol esters); amine oxides (for example lauryl dimethyl amine oxide); and lecithins.

Suitable suspending agents include hydrophilic colloids (such as polysaccharides, polyvinylpyrrolidone or sodium carboxymethylcellulose) and swelling clays (such as bentonite or attapulgite).

5

A compound of formula (I) may be applied by any of the known means of applying fungicidal compounds. For example, it may be applied, formulated or unformulated, to any part of the plant, including the foliage, stems, branches or roots, to the seed before it is planted or to other media in which plants are growing or are to be planted (such as soil surrounding the roots, the soil generally, paddy water or hydroponic culture systems), directly or it may be sprayed on, dusted on, applied by dipping, applied as a cream or paste formulation, applied as a vapour or applied through distribution or incorporation of a composition (such as a granular composition or a composition packed in a water-soluble bag) in soil or an aqueous environment.

15

A compound of formula (I) may also be injected into plants or sprayed onto vegetation using electrodynamic spraying techniques or other low volume methods, or applied by land or aerial irrigation systems.

20 Compositions for use as aqueous preparations (aqueous solutions or dispersions) are generally supplied in the form of a concentrate containing a high proportion of the active ingredient, the concentrate being added to water before use. These concentrates, which may include DCs, SCs, ECs, EWs, MEs, SGs, SPs, WPs, WGs and CSs, are often required to withstand storage for prolonged periods and, after such storage, to be
25 capable of addition to water to form aqueous preparations which remain homogeneous for a sufficient time to enable them to be applied by conventional spray equipment. Such aqueous preparations may contain varying amounts of a compound of formula (I) (for example 0.0001 to 10%, by weight) depending upon the purpose for which they are to be used.

30

A compound of formula (I) may be used in mixtures with fertilisers (for example nitrogen-, potassium- or phosphorus-containing fertilisers). Suitable formulation types include granules of fertiliser. The mixtures suitably contain up to 25% by weight of the compound of formula (I).

35

The invention therefore also provides a fertiliser composition comprising a fertiliser and a compound of formula (I).

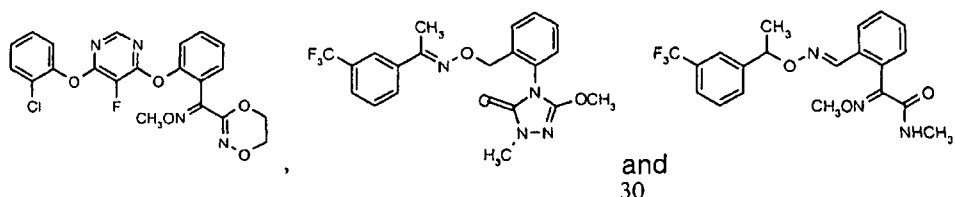
The compositions of this invention may contain other compounds having biological
5 activity, for example micronutrients or compounds having similar or complementary fungicidal activity or which possess plant growth regulating, herbicidal, insecticidal, nematocidal or acaricidal activity.

By including another fungicide, the resulting composition may have a broader spectrum
10 of activity or a greater level of intrinsic activity than the compound of formula (I) alone. Further the other fungicide may have a synergistic effect on the fungicidal activity of the compound of formula (I).

The compound of formula (I) may be the sole active ingredient of the composition or it
15 may be admixed with one or more additional active ingredients such as a pesticide, fungicide, synergist, herbicide or plant growth regulator where appropriate. An additional active ingredient may: provide a composition having a broader spectrum of activity or increased persistence at a locus; synergise the activity or complement the activity (for example by increasing the speed of effect or overcoming repellency) of the compound of
20 formula (I); or help to overcome or prevent the development of resistance to individual components. The particular additional active ingredient will depend upon the intended utility of the composition.

Examples of fungicidal compounds which may be included in the composition of the
25 invention are AC 382042 (*N*-(1-cyano-1,2-dimethylpropyl)-2-(2,4-dichlorophenoxy) pro-
pionamide), acibenzolar-*S*-methyl, alanycarb, aldimorph, anilazine, azaconazole, azafenidin, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, benthiavalicarb, biloxazol, bitertanol, blastidicin *S*, boscalid (new name for nicobifen), bromuconazole, bupirimate, captafol, captan, carbendazim, carbendazim chlorhydrate, carboxin, carpropamid, carvone, CGA
30 41396, CGA 41397, chinomethionate, chlorbenzthiazole, chlorothalonil, chlorozolinate, clozylacon, copper containing compounds such as copper oxychloride, copper oxyquinolate, copper sulphate, copper tallate, and Bordeaux mixture, cyamidazosulfamid, cyazofamid (IKF-916), cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, debacarb, di-2-pyridyl disulphide 1,1'-dioxide, dichlofluanid, diclocymet,
35 diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, difenzoquat, diflumetorim, *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphate, dimefluazole, dimetconazole, dimethirimol,

dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazole, dinocap, dithianon, dodecyl dimethyl ammonium chloride, dodemorph, dodine, doguadine, edifenphos, epoxiconazole, ethaboxam, ethirimol, ethyl (Z)-N-benzyl-N([methyl(methyl-thioethylideneaminoxy-carbonyl)amino]thio)-β-alaninate, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazole, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil (AC 382042), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate, fentin hydroxide, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluoroimide, fluoxastrobin, fluquinconazole, flusilazole, flusulfamide, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetyl-aluminium, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr, guazatine, hexaconazole, hydroxyisoxazole, hymexazole, imazalil, imibenconazole, iminoctadine, iminoctadine triacetate, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isopropanyl butyl carbamate, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl, LY186054, LY211795, LY 248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipyrin, mepronil, metalaxyl, metalaxyl M, metconazole, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, metrafenone, MON65500 (N-allyl-4,5-dimethyl-2-trimethylsilylthiophene-3-carboxamide), myclobutanil, NTN0301, neoasozin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothale-isopropyl, nuarimol, ofurace, organomercury compounds, orysastrobin, oxadixyl, oxasulfuron, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, pefurazoate, penconazole, pencycuron, phenazin oxide, phosphorus acids, phthalide, picoxystrobin, polyoxin D, polyram, probenazole, prochloraz, procymidone, propamocarb, propamocarb hydrochloride, propiconazole, propineb, propionic acid, proquinazid, prothioconazole, pyraclostrobin, pyrazophos, pyrifenoxy, pyrimethanil, pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, quaternary ammonium compounds, quinomethionate, quinoxifen, quintozone, silthiofam (MON 65500), S-imazalil, simeconazole, sipconazole, sodium pentachlorophenate, spiroxamine, streptomycin, sulphur, tebuconazole, tecloftalam, tecnazene, tetraconazole, thiabendazole, thifluzamide, 2-(thiocyanomethylthio)benzothiazole, thiophanate-methyl, thiram, tiadinil, timibenconazole, tolclofos-methyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutil, triazoxide, tricyclazole, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizole, triforine, triticonazole, validamycin A, vapam, vinclozolin, XRD-563, zineb, ziram, zoxamide and the compounds of the formulae:



The compounds of formula (I) may be mixed with soil, peat or other rooting media for the protection of plants against seed-borne, soil-borne or foliar fungal diseases.

Some mixtures may comprise active ingredients, which have significantly different physical, chemical or biological properties such that they do not easily lend themselves to the same conventional formulation type. In these circumstances other formulation types may be prepared. For example, where one active ingredient is a water insoluble solid and the other a water insoluble liquid, it may nevertheless be possible to disperse each active ingredient in the same continuous aqueous phase by dispersing the solid active ingredient as a suspension (using a preparation analogous to that of an SC) but dispersing the liquid active ingredient as an emulsion (using a preparation analogous to that of an EW). The resultant composition is a suspoemulsion (SE) formulation.

10 The invention is illustrated by the following Examples in which the following abbreviations are used:

ml = millilitres

g = grammes

THF = tetrahydrofuran

M⁺ = mass ion

s = singlet

m.p. = melting point (uncorrected)

b.p. = boiling point

DMSO = dimethylsulphoxide

DMF = *N*, *N*-

dimethylformamide

d = doublet

HOBT = 1-hydroxybenzotriazole

HOAT = 7-aza-1-hydroxybenzotriazole

bs = broad singlet

NMR = nuclear magnetic resonance

t = triplet

HPLC = high performance liquid chromatography

q = quartet

TLC = thin layer chromatography

m = multiplet

glc = gas-liquid

chromatography

ppm = parts per million

EDC = 1-ethyl-3-*N,N*-dimethylamino

M = molar

propylcarbodiimide hydrochloride

EXAMPLE 1

This examples illustrates the preparation of 2-(3-Bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-*N*-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide (Compound No. 12 of Table 2)

Stage 1. Preparation of 3-bromo-7-chloro-quinolin-6-ol

Step 1

3-Chloro-4-methoxy aniline (10g) in acetic acid (100ml) was treated with 2,2,3-tribromopropanal (18.8g) and the mixture was stirred at room temperature for 2h after which it was diluted with water and extracted with ethyl acetate. The organic phase was washed with 2N NaOH, dried over sodium sulphate, filtered and evaporated under

reduced pressure to give the desired product, 3-bromo-7-chloro-6-methoxy-quinoline, as a yellow solid after chromatography (silica; hexane/ethyl acetate) (M^+ 274).

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.78 (1H,d); 8.21 (1H,d); 8.10 (1H,s); 7.03 (1H,s).

Step 2

- 5 A mixture of the product from Step 1 (1.4g) and hydrobromic acid (48 wt% solution in water) (100 ml x2) was refluxed for 62 hours. The mixture was cooled to ambient temperature, diluted with water, treated with sodium hydrogen carbonate and extracted with ethyl acetate. The extract was dried over magnesium sulfate, filtered and evaporated under reduced pressure to give the required product, 3-bromo-7-chloro-quinolin-6-ol (M^+ 260). ^1H NMR (DMSO) δ ppm: 7.34 (1H, s); 7.07 (1H, s); 8.60 (1H, d); 8.73 (1H, d); 11.12 (1H, s).

Stage 2: Preparation of (3-Bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid methyl ester

Step 1

- 15 To a stirred solution of methyl (methylthio)acetate (10.8 ml) in dichloromethane (300ml) cooled to -15°C was added dropwise sulphuryl chloride (8.1ml). The mixture was allowed to warm to room temperature over two hours and then concentrated under reduced pressure to give crude chloro-methylsulfanyl-acetic acid methyl ester as a colourless liquid. The product was used in the next step without further purification. ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.33 (3H, s); 3.83 (3H, s); 5.49 (1H,s).

Step 2

- To a stirred solution of 3-bromo-7-chloro-quinolin-6-ol from Stage 1, Step 2 (1.1g) in dry DMF (17ml) containing anhydrous potassium carbonate (3.1g) at ambient temperature was added chloro-methylsulfanyl-acetic acid methyl ester (0.79g) dropwise. The mixture was heated for 1 hour at $60-65^\circ\text{C}$ then cooled to ambient temperature, diluted with water and extracted with ethyl acetate. The extracts were combined, washed with brine, dried over magnesium sulfate, filtered and evaporated under reduced pressure. Purification of the crude material by chromatography (silica; ethyl acetate /hexane 1:4 by volume) provided the title compound, 3-bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid methyl ester (M^+ 378). ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.29 (3H, s); 3.89 (3H, s); 5.74 (1H, s) 7.18 (1H,8); 8.16 (1H, s); 8.23 (1H, s); 8.82 (1H, s).

Stage 3: Preparation of (3-Bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid

- To a stirred solution of the product from Stage 2, Step 2 (1.1 g) in ethanol (14ml) at ambient temperature was added a solution of 2N sodium hydroxide in water (2.2ml). The mixture was stirred at room temperature for 1 hour and then poured into ice-water and acidified with 2M hydrochloric acid. The resulting precipitate was filtered from solution,

washed with cold water and dried *in vacuo* to give (3-bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid (M+ 364). ¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ ppm: 2.20 (3H, s); 6.18 (1H, s) 7.57 (1H, s); 8.19 (1H, s); 8.28 (1H, d); 8.88 (1H, d); 13.7 (1H, bs).

Stage 4: Preparation of 2-(3-Bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-

5 methylsulfanyl-acetamide

The product from Stage 3 above, (3-bromo-7-chloro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid (85 mg) from in dry N,N-dimethylformamide (2ml) was treated with *t*-butylamine (17 mg), N-(3-dimethylamino-propyl)-N'-ethyl carbodiimide hydrochloride (45 mg), HOAt (32 mg) and triethylamine (24 mg) at ambient temperature with stirring for 3
10 hours. The mixture was poured into water, extracted with ethyl acetate (three times) and the extracts combined, washed with saturated aqueous sodium carbonate solution, water (three times) then dried over magnesium sulfate, filtered and evaporated under reduced pressure to give an oil. The oil was fractionated by chromatography (silica; hexane/ ethyl acetate, 3:1 by volume) to give the required product as a white solid (m.p.
15 172-174°C, M+ 419). ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.46 (9H, s); 2.18 (3H, s); 5.63 (1H, s); 6.89 (1H, bs); 7.28 (1H,s); 7.28 (1H, s); 8.18 (1H, s), 8.27 (1H, d); 8.83 (1H, d).

The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 238 of Table 2: using 1,1-dimethyl-prop-2-ynylamine, m.p. 169-171°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.75 (6H,s); 2.19 (3H, s); 2.41 (1H, s); 5.69 (1H, s); 7.16 (1H,
20 bs); 7.29 (1H, s); 8.18 (1H, s); 8.27 (1H, d); 8.83 (1H, d).

Compound No. 52 of Table 2: using 2-amino-3-methoxy-2-methyl-propionitrile, ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 1.82 and 1.84 (3H, 2xs); 2.18 and 2.20 (3H, 2xs); 3.52 and 3.53 (3H, 2xs); 3.64-3.84 (2H, 2xdd); 5.76 and 5.77 (1H, 2xs); 7.29 and 7.30 (1H, 2xs); 7.59 and 7.61 (1H, 2xbs); 8.18 (1H, s); 8.29 (1H, d); 8.85 (1H, s).

25 Compound No. 244 of Table 2: using 1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 160-162°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.71 (6H,s); 1.83 (3H, s); 2.19 (3H, s); 5.66 (1H, s); 7.15 (1H, bs); 7.27 (1H, s); 8.18 (1H, s); 8.27 (1H, d); 8.83 (1H, d).

Compound No. 251 of Table 2: using 4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 124-125°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.75 (6H,s); 2.19 (3H, s); 3.39 (3H, s); 4.13 (2H, s);
30 5.67 (1H, s); 7.17 (1H, bs); 7.28 (1H, s); 8.18 (1H, s); 8.28 (1H, d); 8.84 (1H, d).

EXAMPLE 2

This examples illustrates the preparation of 2-(3-Bromo-7-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide (Compound No. 12 of Table 13)

35 Stage 1. Preparation of 3-bromo-7-methyl-quinolin-6-ol

4-Amino-2-methyl-phenol (5g) in acetic acid (60ml) was treated with 2,2,3-tribromopropanal (11.9g) and the mixture was stirred at room temperature for 3h after which it was diluted with water and extracted with ethyl acetate. The organic phase was washed with aqueous NH_4OH , dried over sodium sulphate, filtered and evaporated under reduced pressure to give the required product, 3-bromo-7-methyl-6-quinolin-6-ol which was used as such in the following step (M^+ 240), ^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2.32 (3H, s); 7.12 (1H, s); 7.75 (1H, s); 8.46 (1H, d); 8.64 (1H, d); 10.35 (1H, bs).

Stage 2: Preparation of methyl 3-bromo-7-methyl-quinolinyl-6-oxy-2-methylthioacetate

In a similar procedure to Stage 2, Step 2 of Example 1, 3-bromo-7-methyl-quinolin-6-ol was reacted with methyl 2-bromo-2-methylthioacetate to give methyl 3-bromo-7-methyl-quinolinyl-6-oxy-2-methylthio-acetate (M^+ 358). ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 2.25 (3H, s); 2.50 (3H, s); 3.88 (3H, s); 5.73 (1H, s); 6.99 (1H, s); 7.86 (1H, s); 8.19 (1H, d), 8.76 (1H, d).

Stage 3: Preparation of (3-Bromo-7-methyl-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid

In a similar procedure to Stage 3 of Example 1, methyl 3-bromo-7-methyl-quinolinyl-6-oxy-2-methylthio-acetate was hydrolysed to give (3-bromo-7-methyl-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid (M^+ 344). ^1H NMR (DMSO) δ ppm: 2.19 (3H, s); 2.42 (3H, s); 6.07 (1H, s); 7.42 (1H, s); 7.86 (1H, s); 8.52 (1H, s), 8.78 (1H, s), 13.55 (1H, bs).

Stage 4: Preparation of 2-(3-Bromo-7-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-

methylsulfanyl-acetamide

In a similar procedure to Stage 4 of Example 1, 2-(3-bromo-7-methyl-quinolinyl-6-oxy)-2-methylthioacetic acid was condensed with t-butylamine to give 2-(3-bromo-7-methyl-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide (m.p. 132-134°C, M^+ 344). ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.44 (9H, s); 2.19 (3H, s); 2.49 (3H, s); 5.60 (1H, s); 6.48 (1H, bs); 7.10 (1H, s); 7.89 (1H, s); 8.21 (1H, d), 8.78 (1H, d).

The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 16 of Table 13: using 1,1-dimethyl-propylamine, m.p. 135-137°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 0.88 (3H, t); 1.39 (6H, s); 1.79 (2H, q); 2.20 (3H, s); 2.48 (3H, s); 5.59 (1H, s); 6.39 (1H, bs); 7.10 (1H, s); 7.89 (1H, s); 8.21 (1H, d); 8.78 (1H, d).

Compound No. 238 of Table 13: using 1,1-dimethyl-prop-2-ynylamine, m.p. 141-146°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.74 (6H, s); 2.19 (3H, s); 2.41 (1H, s); 2.50 (3H, s); 5.65 (1H, s); 6.77 (1H, bs); 7.10 (1H, s); 7.89 (1H, s); 8.21 (1H, d); 8.78 (1H, d).

Compound No. 52 of Table 13: using 2-amino-3-methoxy-2-methyl-propionitrile, ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 1.81 and 1.83 (3H, 2xs); 2.20 and 2.21

(3H, 2xs); 2.48 (3H, s); 3.50 and 3.53 (3H, 2xs); 3.61-3.82 (2H, 2xdd); 5.72 and 5.75 (1H, 2xs); 7.11 and 7.13 (1H, 2xs);

7.32 and 7.34 (1H, 2xbs); 7.90 (1H, s); 8.23 (1H, s); 8.79 (1H, s).

Compound No. 221 of Table 13: using 1,1-dimethyl-2-prop-2-ynyloxy-ethylamine, m.p.

5 114-116°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.41 (3H,s); 1.44 (3H,s); 2.18 (3H, s); 2.50 (1H, t); 3.54 (2H, dd); 4.19 (2H, d); 5.61 (1H, s); 6.92 (1H, bs); 7.10 (1H, s); 7.88 (1H, s); 8.22 (1H, d); 8.77 (1H, d).

Compound No. 251 of Table 13: using 4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p.

129-132°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.73 (6H, s); 2.20 (3H, s); 2.49 (3H, s); 3.37 (3H, s); 4.11 (2H, s); 5.63 (1H, s); 6.76 (1H, bs); 7.10 (1H, s); 7.89 (1H, s); 8.21 (1H, d); 8.78 (1H, d).

EXAMPLE 3

This examples illustrates the preparation of 2-(3-Bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide (Compound No. 12 of Table 6)

Stage 1. Preparation of 3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-ol

Step 1

In a similar procedure to Step 1, Stage 1 of Example 1, 3-fluoro-4-methoxy-phenylamine (2g) in acetic acid (25ml) was treated with 2,2,3 tribromopropanal (4.2g) to give 3-bromo-7-fluoro-6-methoxy-quinoline (M⁺ 258). ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 4.02 (3H, s); 7.07 (1H, d); 7.75 (1H, d); 8.23 (1H, d); 8.78 (1H, d).

Step 2

In a similar procedure to Step 1, Stage 2 of Example 1, 3-bromo-7-fluoro-6-methoxy-quinoline from the previous step was treated with hydrobromic acid to give 3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-ol (M⁺ 244). ¹H NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 7.35 (1H, d); 7.77 (1H, d); 8.59 (1H, d); 8.74 (1H, d), 10.93 (1H, s).

Stage 2: Preparation of (3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid methyl ester

In a similar procedure to Stage 2, Step 2 of Example 1, 3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-ol from the previous step was reacted with methyl 2-bromo-2-methylthioacetate from Stage 2, Step1 of Example 1, to give methyl 3-bromo-7-fluoro-quinolinyl-6-oxy-2-methylthioacetate (M⁺ 362). ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 2.27 (3H, s); 3.89 (3H, s); 5.77 (1H, s) 7.26 (1H, d); 7.77 (1H, s); 8.23 (1H, s); 8.83 (1H, s).

Stage 3: Preparation of (3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid

35 In a similar procedure to Stage 3 of Example 1, methyl 3-bromo-7-fluoro-quinolinyl-6-oxy-2-methylthio-acetate was hydrolysed to give (3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-

methysulfanyl-acetic acid (M^+ 348). ^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 6.16 (1H, s); 7.71 (1H, d) 7.90 (1H, d); 8.62 (1H, d), 8.88 (1H, d), 13.69 (1H, bs).

Stage 4: Preparation of 2-(3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-2-methysulfanyl-acetamide

- 5 In a similar procedure to Stage 4 of Example 1, 2-(3-bromo-7-fluoro-quinolinyl-6-oxy)-2-methylthioacetic acid was condensed with t-butylamine to give 2-(3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-*tert*-butyl-2-methysulfanyl-acetamide (m.p. 144-145°C, M^+ 403). ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.45 (9H, s); 2.19 (3H, s); 5.62 (1H, s); 6.62 (1H, bs); 7.30 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.26 (1H, d), 8.84 (1H, d).

- 10 The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 238 of Table 6: using 1,1-dimethyl-prop-2-ynylamine, m.p. 167-169°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.75 (6H, s); 2.21 (3H, s); 2.41 (1H, s); 2.50 (3H, s); 5.68 (1H, s); 6.89 (1H, bs); 7.33 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.26 (1H, d); 8.84 (1H, d).

- 15 Compound No. 52 of Table 6: using 2-amino-3-methoxy-2-methyl-propionitrile, ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 1.81 and 1.83 (3H, 2xs); 2.21 and 2.22 (3H, 2xs); 3.52 and 3.54 (3H, 2xs); 3.64-3.84 (2H, 2xdd); 5.75 and 5.76 (1H, 2xs); 7.33-7.36 (2H, m); 7.80 (1H, d); 8.28 (1H, d); 8.85 (1H, d).

- Compound No. 221 of Table 6: using 1,1-Dimethyl-2-prop-2-ynyloxy-ethylamine, m.p. 115-117°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.44 (3H, s); 1.46 (3H, s); 2.20 (3H, s); 2.45 (1H, t); 20 3.61 (2H, dd); 4.20 (2H, d); 5.63 (1H, s); 6.90 (1H, bs); 7.28 (1H, d); 7.78 (1H, d); 8.26 (1H, d); 8.83 (1H, d).

- Compound No. 251 of Table 6: using 4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 115-117°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.74 (6H, s); 2.21 (3H, s); 2.49 (3H, s); 3.38 (3H, s); 4.12 (2H, s); 5.65 (1H, s); 6.88 (1H, bs); 7.31 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.26 (1H, d); 8.84 25 (1H, d).

Compound No. 244 of Table 6: using 1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 130-132°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.83 (3H, s); 2.21 (3H, s); 5.65 (1H, s); 6.86 (1H, bs); 7.31 (1H, d); 7.78 (1H, d); 8.25 (1H, d); 8.84 (1H, d).

- Compound No. 68 of Table 6: using 2-ethoxy-1,1-dimethyl-ethylamine, m.p. 111-113°C; 30 ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.21 (3H, t); 1.43 (H, s); 1.46 (3H, s); 2.20 (3H, s); 3.43 (2H, dd); 3.51-3.58 (2H, m), 5.63 (1H, s); 7.17 (1H, bs); 7.28 (1H, d); 7.78 (1H, d); 8.25 (1H, d); 8.83 (1H, d).

Compound No. 277 of Table 6: using 5-methoxy-1,1-dimethyl-pent-2-ynylamine, m.p. 104-106°C; ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.71 (6H, s); 2.20 (3H, s); 2.48 (2H, t); 3.37 (3H, s);

3.50 (2H, t); (5.65 (1H, s); 6.88 (1H, bs); 7.31 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.26 (1H, d); 8.84 (1H, d).

Compound No. 256 of Table 6: using 6-chloro-1,1-dimethyl-hex-2-ynylamine, m.p. 95-97°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.96 (2H, quin), 2.20 (3H, s); 2.90 (2H, t);
5 3.68 (2H, t); 3.50 (2H, t); 5.66 (1H, s); 6.87 (1H, bs); 7.31 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.26 (1H, d); 8.84 (1H, d).

EXAMPLE 4

This examples illustrates the preparation of 2-(3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide (Compound No. 12 of Table 7)

Stage 1: Preparation of 3-iodo-6-hydroxyquinoline

To a stirred mixture of 3-bromo-7-fluoro-6-hydroxyquinoline from Example 3, Stage 1, Step 2 (0.50g), sodium iodide (0.62g) and copper iodide (0.08g) in dioxane (3.0ml) was added N,N,N',N'-tetramethyl-ethane-1,2-diamine (0.07g) in a sealed tube. The mixture
15 was stirred at 120°C for 14h and upon cooling was treated with aqueous ammonia followed by aqueous hydrochloric acid. Extraction with ethyl acetate, drying of the organic phase over magnesium sulphate, filtration and evaporation under reduced pressure gave the required product (M⁺ 290) as a light brown coloured powder that was used as such in the next step. ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 7.30 (1H, d); 7.72 (1H, d); 8.02
20 (1H,d), 8.73 (1H,d); 8.83 (1H, d), 10.88 (1H, s).

Stage 2: Preparation of N-tert-Butyl-2-(3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-2-methylsulfanyl-acetamide

In a similar procedure to Stage 2, Step 1 of Example 1, 3-iodo-7-fluoro-6-hydroxy-quinoline was reacted with chloromethylsulfanyl-acetic acid ethyl ester to give (3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid ethyl ester (M⁺ 408).

In a similar procedure to Stage 3 of Example 1, (3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid ethyl ester was hydrolysed to give (3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid (M⁺ 394).

In a similar procedure to Stage 4 of Example 1, (3-iodo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-methylsulfanyl-acetic acid was condensed with t-butylamine to give N-tert-butyl-2-(3-iodo-quinolin-6-yloxy)-2-methylsulfanyl-acetamide as a white solid (m.p. 165-166°C, M⁺ 449).

¹H NMR (CDCl₃)δ ppm: 1.44 (9H,s); 2.18 (3H,s); 5.60 (1H,s); 6.62 (1H, bs); 7.27 (1H,d); 7.76 (1H,dd); 8.47 (1H, d); 8.97 (1H, d).

35 The following amides were prepared using a similar procedure.

Compound No. 238 of Table 7: using 1,1-dimethyl-prop-2-ynylamine, m.p. 150-152°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.75 (6H, s); 2.20 (3H, s); 2.40 (1H, s); 5.66 (1H, s); 6.88 (1H, bs); 7.27 (1H, s); 7.77 (1H, s); 8.47 (1H, d); 8.97 (1H, d).

Compound No. 52 of Table 7: using 2-amino-3-methoxy-2-methyl-propionitrile, ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: diastereoisomeric mixture (1/1); 1.82 and 1.84 (3H, 2xs); 2.20 and 2.22 (3H, 2xs); 3.53 and 3.54 (3H, 2xs); 3.64-3.84 (2H, 2xdd); 5.73 and 5.75 (1H, 2xs); 7.27-7.36 (3H, m); 7.77 (1H, d); 8.49 (1H, d); 8.98 (1H, s).

Compound No. 244 of Table 7: using 1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 142-145°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.70 (6H, s); 1.83 (3H, s); 2.20 (3H, s); 5.64 (1H, s); 6.87 (1H, bs); 7.27 (1H, d); 7.76 (1H, d); 8.47 (1H, d); 8.96 (1H, d).

Compound No. 251 of Table 7: using 4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynylamine, m.p. 110-112°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.74 (6H, s); 2.20 (3H, s); 3.38 (3H, s); 4.13 (2H, s); 5.65 (1H, s); 6.89 (1H, bs); 7.27 (1H, d); 7.78 (1H, d); 8.47 (1H, d); 8.97 (1H, d).

EXAMPLE 5

This examples illustrates the preparation of N-tert-butyl-2-(7-fluoro-3-thiophen-3-yl-quinolin-6-yloxy)-2-methylsulfanyl-acetamide (Compound No. 12 of Table 30).

Stage 1: A stirred mixture of 2-(3-bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-tert-butyl-2-methylsulfanyl-acetamide from Example 3, Stage 4 (160mg), bis(triphenylphosphine)palladium (II) chloride (1.4 mg), 3-thiophene boronic acid (56mg) and sodium hydrogen carbonate (101mg) in dioxane/water (1:1 mixture, 4.8ml) was heated to 70°C for 14h. Upon cooling, the reaction mixture was treated with saturated aqueous sodium hydrogen carbonate (5ml). Extraction with ethyl acetate, drying of the organic phase over magnesium sulphate, filtration and evaporation under reduced pressure gave the crude product which was fractionated by chromatography (silica; hexane/ ethyl acetate, 2:1 by volume) to give the required product as a white solid (m.p. 170-173°C, M+ 405). ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.46 (9H, s); 2.20 (3H, s); 5.64 (1H, s); 6.66 (1H, bs); 7.42 (1H, d); 7.51 (2H, m); 7.66 (1H, m), 7.80 (1H, d), 8.22 (1H, d); 9.13 (1H, d).

The following amide was prepared using a similar procedure. 2-(7-Fluoro-3-thiophen-3-yl-quinolin-6-yloxy)-N-(4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynyl)-2-methyl-sulfanyl-acetamide (Compound No. 251 of Table 30) m.p. 132-134°C; ¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.75 (6H, s); 2.22 (3H, s); 3.39 (3H, s); 4.13 (2H, s); 5.68 (1H, s); 6.93 (1H, bs); 7.42 (1H, d); 7.51

(2H, m); 7.66 (1H, m), 7.82 (1H, d), 8.22 (1H, d); 9.13 (1H, d). prepared from 2-(3-Bromo-7-fluoro-quinolin-6-yloxy)-N-(4-methoxy-1,1-dimethyl-but-2-ynyl)-2-methylsulfanyl-acetamide from Example 3, stage 4, above.

5

EXAMPLE 6

This Example illustrates the fungicidal properties of compounds of formula (I).

The compounds were tested in a leaf disk assay, with methods described below. The test compounds were dissolved in DMSO and diluted into water to 200 ppm. In the case of the test on *Pythium ultimum*, they were dissolved in DMSO and diluted into water to 20 ppm.

10

Erysiphe graminis f.sp. tritici (wheat powdery mildew): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

15

Puccinia recondita f.sp. tritici (wheat brown rust): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed nine days after inoculation as preventive fungicidal activity.

20

Septoria nodorum (wheat glume blotch): Wheat leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

25

Pyrenophora teres (barley net blotch): Barley leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

30

35

Pyricularia oryzae (rice blast): Rice leaf segments were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Botrytis cinerea (grey mould): Bean leaf disks were placed on agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Phytophthora infestans (late blight of potato on tomato): Tomato leaf disks were placed on water agar in a 24-well plate and sprayed with a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed four days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Plasmopara viticola (downy mildew of grapevine): Grapevine leaf disks were placed on agar in a 24-well plate and sprayed a solution of the test compound. After allowing to dry completely, for between 12 and 24 hours, the leaf disks were inoculated with a spore suspension of the fungus. After appropriate incubation the activity of a compound was assessed seven days after inoculation as preventive fungicidal activity.

Septoria tritici (leaf blotch): Conidia of the fungus from cryogenic storage were directly mixed into nutrient broth (PDB potato dextrose broth). After placing a (DMSO) solution of the test compounds into a microtiter plate (96-well format) the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plates were incubated at 24 C and the inhibition of growth was determined photometrically after 72 hrs.

Fusarium culmorum (root rot): Conidia of the fungus from cryogenic storage were directly mixed into nutrient broth (PDB potato dextrose broth). After placing a (DMSO) solution of the test compounds into a microtiter plate (96-well format) the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plates were incubated at 24 C and the inhibition of growth was determined photometrically after 48 hrs.

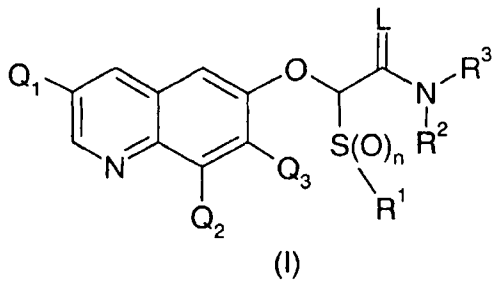
Pythium ultimum (Damping off): Mycelial fragments of the fungus, prepared from a fresh liquid culture, were mixed into potato dextrose broth. A solution of the test compound in dimethyl sulphoxide was diluted with water to 20ppm then placed into a 96-well microtiter plate and the nutrient broth containing the fungal spores was added. The test plate was incubated at 24°C and the inhibition of growth was determined photometrically after 48 hours.

The following compounds (number of compound first, followed by table number in brackets) gave at least 60% control of the following fungal infection at 200ppm:

10 *Plasmopara viticola*, compounds 9 (6), 12 (7), 38 (6), 52 (6), 52 (7), 60 (6), 95 (6), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (7), 238 (10), 244 (6), 244 (7), 251 (2), 251 (7), 251 (10), 251 (13), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 277 (6), 278 (6), *Phytophthora infestans*, compounds 12 (6), 12 (10), 52 (7), 52 (13), 221 (6), 221 (13), 238 (7), 238 (10), 238 (13), 244 (6), 244 (7), 251 (7), 251 (10), 256 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), *Erysiphe graminis f.sp. tritici*,
 15 compounds 9 (6), 12 (6), 12 (13), 28 (6), 38 (6), 52 (6), 52 (7), 52 (13), 68 (6), 86 (6), 181 (6), 189 (6), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 238 (10), 238 (13), 244 (6), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 268 (6), 275 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), 281 (6), 284 (6), *Pyricularia oryzae*, compounds 9 (6), 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 238 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 275 (7), 277 (6), 278 (6), *Puccinia recondita f.sp. tritici*,
 20 compounds 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 238 (7), 251 (2), 264 (6), *Septoria nodorum*, compounds 9 (6), 12 (2), 12 (7), 12 (10), 12 (13), 12 (30), 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 244 (6), 244 (7), 244 (13), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 256 (6), 264 (6), 277 (6), 278 (6), 281 (6), *Septoria tritici*, compounds 9 (6), 12 (6), 12 (7), 12 (13), 16 (13), 38 (6), 52 (2), 52 (6), 52 (7), 52 (13), 68 (6), 95 (6), 122 (6), 221 (6), 221 (13), 224 (6), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 238 (13), 244 (2), 244 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 251 (2), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 268 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), 281 (6), 284 (6), 287 (6), 291 (6), *Fusarium culmorum*, compounds 9 (6), 12 (6), 12 (7), 221 (6), 238 (6), 238 (7), 244 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 284 (6), The following compounds (number of compound first, followed by table number in brackets)
 25 gave at least 60% control of the following fungal infection at 20ppm: *Pythium ultimum*, compounds 9 (6), 12 (10), 52 (6), 52 (13), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (6), 244 (6), 251 (6), 251 (10), 251 (13), 251 (30), 264 (6), 275 (7), 278 (6), 281 (6).

CLAIMS

1. A compound of the general formula I



wherein

Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are halogen, cyano, nitro, azido, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, optionally substituted C₃₋₆ heterocyclyl, which contains at least one heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR⁰, where R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, optionally substituted C₂₋₆ alkynyl, optionally substituted C₁₋₆ alkoxy, optionally substituted C₂₋₆ alkenyloxy, optionally substituted C₂₋₆ alkynyloxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted aryl(C₁₋₆)alkyl, optionally substituted aryl(C₁₋₆)alkoxy, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroaryl(C₁₋₆)alkyl, optionally substituted heteroaryl(C₁₋₆)alkoxy, -SF₅ or -S(O)_u(C₁₋₆)alkyl, wherein u is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, or

Q¹, Q² and Q³, independently of each other, are -CONR^uR^v, -COR^u, -CO₂R^u, -CR^u=NR^v, -NR^uR^v, -NR^uCOR^v, -NR^uCO₂R^v, -SO₂NR^uR^v or -NR^uSO₂R^w, wherein R^w is optionally substituted C₁₋₆ alkyl and R^u and R^v, independently of each other, are hydrogen or C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of -CONR^uR^v or -SO₂NR^uR^v, R^uR^v may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, or, in the case of -CR^u=NR^v, R^v is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy, optionally substituted aryloxy or optionally substituted heteroaryloxy, or

Q¹ and Q², independently of each other, additionally denote hydrogen,

- R¹ is optionally substituted C₁₋₄ alkyl, optionally substituted C₂₋₄ alkenyl, optionally substituted C₂₋₄ alkynyl or optionally substituted C₃₋₄ cycloalkyl,
- R² is hydrogen, C₁₋₈ alkyl, C₃₋₄ cycloalkyl, C₂₋₈ alkenyl, cyano, hydroxy, alkoxy, cyano(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkyl, C₁₋₄ alkoxy(C₁₋₄)alkoxy(C₁₋₄)alkyl or
- 5 benzyloxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the phenyl ring is optionally substituted with C₁₋₄ alkoxy, R³ is -(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR⁴, wherein
- R^a, R^b, R^c, R^d, R^e and R^f, independently of each other, are hydrogen, C₁₋₄ alkyl, halogen, cyano, hydroxy, C₁₋₄ alkoxy or C₁₋₄ alkoxycarbonyl, or
- R^aR^b, R^cR^d or R^eR^f may join to form a 3 to 8 membered carbocyclic or heterocyclic ring
- 10 containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen and NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl,
- X is (CO), (CO)O, O(CO), O, S(O)_t, wherein t is 0, 1 or 2, or X is NH or N(C₁₋₆)alkyl, p, r and s, independently of each other, are 0 or 1,
- q is 0, 1 or 2,
- 15 R⁴ is optionally substituted C₁₋₆ alkyl, optionally substituted C₂₋₆ alkenyl, -CR^{uu}=NR^{vv}, wherein R^{uu} is hydrogen or C₁₋₆ alkyl and R^{vv} is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy, optionally substituted aryloxy or optionally substituted heteroaryloxy, or -CH₂-C≡C-R⁵, wherein
- R⁵ is hydrogen, C₁₋₈ alkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)-
- 20 alkylaminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or R⁵ is C₃₋₆ cycloalkyl optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy-(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)alkyl-aminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or
- 25 R⁵ is C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl and/or cycloalkyl moiety is optionally substituted with halogen, hydroxy, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₃ alkoxy(C₁₋₃)alkoxy, cyano, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C₁₋₄)alkylaminocarbonyloxy, tri(C₁₋₄)alkylsilyloxy or -S(O)_g(C₁₋₆)alkyl, wherein g is 0, 1 or 2, or
- R⁵ is optionally substituted aryl, optionally substituted aryl(C₁₋₄)alkyl, optionally
- 30 substituted aryloxy(C₁₋₄)alkyl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted heteroaryl(C₁₋₄)alkyl or optionally substituted heteroaryloxy(C₁₋₄)alkyl, or
- R⁴ is optionally substituted C₃₋₆ cycloalkyl, optionally substituted C₅₋₆ cycloalkenyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or an optionally substituted 5- to 8-membered ring optionally containing a heteroatom selected from sulfur, oxygen
- 35 or NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen or optionally substituted C₁₋₆alkyl, or

- when R^3 is $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, R^2 and R^3 may join to form a 5- or 6-membered ring optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl, mono- or di-
(C_{1-4})alkylaminocarbonyl, and optionally containing a heteroatom selected from sulphur,
oxygen and NR^{00} , wherein R^{00} is C_{1-4} alkyl optionally substituted with halogen, C_{1-6}
5 alkoxy or cyano, or R^{00} is phenyl optionally substituted with nitro, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})-
alkyl, C_{1-4} alkylcarbonyl or heteroaryl, or R^2 and R^3 may join to form an optionally
substituted 6,6-membered bicycle,
 R^3 is $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$, wherein
 R^{30} and R^{40} , independently of each other, are hydrogen, C_{1-6} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}
10 alkoxy(C_{1-3})alkyl, C_{2-3} alkenyl or C_{2-3} alkynyl, or
 R^{30} and R^{40} join with the carbon atom to which they are attached to form a 3 to 6
membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulfur,
oxygen or NR^{000} , wherein R^{000} is hydrogen or C_{1-4} alkyl, where the carbocyclic or
heterocyclic ring is optionally substituted with halo or C_{1-4} alkyl,
15 R^{50} is hydrogen, optionally substituted C_{1-4} alkyl, optionally substituted C_{3-6} cycloalkyl,
optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl containing a heteroatom
selected from sulphur, oxygen or NR^{000} , wherein R^{000} is hydrogen or C_{1-6} alkyl,
L is sulfur or oxygen, and
n is 0, 1 or 2, and
20 salts and N-oxides of the compounds of the formula I.
2. Compounds according to claim 1, wherein Q^2 is hydrogen, Q^1 and Q^3 are as defined in claim 1.
- 25 3. Compounds according to claim 1 wherein Q^1 is halogen, aryl or heteroaryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as defined in claim 1.
4. Compounds according to claim 1 wherein Q^1 is aryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as defined in claim 1.
- 30 5. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 is heteroaryl, Q^2 is hydrogen and Q^3 is as defined in claim 1.
6. Compounds according to claim 1, wherein Q^1 and Q^3 are halogen and Q^2 is
35 hydrogen.

7. Compounds according to claim 1 wherein, Q¹ is aryl or heteroaryl, Q² is hydrogen and Q³ is halogen.

8. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ and Q² are hydrogen and Q³ is halogen
5 or optionally substituted alkyl.

9. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is halogen, Q² is hydrogen and Q³ is optionally substituted alkyl.

10 10. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ and Q² are halogen and Q³ is optionally substituted alkyl.

11. Compounds according to claim 1 wherein Q¹ is bromo.

15 12. Compounds according to claim 1 wherein Q¹ is iodo.

13. Compounds according to claim 1 wherein Q¹ is chloro.

14. Compounds according to claim 1 wherein Q¹ is fluoro.

20

15. Compounds according to claim 1 wherein Q³ is halogen.

16. Compounds according to claim 1 wherein Q³ is fluorine.

25 17. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is bromo, Q² is hydrogen and Q³ is fluoro.

18. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is bromo, Q² is hydrogen and Q³ is chloro.

30

19. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is iodo, Q² is hydrogen and Q³ is fluoro.

20. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is iodo, Q² is hydrogen and Q³ is
35 chloro.

21. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is hydrogen, halogen, aryl or heteroaryl.

22. Compounds according to claim 1, wherein R¹ is C₁₋₄ alkyl or halo(C₁₋₄)alkyl.

5

23. Compounds according to claim 1, wherein R¹ is methyl.

24. Compounds according to claim 1, wherein R¹ is ethyl.

10

25. Compounds according to claim 1, wherein R² is hydrogen or methyl.

26. Compounds according to claim 1, wherein R² is hydrogen.

15

27. Compounds according to claim 1, wherein Q¹, Q² and Q³ are halogen.

28. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is halogen.

20

29. Compounds according to claim 28, wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is chloro.

30. Compounds according to claim 28 wherein Q¹ is halogen, Q² is C₁₋₄alkyl and Q³ is fluoro.

25

31. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is halogen.

30

32. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is chloro.

33. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is halogen, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

35

34. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is bromo, Q² is methyl and Q³ is chloro.

35. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is bromo, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

36. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is iodo, Q² is methyl and Q³ is chloro.

5

37. Compounds according to claim 31, wherein Q¹ is iodo, Q² is methyl and Q³ is fluoro.

38. Compounds according to claim 1, wherein Q¹ is halogen and Q² and Q³ are C₁₋₄alkyl.

10 39. Compounds according to claim 1, wherein R³ is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1,1-dihalo-2-methylprop-2-yl, 1,1,1-trihalo-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkenyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-alkynyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-cyano-2-methylprop-2-yl, 1-alkoxyalkoxy-2-methylprop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1,1-dihalo-3-methylbut-3-yl, 1,1,1-trihalo-3-methylbut-3-yl, 1-alkoxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkenyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-alkynyloxy-3-methylbut-3-yl, 1-cyano-3-methylbut-3-yl, 2-cyanoprop-2-yl, 2-methoxycarbonylprop-2-yl or 2-methylaminocarbonylprop-2-yl, 1-alkylthio-2-methylprop-2-yl, 1-alkylsulphinyl-2-methylprop-2-yl, 1-alkylsulphonyl-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-alkoxyprop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-hydroxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-alkoxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-aryloxyimino]-prop-2-yl, 2-methyl-1-[(E and/or Z)-heteroaryloxyimino]-prop-2-yl, 1-alkoxy-prop-2-yl, 1-halo-prop-2-yl, 3-methyl-but-1-yn-3-yl, 1-alkyl-3-methyl-but-1-yn-3-yl, 4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-hydroxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxyalkoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-alkoxyalkoxyalkyl-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-cyanoalkyl-3-methylbut-3-yl, 1-haloalkyl-3-methylbut-3-yl.

25

40. Compounds according to claim 39, wherein R³ is tert-butyl, 1-halo-2-methylprop-2-yl, 1-fluoro-2-methylprop-2-yl, 1-methoxy-2-methylprop-2-yl, 1-ethoxy-2-methylprop-2-yl, 1-allyloxy-2-methylprop-2-yl, 1-(prop-2-ynyloxy)-2-methylprop-2-yl, 2-cyano-1-ethoxyprop-2-yl, 2-cyano-1-methoxyprop-2-yl, 1-halo-3-methylbut-3-yl, 1-fluoro-3-methylbut-3-yl, 3-methylbut-1-yn-3-yl, 4-methylpent-2-yn-4-yl, 5-methyl-hex-3-yn-5-yl, 1-methoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-allyloxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-propargyloxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl, 1-ethoxy-4-methyl-pent-2-yn-4-yl.

41. Compounds according to claim 1, wherein R⁴ is C₁₋₆alkyl optionally substituted with C₁₋₄alkoxy-(C₁₋₄)alkoxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is

35

is optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino or tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with benzyloxy(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino or tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with C₂₋₆ alkenyloxy or -S(O)_x(C₁₋₆)alkyl, wherein x is 0, 1
 5 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino, -NH(C₁₋₄)alkyl=NOR, wherein R is hydrogen or C₁₋₄alkyl, or wherein the alkyl group is optionally substituted with tri(C₁₋₄)alkylsilyl, or R⁴ is -CR^{uu}=NR^{vv}, wherein R^{uu} is hydrogen or C₁₋₆ alkyl and R^{vv} is hydroxy or optionally substituted C₁₋₆alkoxy.

10 42. Compounds according to claim 1, wherein the optionally substituted aryl and optionally substituted heteroaryl rings or moieties of the R₅ values are optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C₁₋₆ alkyl, halo(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ alkenyl, halo(C₂₋₆)alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, halo(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkoxy, halo(C₁₋₆)alkoxy, C₂₋₆ alkenyloxy, halo(C₂₋₆)alkenyloxy, C₂₋₆ alkynyloxy,
 15 halo(C₂₋₆)alkynyloxy, aryl, aryloxy, aryl(C₁₋₆)alkyl, aryl(C₁₋₆)alkoxy, heteroaryl, heteroaryloxy, heteroaryl(C₁₋₆)alkyl, heteroaryl(C₁₋₆)alkoxy, -SF₅, -S(O)_g(C₁₋₄)alkyl wherein g is 0, 1 or 2 and the alkyl is optionally substituted with halo, or R⁵ is optionally substituted with -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halo, or R⁵ is optionally substituted with -CONR^gR^h, -COR^g, -CO₂R^g, -R^g=NR^h, -NR^gR^h,
 20 -NR^gCOR^h, -NR^gCO₂R^h, -SO₂NR^gR^h or -NR^gSO₂Rⁱ, wherein Rⁱ is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen and R^g and R^h, independently of each other, are hydrogen or C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen, or, in the case of -CONR^gR^h or -SO₂NR^gR^h, R^gR^h may join to form a 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring containing a heteroatom selected from sulphur, oxygen or NR⁰, wherein R⁰ is hydrogen
 25 or optionally substituted C₁₋₆alkyl.

43. Compounds according to claim 1, wherein the optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl or optionally substituted 5- to 8-membered ring R⁴ is optionally substituted with halogen, cyano, nitro, azido, C₁₋₆ alkyl, halo(C₁₋₆)alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl,
 30 C₃₋₆ cycloalkyl(C₁₋₄)alkyl, C₂₋₆ alkenyl, halo(C₂₋₆)alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, halo(C₂₋₆)alkynyl, C₁₋₆ alkoxy, halo(C₁₋₆)alkoxy, C₂₋₆ alkenyloxy, halo(C₂₋₆)alkenyloxy, C₂₋₆ alkynyloxy, halo(C₂₋₆)alkynyloxy, -SF₅, -S(O)_x(C₁₋₆)alkyl, wherein x is 0, 1 or 2 and the alkyl group is optionally substituted with halo, or R⁴ is optionally substituted with -OSO₂(C₁₋₄)alkyl, wherein the alkyl group is optionally substituted with halogen, -CONR^xR^y, -CON(OR^x)R^y,
 35 -COR^x, -CO₂R^x, -CR^x=NR^y, -NR^xR^y, -NR^xCOR^y, -NR^xCO₂R^y, -SO₂NR^xR^y or -NR^xSO₂R^z,

wherein R^2 is C_{1-8} alkyl optionally substituted with halogen and R^x and R^y , independently of each other, are hydrogen or C_{1-6} alkyl optionally substituted with halogen.

44. Compounds according to claim 1, wherein R^{50} is C_{1-4} alkyl optionally substituted with
 5 halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylamino-carbonyloxy, $S(O)_p(C_{1-6})$ -alkyl, wherein p is 0, 1 or 2, triazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, tri(C_{1-4})-alkylsilyloxy, optionally substituted phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy.

10

45. Compounds according to claim 1, wherein R^{50} is C_{3-6} cycloalkyl optionally substituted
 with halogen, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylamino-carbonyloxy, $S(O)_p(C_{1-6})$ -alkyl, wherein p
 is 0, 1 or 2, triazolyl, pyrazolyl, imidazolyl, tri(C_{1-4})-alkylsilyloxy, optionally substituted
 15 phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy,

46. Compounds according to claim 1, wherein the optionally substituted aryl or the
 optionally substituted heteroaryl R^{50} is optionally substituted with halogen, hydroxy,
 20 mercapto, C_{1-4} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, C_{1-4} alkoxy, C_{2-4} alkenyloxy, C_{2-4} alkynyloxy, halo(C_{1-4})alkyl, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, halo(C_{1-4})-alkylthio, hydroxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl-(C_{1-4})alkyl, phenoxy, benzyloxy, benzoyloxy, cyano, isocyano, thiocyanato, isothiocyanato, nitro, NR^pR^q , $NHCOR^p$, $-NHCONR^pR^q$, $CONR^pR^q$, $-SO_2R^o$, OSO_2R^o , COR^p , $CR^p=NR^q$ or $N=CR^pR^q$, wherein R^o
 25 is C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy, and R^p and R^q are independently hydrogen, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups
 30 being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy.

47. Compounds according to claim 1, wherein L is oxygen.

48. Compounds according to claim 1, wherein n is 0.

35

49. A process for preparing a compound of the formula I according to claim 1 as herein described.

50. A fungicidal composition comprising a fungicidally effective amount of a compound
5 according to claim 1 and a suitable carrier or diluent therefor.

51. A method of combating or controlling phytopathogenic fungi which comprises
applying a fungicidally effective amount of a compound according to claim 1 to a plant,
to a seed of a plant, to the locus of the plant or seed or to soil or any other plant growth
10 medium.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/007700

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
INV.	A01N43/42	C07D215/18 C07D401/12 C07D405/12 C07D409/12
	C07D413/12	C07D417/12
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)		
C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)		
EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, BIOSIS, EMBASE		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2004/108663 A (SYNGENTA LTD [GB]; CROWLEY PATRICK JELF [GB]; SALMON ROGER [GB]; SAGEO) 16 December 2004 (2004-12-16) tables 14-30	1-51
A	EP 0 326 331 A (LILLY CO ELI [US] DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 2 August 1989 (1989-08-02) formula (1)	1-51
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance		
"E" earlier document but published on or after the international filing date		
"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)		
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
"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		
"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		
"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.		
"&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
10 December 2007		28/12/2007
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer James, Sonya

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2007/007700

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2004108663 A	16-12-2004	AU 2004245282 A1	16-12-2004
		BR PI0410995 A	04-07-2006
		CA 2527313 A1	16-12-2004
		CN 1812966 A	02-08-2006
		EP 1638928 A1	29-03-2006
		JP 2006526600 T	24-11-2006
		KR 20060017631 A	24-02-2006
		MX PA05013039 A	02-03-2006
		US 2007042996 A1	22-02-2007
EP 0326331 A	02-08-1989	AT 216369 T	15-05-2002
		AU 2874689 A	03-08-1989
		BR 8900364 A	19-09-1989
		CA 1335995 C	20-06-1995
		CN 1034717 A	16-08-1989
		DE 68929391 D1	23-05-2002
		DE 68929391 T2	14-11-2002
		DK 37189 A	30-07-1989
		EG 18804 A	29-09-1994
		ES 2171388 T3	16-09-2002
		FI 890424 A	30-07-1989
		HU 49788 A2	28-11-1989
		IE 890263 L	29-07-1989
		IE 890264 L	29-07-1989
		IE 890265 L	29-07-1989
		IE 890266 L	29-07-1989
		IL 89026 A	21-02-1993
		JP 1246266 A	02-10-1989
		JP 2675119 B2	12-11-1997
		NZ 227732 A	26-10-1990
		TR 28787 A	11-03-1997
		ZA 8900627 A	27-12-1989

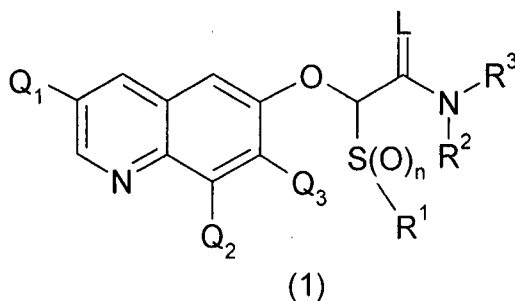
FUNGICIDAS

Esta invención se refiere a nuevas amidas de ácido quinoliniloxialcanoico, procesos para prepararlas, a composiciones que las contienen y a sus métodos de uso para combatir hongos, especialmente infecciones de las plantas causadas por hongos.

Ciertos derivados de amidas de ácido quinoliniloxialcanoico y su uso como bactericidas en agricultura y horticultura se dan a conocer, por ejemplo, en las WO 04/047538 y JP 2001-89453.

La presente invención está relacionada con la provisión de amidas de ácido quinolin-6-iloxialcanoico sustituidas particulares para usar principalmente como fungicidas vegetales.

Así, de acuerdo con la presente invención se proporciona un compuesto de la Fórmula General I



donde

Q^1 , Q^2 y Q^3 , independientemente uno del otro, son halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, heterociclilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, que contiene por lo menos un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^0 , donde R^0 es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}) opcionalmente

sustituido, alqueno(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alquino(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, alqueno(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alquino(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, arilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilalcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroarilalcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, heteroarilalquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, heteroarilalcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, -SF₅ o -S(O)_ualquilo(C₁₋₆), donde u es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q¹, Q² y Q³, independientemente uno del otro, son -OSO₂alquilo(C₁₋₄), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q¹, Q² y Q³, independientemente uno del otro, son -CONR^uR^v, -COR^u, -CO₂R^u, -CR^u=NR^v, -NR^uR^v, -NR^uCOR^v, -NR^uCO₂R^v, -SO₂NR^uR^v o -NR^uSO₂R^w, donde R^w es alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido y R^u y R^v, independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido con halógeno, o, en el caso de -CONR^uR^v o -SO₂NR^uR^v, R^uR^v se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, o, en el caso de -CR^u=NR^v, R^v es hidroxilo o alcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido o heteroarilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, o

Q¹ y Q², independientemente uno del otro, indican además hidrógeno,

R¹ es alquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, alqueno(C₂₋₄) opcionalmente sustituido, alquino(C₂₋₄) opcionalmente sustituido o cicloalquilo(C₃₋₄) opcionalmente sustituido,

R^2 es hidrógeno, alquilo(C_{1-8}), cicloalquilo(C_{3-4}), alqueno(C_{2-8}), ciano, hidroxilo, alcoxi, cianoalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}) alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o benciloxialquilo(C_{1-4}), donde el anillo fenilo está opcionalmente sustituido con alcoxi(C_{1-4}),

R^3 es $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, donde

R^a , R^b , R^c , R^d , R^e y R^f , independientemente uno del otro, son hidrógeno, alquilo(C_{1-4}), halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi(C_{1-4}) o alcóxicarbonilo(C_{1-4}), o

R^aR^b , R^cR^d o R^eR^f se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 8 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o , donde R^o es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido,

X es (CO) , $(CO)O$, $O(CO)$, O , $S(O)_t$, donde t es 0, 1 o 2, o X es NH o N alquilo(C_{1-6}),

p , r y s , independientemente uno del otro, son 0 o 1,

q es 0, 1 o 2,

R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, $-CR^{uu}=NR^{vv}$, donde R^{uu} es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) y R^{vv} es hidroxilo o alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o $-CH_2-C\equiv C-R^5$, donde

R^5 es hidrógeno, alquilo(C_{1-8}) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C_{1-6}), alcoxi(C_{1-3})alcoxi(C_{1-3}), ciano, alquilo(C_{1-4})carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C_{1-4})aminocarbonilo, trialquilo(C_{1-4})sililo o $-S(O)_g$ alquilo(C_{1-6}), donde g es 0, 1 o 2, o R^5 es cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido con

halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquilo(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialquilo(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o

R⁵ es cicloalquilo(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₄), donde la porción alquilo y/o cicloalquilo está opcionalmente sustituida con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquilo(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialquilo(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o

R⁵ es arilo opcionalmente sustituido, arilalquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, ariloxialquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroarilalquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido o heteroariloxialquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, o

R⁴ es cicloalquilo(C₃₋₆) opcionalmente sustituido, cicloalqueno(C₅₋₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o un anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, o

cuando R³ es -(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR⁴, R² y R³ se pueden unir para formar un anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo(C₁₋₄), mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, y que opcionalmente contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^{oo}, donde R^{oo} es alquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi(C₁₋₆) o ciano, o R^{oo} es fenilo opcionalmente sustituido con nitro, alquilo(C₁₋₄), haloalquilo(C₁₋₄), alquilo(C₁₋₄) carbonilo o heteroarilo, o R² y R³ se pueden unir para formar un biciclo de 6,6 miembros opcionalmente sustituido,

R^3 es $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$, donde

R^{30} y R^{40} , independientemente uno del otro, son hidrógeno, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo (C_{1-3}), alquenilo (C_{2-3}) o alquinilo (C_{2-3}), o

R^{30} y R^{40} se unen con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^{000} , donde R^{000} es hidrógeno o alquilo(C_{1-4}), donde el anillo carbocíclico o heterocíclico está opcionalmente sustituido con halo o alquilo(C_{1-4}),

R^{50} es hidrógeno, alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^{000} , donde R^{000} es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}),

L es azufre u oxígeno, y

n es 0, 1 o 2, y

sales y N-óxidos de los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos de la invención contienen por lo menos un átomo de carbono asimétrico y pueden existir como enantiómeros (o como pares de diastereoisómeros) o como mezclas de los mismos. Además, cuando n es 1, los compuestos de la invención son sulfóxidos, que pueden existir en dos formas enantioméricas, y el carbono adyacente puede también existir en dos formas enantioméricas. Los compuestos de Fórmula General (I) por lo tanto pueden existir como racematos, diastereoisómeros, o enantiómeros simples, y la invención incluye todos los isómeros posibles o mezclas de isómeros en cualquier proporción. Se cree que para cualquier compuesto dado, un isómero puede ser más activo como fungicida que otro.

Los N-óxidos de los compuestos de la Fórmula I preferentemente indican los N-óxidos formados por la porción quinolina.

Las sales que los compuestos de la Fórmula I pueden formar son preferentemente aquellas formadas por la interacción de estos compuestos con ácidos. El término "ácido" comprende ácidos minerales tales como haluros de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, etc., así como ácidos orgánicos, de preferencia los ácidos alcanóicos comúnmente usados, por ejemplo ácido fórmico, ácido acético y ácido propiónico.

Excepto cuando se indique lo contrario, los grupos alquilo y las porciones alquilo de alcoxi, alquiltio, etc., es adecuado que contengan de 1 a 6, normalmente de 1 a 4, átomos de carbono en forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos son metilo, etilo, n- e iso-propilo y n-, sec-, iso- y terc-butilo. Cuando las porciones alquilo contienen 5 o 6 átomos de carbono, ejemplos son n-pentilo y n-hexilo. Entre los ejemplos adecuados de sustituyentes opcionales de grupos y porciones alquilo se incluyen halo, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₄) y alcoxi(C₁₋₄)alcoxi(C₁₋₄), ciano, arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido. Donde el sustituyente opcional es halo, el grupo o porción haloalquilo es habitualmente monoclorometilo, monofluormetilo, diclorometilo, difluormetilo, triclorometilo o trifluorometilo.

Excepto cuando se indique lo contrario, las porciones alqueno y alquino también contienen convenientemente de 2 a 6, normalmente de 2 a 4, átomos de carbono en forma de cadenas rectas o ramificadas. Ejemplos son alilo, etinilo y propargilo. Entre los sustituyentes opcionales se incluyen halo, alcoxi, arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido.

Halo incluye flúor, cloro, bromo y yodo.

Arilo es generalmente fenilo pero también incluye naftilo, antrilo y fenantrilo.

Heteroarilo es habitualmente un anillo aromático de 5 o 6 miembros que contiene una o más porciones azufre, oxígeno o NR como heteroátomos, que pueden estar fusionadas a uno o más de otros anillos aromáticos o heteroaromáticos, tales como un anillo benceno. Ejemplos son grupos tienilo, furilo, pirrolilo, isoxazolilo, oxazolilo, tiazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, isotiazolilo, tetrazolilo, tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, benzofuranilo, benzotienilo, dibenzofuranilo, dibenzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, bencimidazolilo, indolilo, quinolilo, isoquinolilo, quinazolinilo y quinoxalinilo y, cuando corresponda, N-óxidos y sales de los mismos. Cualquier de los valores arilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido. Excepto cuando se indique lo contrario, los sustituyentes que pueden estar presentes incluyen uno o más de los siguientes: halo, hidroxilo, mercapto, alquilo(C₁₋₆) (especialmente metilo y etilo), alquenilo(C₂₋₆) (especialmente alilo), alquinilo(C₂₋₆) (especialmente propargilo), alcoxi(C₁₋₆) (especialmente metoxi), alqueniloxi(C₂₋₆) (especialmente aliloxi), alquiniloxi(C₂₋₆) (especialmente propargiloxi), haloalquilo(C₁₋₆) (especialmente trifluormetilo), haloalcoxi(C₁₋₆) (especialmente trifluormetoxi), -S(O)_malquilo(C₁₋₆) donde m es 0, 1 o 2 y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo, hidroxialquilo(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₄)alquilo(C₁₋₄), alcoxi(C₁₋₄)alcoxi(C₁₋₄), cicloalquilo(C₃₋₆), cicloalquilo(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₄), arilo opcionalmente sustituido (especialmente fenilo opcionalmente sustituido), heteroarilo opcionalmente sustituido (especialmente piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituido), ariloxi opcionalmente sustituido (especialmente fenoxi opcionalmente sustituido), heteroariloxi opcionalmente sustituido (especialmente piridiloxi o pirimidiniloxi opcionalmente sustituido),

$-S(O)_m$ arilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente feniltio opcionalmente sustituido), $-S(O)_m$ heteroarilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente piridiltio o pirimidiniltio opcionalmente sustituido), arilalquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente bencilo opcionalmente sustituido, fenetilo opcionalmente sustituido y fenilo n-propilo opcionalmente sustituido) en el cual la porción alquilo está opcionalmente sustituida con hidroxilo, heteroarilalquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente piridil- o pirimidinil-alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), arilalquenilo(C_{2-4}) opcionalmente sustituido (especialmente feniletlenilo opcionalmente sustituido), heteroarilalquenilo(C_{2-4}) opcionalmente sustituido (especialmente piridiletlenilo o pirimidiniletlenilo opcionalmente sustituido), arilalcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente benciloxi y fenetilo opcionalmente sustituido), heteroarilalcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente piridilalcoxi(C_{1-4}) o pirimidinilalcoxi(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), ariloxialquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente fenoximetilo), heteroariloxialquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido (especialmente piridiloxi o pirimidiniloxialquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), $-S(O)_m$ alquilo(C_{1-4})arilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente benciltio y fenetiltio opcionalmente sustituido), $-S(O)_m$ alquilo(C_{1-4})heteroarilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente piridilalquiltio(C_{1-4}) o pirimidinilalquiltio(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), $-alquilo(C_{1-4})S(O)_m$ arilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente feniltiométilo), $alquilo(C_{1-4})S(O)_m$ heteroarilo opcionalmente sustituido donde m es 0, 1 o 2 (especialmente piridiltioalquilo(C_{1-4}) o pirimidiniltioalquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido), aciloxi, incluyendo alcanoiloxi(C_{1-4}) (especialmente acetiloxi) y benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, NR^gR^h , $-NHCOR^g$, $-NHCONR^gR^h$, $-CONR^gR^h$, $-CO_2R^g$, $-SO_2R^i$, $-OSO_2R^i$, $-COR^g$,

$-\text{CR}^g=\text{NR}^h$ o $-\text{N}=\text{CR}^g\text{R}^h$ en los cuales R^i es alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}) y R^g y R^h son independientemente hidrógeno, alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}).

De particular interés son aquellos compuestos de la Fórmula (I), donde Q^2 es hidrógeno, Q^1 y Q^3 son como más arriba.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, arilo o heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como más arriba.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es arilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como se definió anteriormente.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como se definió anteriormente.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 y Q^3 son halógeno y Q^2 es hidrógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es arilo o heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 y Q^2 son hidrógeno y Q^3 es halógeno o alquilo opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es alquilo opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 y Q^2 son halógeno y Q^3 es alquilo opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es bromo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es yodo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^3 es halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es bromo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es bromo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es yodo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es yodo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es hidrógeno, halógeno, arilo o heteroarilo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^1 es alquilo(C_{1-4}) o haloalquilo(C_{1-4}).

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^1 es metilo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^1 es etilo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^2 es hidrógeno o metilo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^2 es hidrógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 , Q^2 y Q^3 son halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es bromo, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es bromo, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es yodo, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es yodo, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde Q^1 es halógeno, Q^2 y Q^3 son alquilo(C_{1-4}).

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^3 es terc-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1,1-dihalo-2-metilprop-2-ilo, 1,1,1-trihalo-2-metilprop-2-ilo, 1-alcoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alqueniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alquiniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-ciano-2-metil-prop-2-ilo, 1-alcoxialcoxi-2-metil-prop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1,1-dihalo-3-metilbut-3-ilo, 1,1,1-trihalo-3-metilbut-3-ilo, 1-alcoxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alqueniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alquiniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-ciano-3-metilbut-3-ilo, 2-cianoprop-2-ilo, 2-metoxycarbonilprop-2-ilo o 2-metilaminocarbonilprop-2-ilo, 1-alquiltio-2-metilprop-2-ilo, 1-alquilsulfinil-2-metilprop-2-ilo, 1-alquilsulfonil-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-alcoxiprop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-hidroxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-alcoxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o

Z)-ariloxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-heteroariloxiimino]-prop-2-ilo, 1-alcoxi-prop-2-ilo, 1-halo-prop-2-ilo, 3-metil-but-1-in-3-ilo, 1-alquil-3-metil-but-1-in-3-ilo, 4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-hidroxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxialcoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxialcoxialquil-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-cianoalquil-3-metilbut-3-ilo, 1-haloalquil-3-metilbut-3-ilo, y más preferiblemente, donde R^3 es terc-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1-fluor-2-metilprop-2-ilo, 1-metoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-etoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-aliloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-(prop-2-iniloxi)-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-etoxi-prop-2-ilo, 2-ciano-1-metoxiprop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1-fluor-3-metilbut-3-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo, 5-metil-hex-3-in-5-ilo, 1-metoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-aliloxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-propargiloxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-etoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino o trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con benciloxialquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino o trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con alqueniloxi(C_{2-6}) o $-S(O)_x$ alquilo(C_{1-6}), donde x es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino, $-NH$ alquilo(C_{1-4})=NOR, donde R es hidrógeno o alquilo(C_{1-4}), o donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es $-CR^{uu}=NR^{vv}$, donde R^{uu} es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) y R^{vv} es hidroxilo o alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde los anillos o porciones arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente

sustituido de valores R_5 están opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-6}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), alquenilo(C_{2-6}), haloalquenilo(C_{2-6}), alquinilo(C_{2-6}), haloalquinilo(C_{2-6}), alcoxi(C_{1-6}), haloalcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi(C_{2-6}), haloalqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi(C_{2-6}), haloalquiniloxi(C_{2-6}), arilo, ariloxi, arilalquilo(C_{1-6}), arilalcoxi(C_{1-6}), heteroarilo, heteroariloxi, heteroarilalquilo(C_{1-6}), heteroarilalcoxi(C_{1-6}), $-SF_5$, $-S(O)_g$ alquilo(C_{1-4}) donde g es 0, 1 o 2 y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^5 está opcionalmente sustituido con $-OSO_2$ alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^5 está opcionalmente sustituido con $-CONR^gR^h$, $-COR^g$, $-CO_2R^g$, $-R^g=NR^h$, $-NR^gR^h$, $-NR^gCOR^h$, $-NR^gCO_2R^h$, $-SO_2NR^gR^h$ o $-NR^gSO_2R^i$, donde R^i es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno y R^g y R^h , independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno, o, en el caso de $-CONR^gR^h$ o $-SO_2NR^gR^h$, R^gR^h se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^o , donde R^o es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde el anillo arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido R^4 está opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-6}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), alquenilo(C_{2-6}), haloalquenilo(C_{2-6}), alquinilo(C_{2-6}), haloalquinilo(C_{2-6}), alcoxi(C_{1-6}), haloalcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi(C_{2-6}), haloalqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi(C_{2-6}), haloalquiniloxi(C_{2-6}), $-SF_5$, $-S(O)_x$ alquilo(C_{1-6}), donde x es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^4 está opcionalmente sustituido con $-OSO_2$ alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con

halógeno, $-\text{CONR}^x\text{R}^y$, $-\text{CON}(\text{OR}^x)\text{R}^y$, $-\text{COR}^x$, $-\text{CO}_2\text{R}^x$, $-\text{CR}^x=\text{NR}^y$, $-\text{NR}^x\text{R}^y$, $-\text{NR}^x\text{COR}^y$, $-\text{NR}^x\text{CO}_2\text{R}^y$, $-\text{SO}_2\text{NR}^x\text{R}^y$ o $-\text{NR}^x\text{SO}_2\text{R}^z$, donde R^z es alquilo(C_{1-8}) opcionalmente sustituido con halógeno y R^x y R^y , independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^{50} es alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C_{1-6}), alqueno(C_{2-6}) (especialmente alilo), alquino(C_{2-6}) (especialmente propargilo), alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4}), ciano, alquilo(C_{1-4})carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di-alquilo(C_{1-4})amino-carbonilo, $\text{S}(\text{O})_p\text{alquilo}(\text{C}_{1-6})$, donde p es 0, 1 o 2, triazolilo, pirazolilo, imidazolilo, trialkilo(C_{1-4})sililo, fenilo opcionalmente sustituido, tienilo opcionalmente sustituido, bencilo opcionalmente sustituido o tienilmetilo opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde R^{50} es cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C_{1-6}), alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4}), ciano, alquilo(C_{1-4})carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di-alquilo(C_{1-4})amino-carbonilo, $\text{S}(\text{O})_p\text{alquilo}(\text{C}_{1-6})$, donde p es 0, 1 o 2, triazolilo, pirazolilo, imidazolilo, trialkilo(C_{1-4})sililo, fenilo opcionalmente sustituido, tienilo opcionalmente sustituido, bencilo opcionalmente sustituido o tienilmetilo opcionalmente sustituido.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde el arilo opcionalmente sustituido o el heteroarilo opcionalmente sustituido R^{50} está opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, mercapto, alquilo(C_{1-4}), alqueno(C_{2-4}), alquino(C_{2-4}), alcoxi(C_{1-4}), alquenoilo(C_{2-4}), alquinoilo(C_{2-4}), haloalquilo(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), hidroxialquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo, bencilo,

benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, NR^pR^q , NHCOR^p , $\text{-NHCONR}^p\text{R}^q$, CONR^pR^q , $\text{-SO}_2\text{R}^o$, OSO_2R^o , COR^p , $\text{CR}^p=\text{NR}^q$ o $\text{N}=\text{CR}^p\text{R}^q$, donde R^o es alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}), y R^p y R^q son independientemente hidrógeno, alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}).

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde L es oxígeno.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son aquellos donde n es 0.

Otro grupo de compuestos preferidos de la Fórmula (I) son los N-óxidos formados por la porción quinolina en los compuestos de la Fórmula I.

Los compuestos que forman parte de la invención se ilustran en las Tablas 1 a 192 a continuación. En los Ejemplos 1 a 5 se indican los puntos de fusión (p.f.) y/o los valores iónicos moleculares de diagnóstico (p. ej. M^+ , $[\text{M}+1]^+$) y/o los datos espectroscópicos (^1H NMR) mientras que las actividades biológicas se indican en el Ejemplo 6.

Tabla 1

Los compuestos de la Tabla 1 son de la Fórmula General (I) donde Q¹ es cloro, Q² es hidrógeno, Q³ es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, y R² y R³ tienen los valores indicados en la tabla.

Compuesto No.	R ²	R ³
1	H	CH ₃
2	CH ₃	CH ₃
3	H	C ₂ H ₅
4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
5	H	prop-2-ilo
6	CH ₃	prop-2-ilo
7	prop-2-ilo	prop-2-ilo
8	CH ₃	n-butilo
9	H	but-2-ilo
10	H	2-metil-prop-1-ilo
11	2-metil-prop-1-ilo	2-metil-prop-1-ilo
12	H	terc-C ₄ H ₉
13	CH ₃	terc-C ₄ H ₉
14	H	pent-2-ilo

15	H	pent-3-ilo
16	H	2-metil-but-2-ilo
17	H	3-metil-but-1-ilo
18	H	3-metil-pent-2-ilo
19	H	4-metil-pent-2-ilo
20	H	3,3-dimetil-but-2-ilo
21	H	2-metil-hex-2-ilo
22	H	2,4-dimetil-pent-2-ilo
23	H	2,4,4-trimetil-but-2-ilo
24	H	2,4,4-trimetil-pent-2-ilo
25	H	Cl-n-C ₃ H ₆ -
26	H	Cl-CH ₂ (CH ₃) ₂ C-
27	H	F ₃ C(CH ₃) ₂ C-
28	H	NC-CH ₂ -
29	CH ₃	NC-CH ₂ -
30	NC-CH ₂ -	NC-CH ₂ -
31	H	(NC) ₂ CH-
32	H	NC-C ₂ H ₄ -
33	CH ₃	NC-C ₂ H ₄ -
34	NC-C ₂ H ₄ -	NC-C ₂ H ₄ -

35	H	$(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CN})-$
36	H	$\text{C}_2\text{H}_5(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CN})-$
37	H	$(\text{C}_2\text{H}_5)_2\text{C}(\text{CN})-$
38	H	$(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CN})-$
39	H	$\text{HO}-\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
40	H	$\text{HO}-\text{C}_2\text{H}_4(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
41	H	1-hidroxi-2-(hidroximetil)-prop-2-ilo
42	H	1-hidroxi-2-(metoximetil)prop-2-ilo
43	H	1-metoksi-2-(metoximetil)prop-2-ilo
44	H	1-hidroxi-2-(hidroximetil)-but-2-ilo
45	$\text{C}_2\text{H}_5\text{OC}_2\text{H}_4-$	$\text{C}_2\text{H}_5\text{OC}_2\text{H}_4-$
46	CH_3	$(\text{CH}_3\text{O})_2\text{CHCH}_2-$
47	H	$\text{CH}_3\text{O}-\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
48	H	$\text{CH}_3\text{O}-\text{C}_2\text{H}_4(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
49	H	$\text{C}_2\text{H}_5\text{O}-\text{C}_2\text{H}_4(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
50	H	$\text{CH}_3\text{S}-\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
51	H	$\text{NC}-(\text{CH}_3\text{O})\text{CH}-$
52	H	$\text{CH}_3\text{OCH}_2(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CN})-$
53	H	$\text{CH}_3\text{SCH}_2(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CN})-$

54	H	$\text{CH}_3(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
55	H	$\text{CH}_3\text{CHBr}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
56	H	$\text{CH}_3(\text{CO})(\text{OH})\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
57	H	$\text{CH}_3\text{OC}_2\text{H}_4(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
58	H	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
59	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})(\text{CH}_3)\text{CH}-$
60	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
61	H	$\text{C}_2\text{H}_5\text{O}(\text{CO})\text{C}_2\text{H}_4-$
62	H	$\text{CH}_3\text{NH}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
63	H	$(\text{CH}_3)_2\text{N}(\text{CO})(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
64	H	$(\text{CH}_3)_3\text{SiCH}_2-$
65	H	$\text{terc-C}_4\text{H}_9(\text{CH}_3)_2\text{SiO-CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
66	H	$\text{terc-C}_4\text{H}_9(\text{CH}_3)_2\text{SiO-}$ $\text{C}_2\text{H}_4(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
67	H	$4\text{-FPhCH}_2\text{OCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
68	H	$\text{C}_2\text{H}_5\text{OCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
69	H	$\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
70	H	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$
71	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$
72	H	$\text{CH}_2=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$

73	H	$\text{CH}_2=\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}-$
74	H	$\text{CH}_2=\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
75	H	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}=\text{CH}-$
76	CH_3	$\text{CH}_3(\text{CO})\text{CH}=\text{CH}-$
77	H	pent-3-en-2-ilo
78	H	2-metil-hex-3-en-2-ilo (E)
79	H	2-metil-hex-3-en-2-ilo (Z)
80	H	2-metil-pent-4-en-3-on-2-ilo
81	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{CO})\overset{\text{^}}{\text{C}}\text{H}=(\text{Cl})\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
82	H	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
83	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OC}_2\text{H}_4-$
84	H	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2-$
85	CH_3	$\text{CH}\equiv\text{CCH}_2-$
86	H	cicloprop-1-ilo
87	$\text{NC}-\text{C}_2\text{H}_4-$	cicloprop-1-ilo
88	cicloprop-1-ilo	cicloprop-1-ilo
89	H	1-ciano-cicloprop-1-ilo
90	H	2-ciano-cicloprop-1-ilo
91	H	1-metoxicarbonil-cicloprop-1-ilo
92	H	1-[N,N-dimetilaminocarbonil]-

		cicloprop-1-ilo
93	H	1-[N-metil-N-metoksi-aminocarbonil]-cicloprop-1-ilo
94	H	1-ciano-1-ciclopropil-et-1-ilo
95	H	ciclopent-1-ilo
96	H	1-ciano-ciclopent-1-ilo
97	H	ciclohex-1-ilo
98	$\text{CH}_2=\text{CHCH}_2-$	ciclohex-1-ilo
99	H	4-ciano-ciclohex-1-ilo
100	H	1-ciano-4-metil-ciclohex-1-ilo
101	H	4-terc-butilo-1-ciano-ciclohex-1-ilo
102	H	2-metil-3-cianotetrahydrofuran-3-ilo
103	H	5-metil-1,3-dioxolan-5-ilo
104	H	5-etil-1,3-dioxolan-5-ilo
105	H	3,5-dimetil-1,3-dioxolan-5-ilo
106	H	N-etoxicarbonil-piperid-4-ilo
107	H	morfolino
108	H	ciclohex-1-il-metilo

109	H	4-ciano-ciclopenten-3-ilo
110	H	5-terc-butil-2H-1,3,4-tiadiazin-2-ilo
111	H	2-(ciclohexan-1-il)-et-1-ilo
112	H	fur-2-ilo
113	H	5-metoxicarbonil-fur-2-ilo
114	H	tien-2-ilo
115	H	2-metoxicarbonil-tien-3-ilo
116	H	4-metoxicarbonil-tien-3-ilo
117	H	oxazol-2-ilo
118	H	5-metil-isoxazol-3-ilo
119	H	4-ciano-3-metil-isoxazol-5-ilo
120	H	tiazol-2-ilo
121	H	5-etiltio-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
122	H	fur-2-ilmetilo
123	H	cianofur-1-ilmetilo
124	H	tien-2-ilmetilo
125	H	C ₆ H ₅ -
126	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -
127	H	2-I-C ₆ H ₄ -

128	H	2-NC-C ₆ H ₄ -
129	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
130	H	3-CH ₃ S-C ₆ H ₄ -
131	H	3-CH ₃ O(CO)-C ₆ H ₄ -
132	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
133	H	4-F-C ₆ H ₄ -
134	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
135	H	4-(C ₂ H ₅) ₂ N-C ₆ H ₄ -
136	H	4-(N-metil-N-acetil-amino)-fenilo
137	H	2,4-diclorofenilo
138	H	4-metoksi-2-metilfenilo
139	H	3,4-diclorofenilo
140	H	3-cloro-4-fluorfenilo
141	H	2,5-difluorfenilo
142	H	5-fluor-2-metilfenilo
143	H	5,6,7,8-tetrahidronaft-2-ilo
144	H	2,3-dihidrobenzofuran-5-il-metilo
145	H	5-ciano-4,6-dimetoksi-pirid-2-ilo
146	H	2,6-dimetoksi-pirid-3-ilo
147	H	6-cloro-piridazin-3-ilo

148	H	4,6-dimetoxi-pirimid-2-ilo
149	H	2-cloro-5-fluor-pirimid-6-ilo
150	H	C ₆ H ₅ CH ₂ -
151	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂ -
152	H	2-F-C ₆ H ₄ CH ₂ -
153	H	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
154	CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
155	H	2-NO ₂ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
156	H	2-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
157	H	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
158	H	2-CHF ₂ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
159	H	2-CH ₃ S-C ₆ H ₄ CH ₂ -
160	H	2-CF ₃ S-C ₆ H ₄ CH ₂ -
161	H	3-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
162	H	3-I-C ₆ H ₄ CH ₂ -
163	H	3-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
164	H	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
165	H	4-F-C ₆ H ₄ CH ₂ -
166	H	4-Cl-C ₆ H ₄ CH ₂ -
167	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -

168	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ CH ₂ -
169	H	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
170	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ CH ₂ -
171	H	2,6-di-F-C ₆ H ₃ CH ₂ -
172	3-metil-but-2-en-1-ilo	2,5-di-F-C ₆ H ₃ CH ₂ -
173	H	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
174	H	2-F-6-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
175	H	2,6-di-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
176	4-metil-pent-2-en-1-ilo	3,4-di-Cl-C ₆ H ₃ CH ₂ -
177	H	2-F-6-CH ₃ O-C ₆ H ₃ CH ₂ -
178	H	2,4,5-tri-F-C ₆ H ₂ CH ₂ -
179	H	2,4-di-Cl-6-CH ₃ -C ₆ H ₂ CH ₂ -
180	H	3,4,5-tri-CH ₃ O-C ₆ H ₂ CH ₂ -
181	H	C ₆ H ₅ -CH(CH ₃)-
182	H	4-F-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
183	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
184	H	4-n-pentilo-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
185	H	4-CH ₃ SO ₂ -C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
186	H	C ₆ H ₅ (CO)CH ₂ -

187	H	C ₆ H ₅ -CH(CN)-
188	H	C ₆ H ₅ -(CH ₃ O)CH-
189	H	C ₆ H ₅ -(CH ₃) ₂ C-
190	H	m-Cl-C ₆ H ₅ -(CH ₃) ₂ C-
191	H	3,5-di-Cl-C ₆ H ₃ -(CH ₃) ₂ C-
192	H	C ₆ H ₅ -(C ₂ H ₅ O(CO))CH-
193	H	fenetilo
194	H	3-metoxi-4-propargiloxi-fenetilo
195	H	3-metoxi-4-(pent-2-in-1-iloxi)- fenetilo
196	H	2-metil-3-fenil-prop-2-ilo
197	H	C ₆ H ₅ O-C ₂ H ₄ -
198	H	4-F-C ₆ H ₄ -CH ₂ OCH ₂ (CH ₃) ₂ C-
199	H	C ₆ H ₅ -CH ₂ O(CO)C ₂ H ₄ -
200	H	naft-2-ilo-(CH ₃)CH-
201	NC-C ₂ H ₄ -	pirid-3-ilmetilo
202	CH ₃	2-pirid-2-ilet-1-ilo
203	H	2-(3-cloro-5-trifluormetil-pirid-2-il)oxiet-1-ilo
204	H	2-metil-4-pirazin-2-il-but-3-on-2-

		ilo
205	-(CH ₂) ₄ -	
206	-(CH ₂) ₅ -	
207	-(CH ₂) ₄ CH(C ₂ H ₅)-	
208	- C ₃ H ₆ CH[(CO)N(C ₂ H ₅) ₂]CH ₂ -	
209	-CH(CH ₃)CH=CHCH(CH ₃)-	
210	-CH₂ -C₂H₄	
211	-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ -	
212	-CH ₂ CH(CH ₃)OCH(CH ₃)CH ₂ -	
213	-C ₂ H ₄ SCH ₂ -	
214	-C ₂ H ₄ SC ₂ H ₄ -	
215	-(CH ₂) ₂ NH(CH ₂) ₂ -	
216	-(CH ₂) ₂ N(p-NO ₂ -C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
217	-(CH ₂) ₂ N(m-CF ₃ -C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
218	-(CH ₂) ₂ N(p-CH ₃ CO-C ₆ H ₄)(CH ₂) ₂ -	
219	-(CH ₂) ₂ N(pirid-2-ilo)(CH ₂) ₂ -	
220	H	(H ₂ C=CHCH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
221	H	(HCCHCH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-
222	H	(CH ₃ CH ₂ OCH ₂)(CH ₃) ₂ C-

223	H	$((\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2)(\text{CH}_3)_2\text{C-}$
224	H	$\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2\text{OCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C-}$
225	H	$(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)_2\text{C-}$
226	H	$4\text{-F-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_2(\text{CH}_3)\text{C(CN)-}$
227	H	$4\text{-Cl-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_2(\text{CH}_3)\text{C(CN)-}$
228	H	$4\text{-CH}_3\text{O-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{C(CN)-}$
229	H	$2\text{-Cl-C}_6\text{H}_4\text{-CH}_2(\text{CH}_3)\text{C(CN)-}$
230	H	$(\text{CH}_3)_2\text{CH-CH}_2(\text{CH}_3)\text{C(CN)-}$
231	H	1-metoximetil-cicloprop-1-ilo
232	H	1-benciloximetil-cicloprop-1-ilo
233	H	1-metoximetoxi-2- metil-prop-2-ilo
235	H	1-ciclopropil-et-1-ilo
236	H	2-fluor-et-1-ilo
237	H	2,2,2-trifluor-1-metil-et-1-ilo
238	H	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
239	CH_3	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{-}$
240	H	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{-}$
241	CH_3	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)\text{-}$
242	H	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_2)\text{-}$
243	CH_3	$\text{HC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_2)\text{-}$

244	H	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
245	CH_3	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
246	H	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)^-$
247	CH_3	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)^-$
248	H	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_2)^-$
249	CH_3	$(\text{H}_3\text{C})\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_2\text{CH}_2)^-$
250	H	$(\text{HOCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
251	H	$(\text{CH}_3\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
252	H	$(\text{HOCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2^-$
253	H	$(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
254	H	$(\text{CH}_3\text{OCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2^-$
255	H	$(\text{CH}_3\text{OC}_2\text{H}_4\text{OC}_2\text{H}_4)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
256	H	$(\text{Cl-n-C}_3\text{H}_6)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
257	H	$(\text{NC-n-C}_3\text{H}_6)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
258	H	$(\text{CH}_3\text{SCH}_2)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
259	H	$(\text{C}_6\text{H}_5)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
260	H	$(\text{CH}_3)_2(\text{CH}_3\text{O})\text{CC}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2^-$
261	H	$(\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}^-$
262	H	$(\text{HC}\equiv\text{CHCH}_2\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}^-$
263	H	$(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}^-$

264	H	$(\text{CH}_3\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}-$
265	H	$((\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}-$
266	H	$\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2\text{OCH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}-$
267	H	$(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2)(\text{CH}_3)\text{CH}-$
268	H	$(\text{cC}_4\text{H}_7)\text{CH}-$
269	H	$(\text{cC}_4\text{H}_7)\text{CH}_3\text{C}-$
270	H	$\text{FCH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}-$
271	H	$\text{ClCH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}-$
272	H	$\text{FCH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}-$
273	H	$\text{ClCH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}-$
274	H	$\text{FCH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
275	H	$\text{FCH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
276	H	$\text{ClCH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)_2\text{C}-$
277	H	$\text{CH}_3\text{O}(\text{C}_2\text{H}_4)\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2-$
278	H	tetrahidro-furan-2-ilmetilo
279	H	1-(tetrahidro-furan-2-il)etilo
280	H	1-metil-1-(tetrahidro-furan-2-il)etilo
281	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-etilo
282	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-1-metil-etilo
283	H	2-[1,3]dioxolan-2-il-1,1-dimetil-etilo

284	H	prop-1-ilo
285	CH ₃	prop-1-ilo
286	H	tiofen-3-ilmetilo
287	H	1-(tiofen-3-il)-et-1-ilo
289	H	1-metil-1-(tiofen-3-il)-et-1-ilo
290	H	ciclopent-1-ilo
291	H	3-F-C ₆ H ₄ -CH ₂ -
292	H	3-F-C ₆ H ₄ -CH(CH ₃)-
293	H	3-F-C ₆ H ₄ -C(CH ₃) ₂ -
294	H	C ₂ H ₅ C≡CC(CH ₃) ₂ -
294	H	nC ₃ H ₇ C≡CC(CH ₂ CH ₃)(CH ₃)-
296	H	i-C ₃ H ₇ C≡CC(CH ₂ CH ₂)-
297	H	n-C ₄ H ₉ C≡CC(CH ₃) ₂ -
298	H	sec-C ₄ H ₉ C≡CC(CH ₃) ₂ -
299	H	iso-C ₄ H ₉ C≡CC(CH ₃) ₂ -
300	H	terc-C ₄ H ₉ C≡CC(CH ₃) ₂ -
301	H	HOC ₂ H ₄ C≡CC(CH ₃) ₂ -
302	H	CH ₃ (CH ₃ O)(CH)C≡CC(CH ₃) ₂ -
303	H	(nC ₃ H ₇ OCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
304	H	(nC ₃ H ₇ OCH ₂ CH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -

305	H	(terc-C ₄ H ₉ OCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
306	H	(terc-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
307	H	(NCCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
308	H	(NCCH ₂ CH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
309	H	(C ₆ H ₅ OCH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
310	H	(C ₆ H ₅ OCH ₂ CH ₂)C≡CC(CH ₃) ₂ -
311	H	(4-FC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
312	H	(4-ClC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
313	H	(4-BrC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
314	H	(4-CH ₃ -C ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
315	H	(3-FC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
316	H	(3-ClC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
317	H	(3-CH ₃ -C ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
318	H	(2-FC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
319	H	(2-ClC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
320	H	(2-BrC ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
321	H	(2-CH ₃ -C ₆ H ₅)C≡CC(CH ₃) ₂ -
322	H	(tien-2-ilo)C≡CC(CH ₃) ₂ -
323	H	(tien-3-ilo)C≡CC(CH ₃) ₂ -

Tabla 2

Los compuestos de la Tabla 2 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 2 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 2 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 2 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 2 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 3

Los compuestos de la Tabla 3 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 3 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 3 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 3 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 3 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 4

Los compuestos de la Tabla 4 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 4 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 4 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a

323 de la Tabla 4 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 4 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 5

Los compuestos de la Tabla 5 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 5 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 5 Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 5 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 5 Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 6

Los compuestos de la Tabla 6 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 6 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 6 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 6 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 6 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 7

Los compuestos de la Tabla 7 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los

valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 7 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 7 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 7 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 7 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 8

Los compuestos de la Tabla 8 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 8 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 8 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 8 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 8 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 9

Los compuestos de la Tabla 9 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 9 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 9 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 9 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 9 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 10

Los compuestos de la Tabla 10 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 10 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 10 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 10 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 10 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 11

Los compuestos de la Tabla 11 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es bromo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 11 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 11 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es bromo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 11 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 11 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es bromo.

Tabla 12

Los compuestos de la Tabla 12 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 12 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 12 Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a

323 de la Tabla 12 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 12 Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 13

Los compuestos de la Tabla 13 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 13 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 13 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 13 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 13 Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 14

Los compuestos de la Tabla 14 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 14 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 14 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 14 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 14 Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 15

Los compuestos de la Tabla 15 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los

valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 15 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 15 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 15 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 15 Q1 es flúor, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 16

Los compuestos de la Tabla 16 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 16 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 16 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 16 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 16 Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 17

Los compuestos de la Tabla 17 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 17 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 17 R¹ es etilo, Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 17 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 17 R¹ es etilo, Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 18

Los compuestos de la Tabla 18 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 18 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 18 R¹ es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 18 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 18 R¹ es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 19

Los compuestos de la Tabla 19 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 19 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 19 R¹ es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 19 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 19 R¹ es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 20

Los compuestos de la Tabla 20 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 20 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 20 R¹ es etilo, Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los

compuestos 2 a 323 de la Tabla 20 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 20 R^1 es etilo, Q1 es cloro, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 21

Los compuestos de la Tabla 21 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R^1 es etilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 21 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 21 R^1 es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 21 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 21 R^1 es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 22

Los compuestos de la Tabla 22 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R^1 es etilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 22 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 22 R^1 es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 22 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 22 R^1 es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 23

Los compuestos de la Tabla 23 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R^1 es etilo, R^2 y R^3 tienen

los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 23 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 23 R^1 es etilo, Q_1 es hidrógeno, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 23 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 23 R^1 es etilo, Q_1 es hidrógeno, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es cloro.

Tabla 24

Los compuestos de la Tabla 24 son de la Fórmula General (I) donde Q_1 es hidrógeno, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es flúor, n es 0, L es O, R^1 es etilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 24 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 24 R^1 es etilo, Q_1 es hidrógeno, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 24 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 24 R^1 es etilo, Q_1 es hidrógeno, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es flúor.

Tabla 25

Los compuestos de la Tabla 25 son de la Fórmula General (I) donde Q_1 es cloro, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es metilo, n es 0, L es O, R^1 es etilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 25 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 25 R^1 es etilo, Q_1 es cloro, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 25 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 25 R^1 es etilo, Q_1 es cloro, Q_2 es hidrógeno, Q_3 es metilo.

Tabla 26

Los compuestos de la Tabla 26 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 26 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 26 R¹ es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 26 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 26 R¹ es etilo, Q1 es bromo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 27

Los compuestos de la Tabla 27 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 27 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 27 R¹ es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 27 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 27 R¹ es etilo, Q1 es yodo, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo.

Tabla 28

Los compuestos de la Tabla 28 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 28 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 28 R¹ es etilo, Q1 es hidrógeno, Q2 es hidrógeno, Q3 es metilo. De modo

similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 28 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 28 R^1 es etilo, $Q1$ es hidrógeno, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es metilo.

Tabla 29

Los compuestos de la Tabla 29 son de la Fórmula General (I) donde $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es cloro, n es 0, L es O, R^1 es metilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 29 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 29 $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 29 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 29 $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es cloro.

Tabla 30

Los compuestos de la Tabla 30 son de la Fórmula General (I) donde $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es flúor, n es 0, L es O, R^1 es metilo, R^2 y R^3 tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 30 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 30 $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 30 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 30 $Q1$ es tiofen-3-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es flúor.

Tabla 31

Los compuestos de la Tabla 31 son de la Fórmula General (I) donde $Q1$ es tiofen-2-ilo, $Q2$ es hidrógeno, $Q3$ es cloro, n es 0, L es O, R^1 es metilo, R^2 y R^3 tienen

los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 31 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 31 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 31 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 31 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 32

Los compuestos de la Tabla 32 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 32 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 32 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 32 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 32 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 33

Los compuestos de la Tabla 33 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 33 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 33 Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 33 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 33 Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 34

Los compuestos de la Tabla 34 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 34 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 34 Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 34 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 34 Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 35

Los compuestos de la Tabla 35 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 35 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 35 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 35 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 35 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es cloro.

Tabla 36

Los compuestos de la Tabla 36 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es etilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 36 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 36 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor. De modo similar, los

compuestos 2 a 323 de la Tabla 36 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 36 Q1 es tiofen-2-ilo, Q2 es hidrógeno, Q3 es flúor.

Tabla 37

Los compuestos de la Tabla 37 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 37 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 37 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 37 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 37 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es cloro.

Tabla 38

Los compuestos de la Tabla 38 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 38 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 38 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 38 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 38 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es cloro.

Tabla 39

Los compuestos de la Tabla 39 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los

valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 39 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 39 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 39 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 39 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es cloro.

Tabla 40

Los compuestos de la Tabla 40 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es cloro, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 40 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 40 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es cloro. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 40 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 40 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es cloro.

Tabla 41

Los compuestos de la Tabla 41 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 41 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 41 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 41 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 41 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es flúor.

Tabla 42

Los compuestos de la Tabla 42 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 42 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 42 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 42 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 42 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es flúor.

Tabla 43

Los compuestos de la Tabla 43 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 43 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 43 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 43 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 43 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es flúor.

Tabla 44

Los compuestos de la Tabla 44 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 44 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 44 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323

de la Tabla 44 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 44 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es flúor.

Tabla 45

Los compuestos de la Tabla 45 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es bromo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 45 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 45 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es bromo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 45 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 45 Q1 es cloro, Q2 es metilo, Q3 es bromo.

Tabla 46

Los compuestos de la Tabla 46 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es bromo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 46 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 46 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es bromo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 46 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 46 Q1 es bromo, Q2 es metilo, Q3 es bromo.

Tabla 47

Los compuestos de la Tabla 47 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es bromo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los

valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 47 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 47 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es bromo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 47 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 47 Q1 es yodo, Q2 es metilo, Q3 es bromo.

Tabla 48

Los compuestos de la Tabla 48 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es bromo, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 48 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 48 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es bromo. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 48 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 48 Q1 es flúor, Q2 es metilo, Q3 es bromo.

Tabla 49

Los compuestos de la Tabla 49 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es cloro, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 49 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 49 Q1 es cloro, Q2 es cloro, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 49 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 49 Q1 es cloro, Q2 es cloro, Q3 es flúor.

Tabla 50

Los compuestos de la Tabla 50 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es cloro, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 50 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 50 Q1 es bromo, Q2 es cloro, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 50 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 50 Q1 es bromo, Q2 es cloro, Q3 es flúor.

Tabla 51

Los compuestos de la Tabla 51 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es cloro, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 51 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 51 Q1 es flúor, Q2 es cloro, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 51 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 51 Q1 es flúor, Q2 es cloro, Q3 es flúor.

Tabla 52

Los compuestos de la Tabla 52 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es cloro, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 52 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 52 Q1 es yodo, Q2 es cloro, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la

Tabla 52 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 52 Q1 es Q1 es yodo, Q2 es cloro, Q3 es flúor.

Tabla 53

Los compuestos de la Tabla 53 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es bromo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 53 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 53 Q1 es cloro, Q2 es bromo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 53 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 53 Q1 es Q1 es cloro, Q2 es bromo, Q3 es flúor.

Tabla 54

Los compuestos de la Tabla 54 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es bromo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 54 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 54 Q1 es bromo, Q2 es bromo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 54 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 54 Q1 es Q1 es bromo, Q2 es bromo, Q3 es flúor.

Tabla 55

Los compuestos de la Tabla 55 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es bromo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los

valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 55 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 55 Q1 es flúor, Q2 es bromo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 55 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 55 Q1 es Q1 es flúor, Q2 es bromo, Q3 es flúor.

Tabla 56

Los compuestos de la Tabla 56 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es bromo, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 56 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 56 Q1 es yodo, Q2 es bromo, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 56 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 56 Q1 es Q1 es yodo, Q2 es bromo, Q3 es flúor.

Tabla 57

Los compuestos de la Tabla 57 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es cloro, Q2 es flúor, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 57 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 57 Q1 es cloro, Q2 es flúor, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 57 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 57 Q1 es Q1 es cloro, Q2 es flúor, Q3 es flúor.

Tabla 58

Los compuestos de la Tabla 58 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es bromo, Q2 es flúor, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 58 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 58 Q1 es bromo, Q2 es flúor, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 58 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 58 Q1 es Q1 es bromo, Q2 es flúor, Q3 es flúor.

Tabla 59

Los compuestos de la Tabla 59 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es flúor, Q2 es flúor, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 59 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 59 Q1 es flúor, Q2 es flúor, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 59 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 59 Q1 es Q1 es flúor, Q2 es flúor, Q3 es flúor.

Tabla 60

Los compuestos de la Tabla 60 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es yodo, Q2 es flúor, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 60 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 60 Q1 es yodo, Q2 es flúor, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la

Tabla 60 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 60 Q1 es Q1 es yodo, Q2 es flúor, Q3 es flúor.

Tabla 61

Los compuestos de la Tabla 61 son de la Fórmula General (I) donde Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es flúor, Q3 es flúor, n es 0, L es O, R¹ es metilo, R² y R³ tienen los valores enumerados en la Tabla 1. Por lo tanto, el compuesto 1 de la Tabla 61 es el mismo que el compuesto 1 de la Tabla 1 excepto que en el compuesto 1 de la Tabla 61 Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es flúor, Q3 es flúor. De modo similar, los compuestos 2 a 323 de la Tabla 61 son los mismos que los compuestos 2 a 323 de la Tabla 1, respectivamente, excepto que en los compuestos de la Tabla 61 Q1 es Q1 es tiofen-3-ilo, Q2 es flúor, Q3 es flúor.

Tablas 62 a 121

Las Tablas 62 a 121 corresponden exactamente a las Tablas 1 a 61 (o sea la Tabla 62 corresponde exactamente a la Tabla 1, la Tabla 63 corresponde exactamente a la Tabla 2, y así sucesivamente) con la única diferencia de que en cada una de las Tablas 62 a 121, L es S en vez de O.

Tablas 122 a 181

Las Tablas 122 a 181 corresponden exactamente a las Tablas 1 a 61 (o sea la Tabla 122 corresponde exactamente a la Tabla 1, la Tabla 123 corresponde exactamente a la Tabla 2, y así sucesivamente) con la única diferencia de que en cada una de las Tablas 122 a 181, n es 1 en vez de 0.

Tablas 182 a 241

Las Tablas 182 a 241 corresponden exactamente a las Tablas 1 a 61 (o sea la Tabla 182 corresponde exactamente a la Tabla 1, la Tabla 183 corresponde exactamente a la Tabla 2, y así sucesivamente) con la única diferencia de que en cada una de las Tablas 182 a 241, n es 2 en vez de 0.

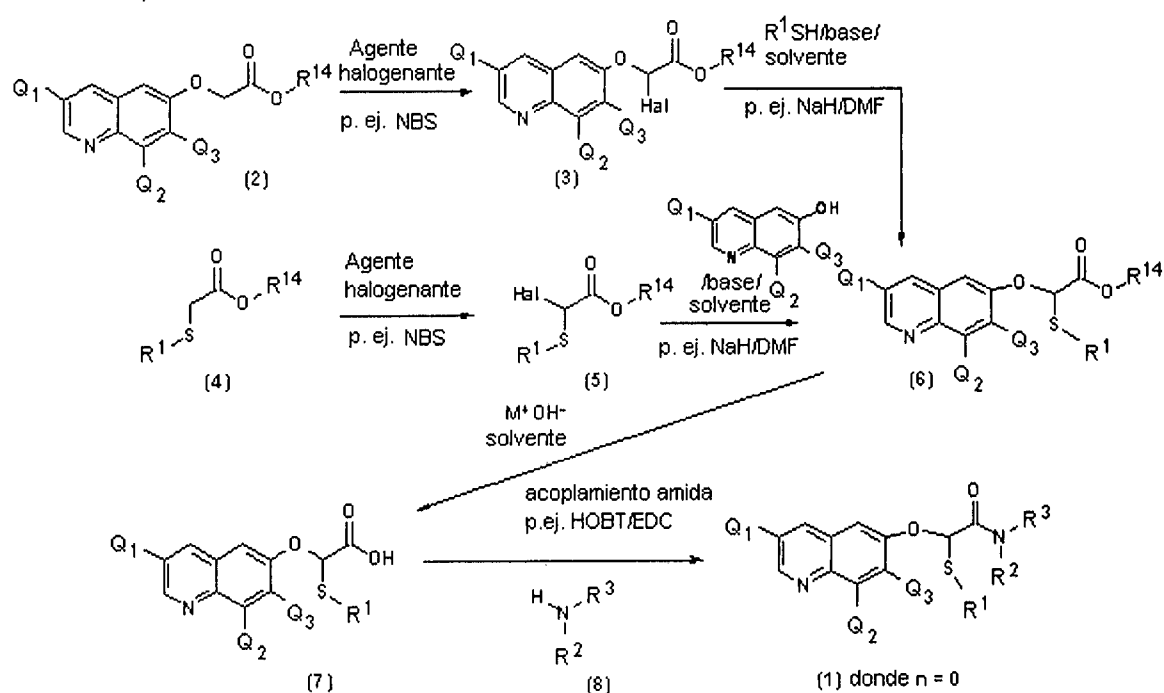
Los compuestos de la Fórmula General (I) pueden prepararse como se indica en los Esquemas 1 a 8 a continuación, en los cuales Q_1 , Q_2 , Q_3 , R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados dados más arriba, R^{14} es H o alquilo(C_{1-4}), como se indica, R^{10} es alquilo(C_{1-6}), bencilo opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alquino(C_{2-4}) opcionalmente sustituido, R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{12} y R^{13} son independientemente H o alquilo(C_{1-4}), R^9 es H o alquilo(C_{1-3}), R^h es H o alquilo(C_{1-3}), R^i es alquilo(C_{1-6}), bencilo opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alquino(C_{2-4}) opcionalmente sustituido, m es 0, 1 o 2, DMF es N,N-dimetilformamida, NBS es N-bromosuccinimida, NCS es N-clorosuccinimida y MCPBA es ácido m-cloroperbenzoico. Otras abreviaturas aparecen definidas en el texto.

Cuando se indican condiciones de proceso típicas o preferidas (temperatura de reacción, tiempo, solvente, relaciones molares de reactivos), a menos que se especifique lo contrario, también se pueden usar otras condiciones de proceso. A pesar de que las condiciones óptimas de reacción pueden variar según los reactivos o solventes usados en particular, el experto en la técnica puede determinar esas condiciones mediante procedimientos de optimización rutinarios.

Los compuestos de fórmula (1), donde n es 0 y L es O, pueden prepararse como se muestra en el Esquema 1. Los ésteres de fórmula (2), donde R^5 es alquilo(C_{1-4}), pueden halogenarse para obtener haloésteres de fórmula (3), donde Hal es un átomo de halógeno tal como bromo, cloro o yodo, por reacción con un

agente halogenante tal como N-bromosuccinimida, en un solvente adecuado tal como tetracloruro de carbono o acetonitrilo, en presencia de un iniciador radical tal como AIBN (azo-isobutironitrilo), y una fuente de luz, a entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente. Entonces se hacen reaccionar los compuestos de Fórmula General (3) con alcanotioles de Fórmula General R^1SH , en presencia de una base tal como hidruro de sodio, en un solvente adecuado tal como DMF, para obtener compuestos de Fórmula General (6), o se hacen reaccionar con sales de alcanotiol $R^1S^-M^+$, donde M es un metal tal como sodio o litio, en un solvente adecuado tal como DMF, para obtener compuestos de Fórmula General (6).

Esquema 1

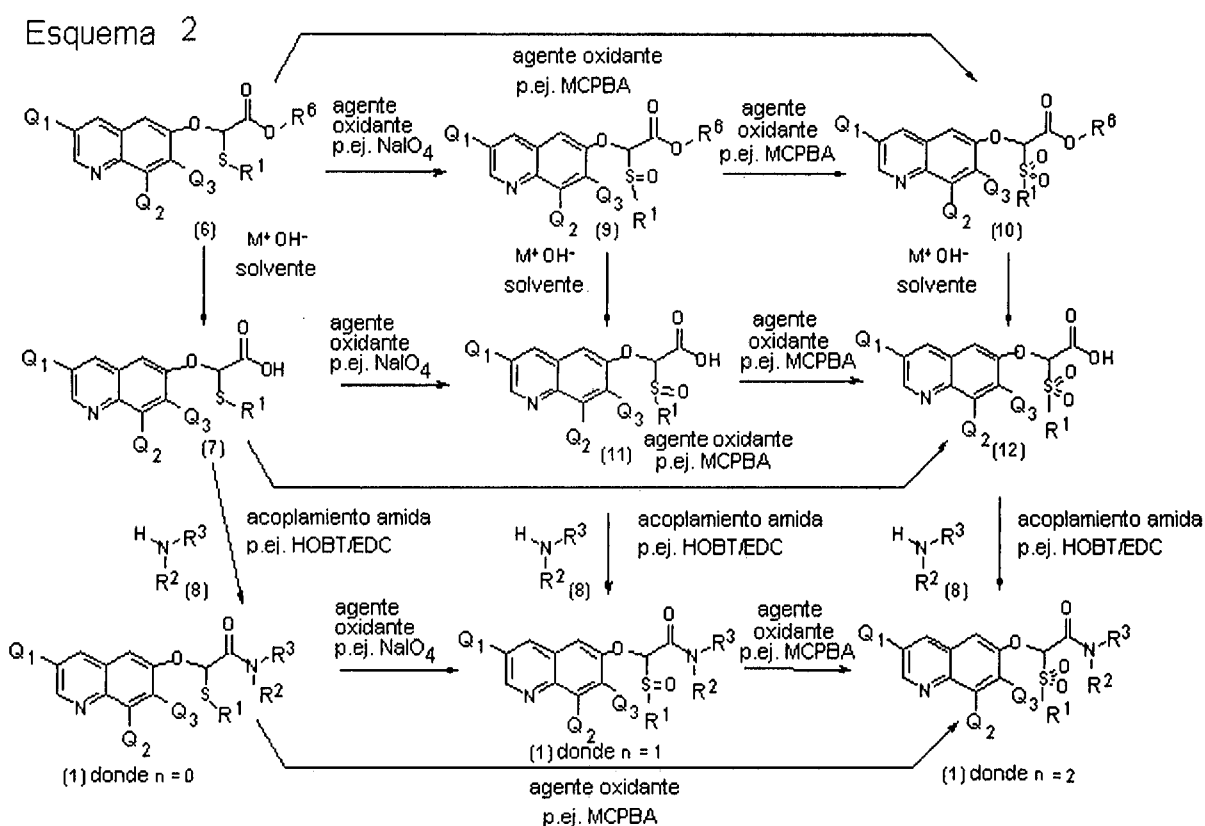


Como alternativa, se halogenan ésteres de Fórmula General (4) para obtener haloésteres de fórmula (5), donde Hal es un átomo de halógeno tal como bromo, cloro o yodo, por reacción con un agente halogenante tal como N-clorosuccinimida o N-bromosuccinimida, en un solvente adecuado tal como tetracloruro de carbono o

acetonitrilo, a entre 0°C y la temperatura de reflujo del solvente. Los haloésteres de fórmula (5) se hacen reaccionar con 6-hidroxi quinolinas, donde Q1, Q2 y Q3 son como se definió más arriba, en presencia de una base tal como t-butóxido de potasio, carbonato de potasio, o hidruro de sodio en un solvente adecuado tal como t-butanol, 1,4-dioxano o DMF, a entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente, para obtener compuestos de fórmula (6). Los compuestos de fórmula (6) se hidrolizan a ácidos de fórmula (7) por reacción con un hidróxido de metal alcalino M^+OH^- , en un solvente adecuado tal como metanol acuoso, etanol, o THF (tetrahidrofurano) a entre temperatura ambiente y la temperatura de reflujo del solvente seguido de acidificación. Los ácidos de fórmula (7) pueden condensarse con aminas de fórmula (8), empleando agentes de activación adecuados tales como HOBt (1-hidroxibenzotriazol) y EDC (1-etil-3-N,N-dimetilaminopropilcarbodiimida clorhidrato), a entre 0°C y temperatura ambiente en un solvente adecuado tal como DMF, para obtener compuestos de Fórmula General (1) donde n es 0 y L es O.

Los compuestos de Fórmula General (1), donde n es 1 o 2, se preparan por oxidación de compuestos (1) donde n = 0 al estado de oxidación del sulfóxido (n es 1) o sulfona (n es 2), como se muestra en el Esquema 2. Por ejemplo, los ésteres de la Fórmula General (6) donde R^5 es alquilo(C_{1-4}) pueden oxidarse a sulfóxidos de fórmula (9) con un agente oxidante tal como periodato de sodio en un solvente adecuado tal como etanol, entre 0°C y temperatura ambiente. Las sulfonas de fórmula (10) pueden prepararse directamente a partir de compuestos de fórmula (6) con dos o más equivalentes de un agente oxidante tal como ácido m-cloroperbenzoico (MCPBA), en un solvente adecuado tal como diclorometano entre 0°C y la temperatura de reflujo del solvente, o bien a partir de sulfóxidos de fórmula (9) con uno o más equivalentes de ácido m-cloroperbenzoico. Los sulfuros de

fórmula (6), sulfóxidos de fórmula (9) o sulfonas de fórmula (10) pueden hidrolizarse a los ácidos correspondientes (7), (11) o (12) por reacción con un hidróxido de metal alcalino en un solvente adecuado tal como etanol a entre 0°C y la temperatura de reflujo del solvente seguido de acidificación. Los ácidos de fórmula (7), (11) o (12) pueden condensarse con aminas de fórmula (8), usando agentes de activación adecuados tales como HOBt y EDC, a entre 0°C y temperatura ambiente, para obtener compuestos de Fórmula General (1) donde n es 0, 1 o 2.

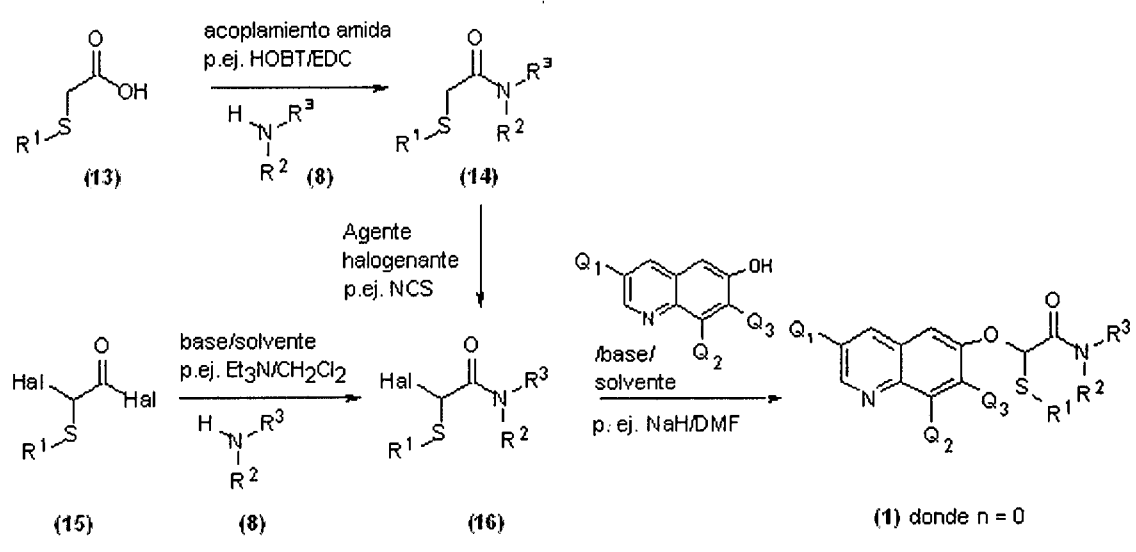


De modo similar, los sulfóxidos de fórmula (11) y de fórmula (1) donde n es 1 pueden prepararse a partir de los sulfuros de fórmula (7) y de fórmula (1) donde n es 0 respectivamente, empleando agentes oxidantes tales como metaperiodato de sodio o ácido m-cloroperbenzoico como se describió más arriba. Las sulfonas de fórmula (12) y de fórmula (1) donde n es 2, pueden prepararse a partir de los sulfuros de

fórmula (7) y de fórmula (1) donde n es 0, empleando por lo menos dos equivalentes de agentes oxidantes tales como ácido m-cloroperbenzoico, o bien a partir de sulfóxidos de fórmula (11) y de fórmula (1) donde n es 1, empleando uno o más equivalentes de agentes oxidantes tales como ácido m-cloroperbenzoico, como se describió más arriba.

Los compuestos de fórmula (1) también pueden prepararse como se muestra en el Esquema 3. Los ácidos de fórmula (13) pueden condensarse con aminas de fórmula (8), mediante agentes de activación adecuados tales como HOBT y EDC, a entre 0°C y temperatura ambiente, para obtener compuestos de fórmula (14). Los compuestos de fórmula (14) pueden halogenarse a compuestos de fórmula (16) empleando un agente halogenante tal como N-clorosuccinimida, en un solvente adecuado tal como tetracloruro de carbono o acetonitrilo, a entre 0°C y temperatura ambiente. Las amidas de fórmula (16) también pueden prepararse a partir de haluros ácidos de fórmula (15) por reacción con aminas de fórmula (8) en presencia de una base tal como trietilamina en un solvente adecuado tal como diclorometano, a entre 0°C y temperatura ambiente.

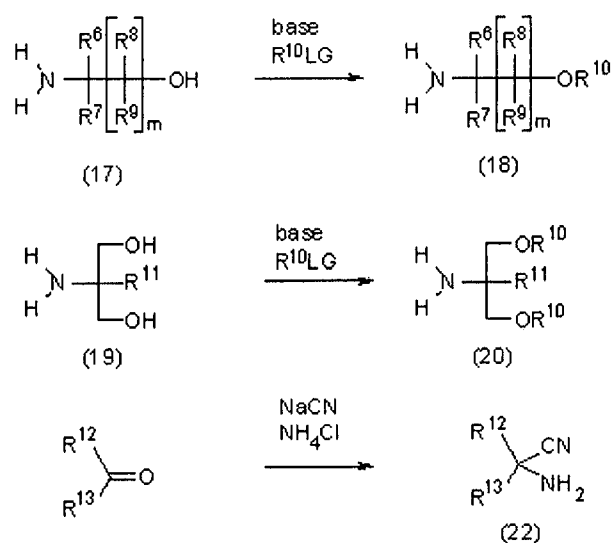
Esquema 3



Los halosulfuros de fórmula (16) pueden hacerse reaccionar con 6-hidroxi quinolinas sustituidas, en presencia de una base tal como carbonato de potasio o hidruro de sodio, en un solvente adecuado tal como DMF, a entre 0°C y 80°C, para obtener compuestos de fórmula (1) donde n es 0.

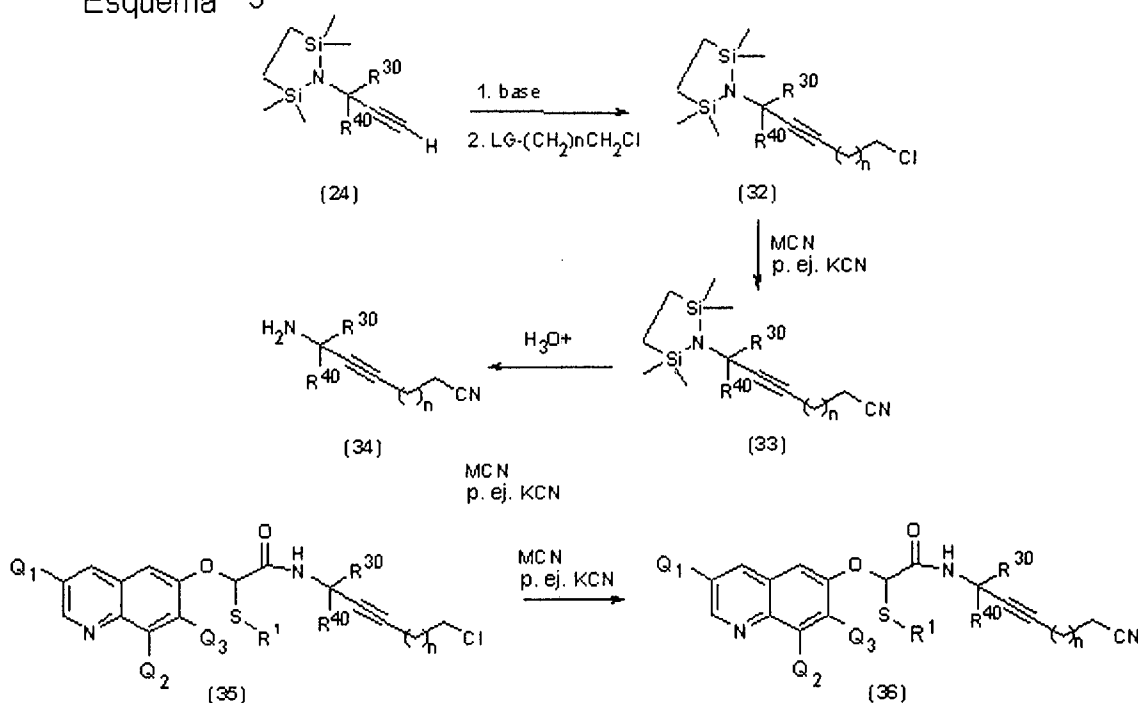
Como se muestra en el Esquema 4, las aminas de la Fórmula General (18) o (20), que son ejemplos de aminas de la Fórmula General (8) donde R^2 es H, pueden prepararse por alquilación de un aminoalcohol de la Fórmula General (17) o (19) empleando una base adecuada, tal como n-butil litio o hidruro de sodio, seguido de reacción con un reactivo alquilante adecuado $R^{10}LG$, tal como un yoduro de alquilo, por ejemplo, yoduro de metilo, para formar un compuesto alquilado de la Fórmula General (18) o (20), respectivamente. Se puede hacer reaccionar un derivado de carbonilo $R^{12}COR^{13}$ (21), por ejemplo formaldehído, con amoníaco, generalmente en forma de cloruro de amonio, y cianuro, convenientemente en forma de una solución acuosa de cianuro de sodio, para obtener un α -aminoalquino (22) (Síntesis de Strecker).

Esquema 4



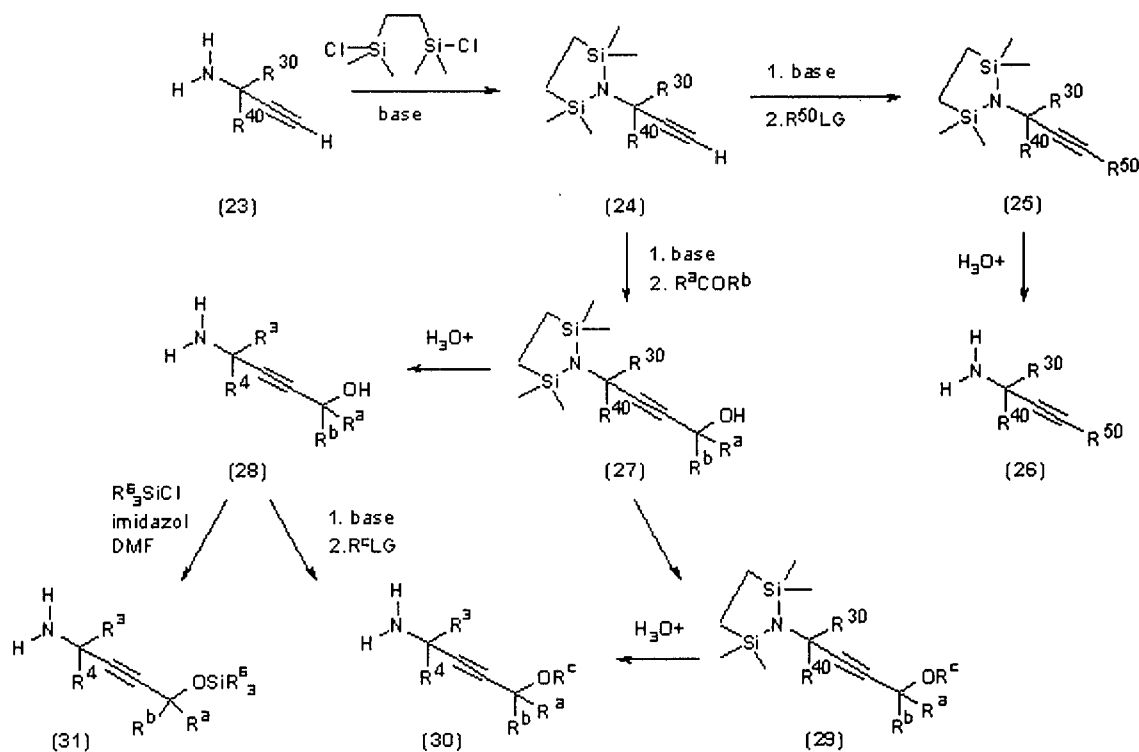
Como se muestra en el Esquema 5, los aminoalquinos silil-prottegidos de la Fórmula General (24) pueden obtenerse haciendo reaccionar aminas de Fórmula General (23) con 1,2-bis-(clorodimetilsilil)etano en presencia de una base adecuada, tal como una base de amina orgánica terciaria, por ejemplo, trietilamina. Las aminas de la Fórmula General (26), que son ejemplos de aminas de la Fórmula General (8) donde R^2 es H y R^3 es $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$, pueden prepararse por alquilación de un aminoalquino silil-prottegido de la Fórmula General (24) usando una base adecuada, tal como n-butil litio, seguido de reacción con un reactivo alquilante adecuado $R^{50}LG$, tal como un yoduro de alquilo, por ejemplo, yoduro de metilo, para formar un compuesto alquilado de la Fórmula General (25). El grupo protector sililo puede entonces eliminarse de un compuesto de la Fórmula General (25) con, por ejemplo, un ácido acuoso para formar un aminoalquino de la Fórmula General (26).

Esquema 5



En un procedimiento similar, se puede hacer reaccionar un aminoalquino silil- protegido de la Fórmula General (24) con un derivado de carbonilo R^aCOR^b , por ejemplo formaldehído, usando una base adecuada, tal como n-butil litio, para obtener un aminoalquino (27) que contiene una porción hidroxialquilo. Un compuesto de la Fórmula General (27) puede tratarse primero con una base, tal como hidruro de sodio o bis(trimetilsilil)amida de potasio y luego con un compuesto R^cLG , donde LG representa un grupo saliente tal como un halógeno, o bien éster de sulfonato tal como OSO_2Me , u $OSO_2-4-tolilo$, por ejemplo yoduro de etilo, para obtener un compuesto de la Fórmula General (29). Después de eliminar el grupo protector sililo, se obtienen los compuestos de Fórmula General (30). Como alternativa, el grupo protector sililo se puede eliminar primero para obtener compuestos de la Fórmula General (28). Los aminoalquinos de la Fórmula General (28) pueden derivatizarse adicionalmente haciéndolos reaccionar con un agente de sililación, por ejemplo cloruro de t-butildimetilsililo, para obtener un derivado sililado en el oxígeno de la Fórmula General (31).

Esquema 6

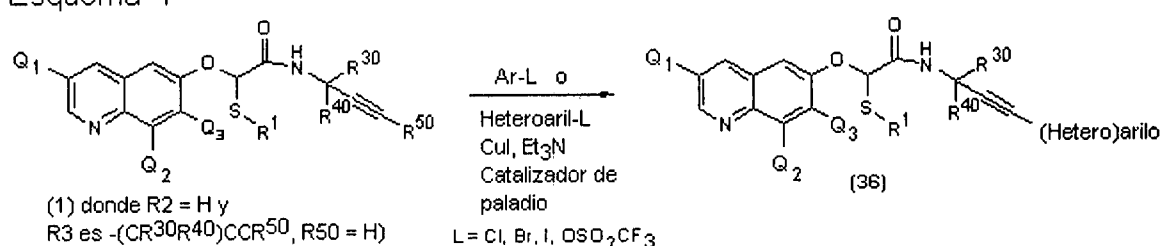


Como se muestra en el Esquema 6, los aminoalquinos silil-protegidos de la Fórmula General (32) pueden obtenerse haciendo reaccionar aminas silil-protegidas de Fórmula General (24) con cloroalcanos que portan un grupo saliente adecuado, por ejemplo bromuro o yoduro, en presencia de una base adecuada, tal como una base de amida de sodio o litio, por ejemplo, bis(trimetilsilil)amida de sodio o amida de sodio. Las aminas de la Fórmula General (34), que son ejemplos de aminas de la Fórmula General (8) donde R^2 es H y R^3 es $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$ pueden prepararse por desplazamiento de un anión cloruro por parte del cianuro, y a continuación eliminación del grupo protector sililo con, por ejemplo, un ácido acuoso, para formar un compuesto de ciano de la Fórmula General (34).

En un procedimiento similar, se puede hacer reaccionar una amida de la Fórmula General (35) con, por ejemplo, cianuro de potasio para obtener un ciano amidoalquino de la Fórmula General (36).

Como se muestra en el Esquema 7, los compuestos de la Fórmula General (1), donde R^{50} es H, pueden reaccionar en condiciones Sonogashira con, por ejemplo, cloruros, bromuros, yoduros o triflatos de arilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos para formar compuestos de arilo o heteroarilo sustituidos de Fórmula General (1), donde R^{50} es un grupo arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido. Un catalizador de paladio adecuado es cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II).

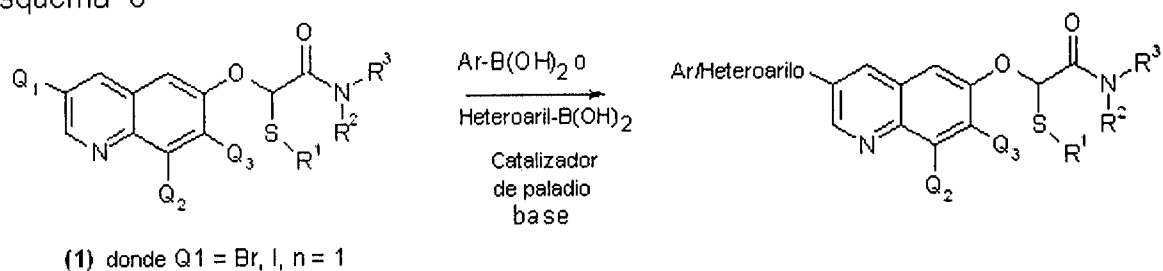
Esquema 7



Otras aminas de la Fórmula General (8) se consiguen en el comercio o pueden prepararse mediante métodos estándares que se encuentran en la literatura o modificaciones estándares.

Como se muestra en el Esquema 8, los compuestos de la Fórmula General (1), donde Q_1 es bromo o yodo, pueden reaccionar en condiciones Suzuki con, por ejemplo, ácidos borónicos de arilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos para formar compuestos de arilo o heteroarilo sustituidos de Fórmula General (1), donde Q_1 es un grupo arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido. Un catalizador de paladio adecuado es tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0).

Esquema 8



Las tioamidas (Compuestos de la Fórmula General (1) donde $L = S$) pueden prepararse a partir de las correspondientes amidas empleando agentes de tionación tales como pentasulfuro de fósforo, reactivos de Lawesson o Davy o prepararse a partir de los correspondientes tionoácidos o tionoésteres mediante métodos estándares que se encuentran en la literatura o modificaciones estándares.

Las 6-hidroxi quinolinas sustituidas se consiguen, o pueden prepararse mediante técnicas elementales de la química orgánica. Cuando los compuestos no se consiguen en el comercio, pueden prepararse a partir de precursores disponibles mediante transformaciones elementales que se conocen bien en el arte y que están bien descritas en los textos habituales de la química heterocíclica. Por ejemplo, las aminas aromáticas sustituidas pueden convertirse fácilmente en quinolin-6-oles sustituidos con electrófilos apropiados, tales como 2,2,3 tribromopropanal. En los Ejemplos 1 a 3 se presentan ejemplos de tales reacciones.

Los compuestos de fórmula (I) son fungicidas activos y pueden utilizarse para controlar uno o más de los siguientes patógenos: *Pyricularia oryzae* (*Magnaporthe grisea*) del arroz y trigo y otras *Pyricularia* spp. de otros huéspedes; *Puccinia triticina* (o *recondita*), *Puccinia striiformis* y otros añublos del trigo, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* y otros añublos de la cebada, y añublos de otros huéspedes (por ejemplo césped, centeno, café, peras, manzanas, maníes, remolacha azucarera, vegetales y plantas ornamentales); *Erysiphe cichoracearum* de las cucurbitáceas (por ejemplo melón); *Blumeria* (o *Erysiphe*) *graminis* (mildiú polvoriento) de la cebada, trigo, centeno y césped y otros tipos de mildiú polvoriento de diversos huéspedes, tales como *Sphaerotheca macularis* del lúpulo, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*) de las cucurbitáceas (por ejemplo pepino), *Leveillula taurica* de los tomates, berenjenas y pimientos verdes, *Podosphaera leucotricha* de las manzanas y *Uncinula*

necator de las vides; *Cochliobolus* spp., *Helminthosporium* spp., *Drechslera* spp. (*Pyrenophora* spp.), *Rhynchosporium* spp., *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) y *Phaeosphaeria nodorum* (*Stagonospora nodorum* o *Septoria nodorum*), *Pseudocercospora herpotrichoides* y *Gaeumannomyces graminis* de los cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno), césped y otros huéspedes; *Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum* de los maníes y otras *Cercospora* spp. de otros huéspedes, por ejemplo remolacha azucarera, bananas, porotos de soja y arroz; *Botrytis cinerea* (moho gris) de los tomates, frutillas, vegetales, vides y otros huéspedes y otras *Botrytis* spp. de otros huéspedes; *Alternaria* spp. de los vegetales (por ejemplo zanahorias), colza oleaginosa, manzanas, tomates, papas, cereales (por ejemplo trigo) y otros huéspedes; *Venturia* spp. (incluyendo *Venturia inaequalis* (escabro)) de las manzanas, peras, frutos de hueso, nueces y otros huéspedes; *Cladosporium* spp. de una variedad de huéspedes incluyendo cereales (por ejemplo trigo) y tomates; *Monilinia* spp. de los frutos de hueso, nueces y otros huéspedes; *Didymella* spp. de los tomates, césped, trigo, cucurbitáceas y otros huéspedes; *Phoma* spp. de la colza oleaginosa, césped, arroz, papas, trigo y otros huéspedes; *Aspergillus* spp. y *Aureobasidium* spp. del trigo, madera y otros huéspedes; *Ascochyta* spp. de las arvejas, trigo, cebada y otros huéspedes; *Stemphylium* spp. (*Pleospora* spp.) de las manzanas, peras, cebollas y otros huéspedes; enfermedades estivales (por ejemplo podredumbre amarga (*Glomerella cingulata*), podredumbre negra o punto foliar ojo de rana (*Botryosphaeria obtusa*), puntos de la fruta de Brook (*Mycosphaerella pomi*), añublo de la manzana cedro (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), enfermedad del hollín (*Gloeodes pomigena*), heces de mosca (*Schizothyrium pomi*) y podredumbre blanca (*Botryosphaeria dothidea*)) de las manzanas y peras; *Plasmopara viticola* de las vides; otros tipos de mildiú veloso,

tales como *Bremia lactucae* de la lechuga, *Peronospora* spp. de los porotos de soja, tabaco, cebollas y otros huéspedes, *Pseudoperonospora humuli* del lúpulo y *Pseudoperonospora cubensis* de las cucurbitáceas; *Pythium* spp. (incluyendo *Pythium ultimum*) del césped y otros huéspedes; *Phytophthora infestans* de las papas y tomates y otras *Phytophthora* spp. de los vegetales, frutillas, paltas, pimientos, plantas ornamentales, tabaco, cacao y otros huéspedes; *Thanatephorus cucumeris* del arroz y césped y otras *Rhizoctonia* spp. de diversos huéspedes tales como trigo y cebada, maníes, vegetales, algodón y césped; *Sclerotinia* spp. del césped, maníes, papas, colza oleaginosa y otros huéspedes; *Sclerotium* spp. del césped, maníes y otros huéspedes; *Gibberella fujikuroi* del arroz; *Colletotrichum* spp. de una variedad de huéspedes incluyendo césped, café y vegetales; *Laetisaria fuciformis* del césped; *Mycosphaerella* spp. de las bananas, maníes, cítricos, pacanas, papaya y otros huéspedes; *Diaporthe* spp. de los cítricos, porotos de soja, melones, peras, lupinos y otros huéspedes; *Elsinoe* spp. de los cítricos, vides, aceitunas, pacanas, rosas y otros huéspedes; *Verticillium* spp. de una variedad de huéspedes incluyendo lúpulo, papas y tomates; *Pyrenopeziza* spp. de la colza oleaginosa y otros huéspedes; *Oncobasidium theobromae* del cacao que causa raya vascular dieback ("vascular streak dieback"); *Fusarium* spp., *Typhula* spp., *Microdochium nivale*, *Ustilago* spp., *Urocystis* spp., *Tilletia* spp. y *Claviceps purpurea* de una variedad de huéspedes pero especialmente trigo, cebada, césped y maíz; *Ramularia* spp. de la remolacha azucarera, cebada y otros huéspedes; enfermedades de la post-cosecha sobre todo de la fruta (por ejemplo *Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* y *Trichoderma viride* de las naranjas, *Colletotrichum musae* y *Gloeosporium musarum* de las bananas y *Botrytis cinerea* de las uvas); otros patógenos de las vides, particularmente *Eutypa lata*, *Guignardia bidwellii*,

Phellinus igniarius, *Phomopsis viticola*, *Pseudopeziza tracheiphila* y *Stereum hirsutum*; otros patógenos de los árboles (por ejemplo *Lophodermium seeditiosum*) o madera, particularmente *Cephalosporium fragrans*, *Ceratocystis* spp., *Ophiostoma piceae*, *Penicillium* spp., *Trichoderma pseudokoningii*, *Trichoderma viride*, *Trichoderma harzianum*, *Aspergillus niger*, *Leptographium lindbergii* y *Aureobasidium pullulans*; y vectores fúngicos de enfermedades virales (por ejemplo *Polymyxa graminis* de los cereales como el vector del virus mosaico amarillo de la cebada (BYMV) y *Polymyxa betae* de la remolacha azucarera como el vector de la rizomania).

Un compuesto de fórmula (I) puede moverse acropétalmente, basipétalmente o localmente en el tejido vegetal para resultar activo contra uno o más hongos. Además, un compuesto de Fórmula (I) puede ser lo suficientemente volátil como para resultar activo en la fase de vapor contra uno o más hongos de la planta.

La invención por lo tanto, propone un método para combatir o controlar hongos fitopatogénicos que comprende aplicar una cantidad efectiva como fungicida de un compuesto de Fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de Fórmula (I), a una planta, a una semilla de una planta, al locus de la planta o semilla o al suelo o cualquier otro medio para el desarrollo de una planta, p. ej. solución nutriente.

El termino "planta" en el contexto de la presente incluye brotes, arbustos y árboles. Además, el método fungicida de la invención incluye tratamientos protectores, curativos, sistémicos, erradicantes y antiesporulantes.

Los compuestos de fórmula (I) se usan de preferencia en el ámbito agrícola, hortícola y de cuidado de céspedes en forma de una composición.

Para aplicar un compuesto de fórmula (I) a una planta, a una semilla de una planta, al locus de la planta o semilla o al suelo o cualquier otro medio para su desarrollo, un compuesto de fórmula (I) se formula en general como una composición que incluye, además del compuesto de fórmula (I), un diluyente o vehículo inerte adecuado y, de manera opcional, un agente tensioactivo (SFA). Los SFA son productos químicos capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfases líquido/sólido, líquido/gaseoso o líquido/líquido) mediante la disminución de la tensión interfacial y por esa vía se logran los cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersión, emulsión y humectación). Es conveniente que todas las composiciones (tanto las formulaciones sólidas como líquidas) comprendan, en peso, 0,0001 a 95%, más preferiblemente 1 a 85%, por ejemplo 5 a 60%, de un compuesto de fórmula (I). La composición se usa en general para controlar hongos de manera tal que un compuesto de fórmula (I) se aplica a un promedio de desde 0,1g a 10 kg por hectárea, preferiblemente desde 1 g a 6 kg por hectárea, más preferiblemente desde 1g a 1 kg por hectárea.

Cuando se usa como cobertura en una semilla, un compuesto de fórmula (I) se aplica a un promedio de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo 0,001 g o 0,05 g), preferiblemente 0,005 g a 10 g, más preferiblemente 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semilla.

En otro aspecto la presente invención propone una composición fungicida que comprende una cantidad efectiva como fungicida de un compuesto de fórmula (I) y un diluyente o vehículo adecuado para el mismo.

En otro de los aspectos, la invención propone un método para combatir y controlar hongos en un locus, que consiste en tratar los hongos, o el locus de los hongos con una cantidad efectiva como fungicida de una composición que comprende un compuesto de fórmula (I).

Las composiciones pueden seleccionarse entre una variedad de tipos de formulación, incluyendo polvos para esparcir (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos hidratables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto aceite en agua (EW) como agua en aceite (EO)), micro-emulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, formulaciones en vapor/humo, suspensiones encapsuladas (CS) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido dependerá, en todo caso, de la finalidad en particular que se le adjudique y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula (I).

Los polvos para esparcir (DP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, tiza, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo de manera mecánica la mezcla hasta obtener un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos

orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, de manera opcional, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. La mezcla entonces se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden preparar composiciones similares en gránulos para formar gránulos solubles en agua (SG).

Los polvos hidratables (WP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes de humectación y, preferiblemente, uno o más agentes dispersantes y, de manera opcional, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. La mezcla entonces se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden preparar composiciones similares en gránulos para formar gránulos dispersables en agua (WG).

Los gránulos (GR) se pueden formar granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o bien a partir de gránulos en blanco preformados absorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de fuller, kieselguhr, tierras de diatomeas o marlos de maíz molidos) o adsorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material nuclear duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secándolo si es necesario. Los agentes que se emplean habitualmente para promover la absorción o adsorción comprenden solventes (tales como alcoholes, éteres, cetonas, ésteres y solventes de petróleo alifáticos y aromáticos) y agentes aglutinantes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes de polivinilo, dextrinas, azúcares y aceites

vegetales). También se pueden incluir uno o más de otros aditivos en gránulos (por ejemplo un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).

Los concentrados dispersables (DC) pueden prepararse disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o un solvente orgánico, tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o impedir la cristalización en un envase rociador).

Los concentrados emulsionables (EC) o emulsiones aceite en agua (EW) pueden prepararse disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un solvente orgánico (opcionalmente con uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de tales agentes). Los solventes orgánicos adecuados para usar en los EC comprenden hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es Marca Registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona), alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetil amidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida C₈-C₁₀ de ácido graso) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionar espontáneamente al agregarse a agua, para producir una emulsión con estabilidad suficiente para permitir la aplicación en forma de pulverización por medio del equipo apropiado. La preparación de una EW consiste en obtener un compuesto de fórmula (I) en forma de líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, puede fundirse a una temperatura razonable, generalmente por debajo de 70°C) o en solución (disolviéndolo en un solvente apropiado) y entonces emulsionar el líquido o la solución resultantes en agua que contiene uno o más SFA, con alto corte, para

producir una emulsión. Los solventes adecuados para usar en las EW comprenden aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), solventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos apropiados de baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) pueden prepararse mezclando agua con una mezcla de uno o más solventes con uno o más SFA, para producir de manera espontánea una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Al principio el compuesto de fórmula (I) está presente o bien en el agua o bien en la mezcla solvente/SFA. Los solventes adecuados para usar en las ME comprenden aquellos descritos hasta aquí para utilizar en EC o en EW. Una ME puede ser un sistema aceite en agua o bien agua en aceite (cuál de los sistemas está presente se puede determinar por mediciones de la conductividad) y puede resultar adecuado para mezclar pesticidas hidrosolubles y oleosolubles en la misma formulación. Una ME sirve para diluir en agua, ya sea que permanezca como una microemulsión o que forme una emulsión convencional aceite en agua.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden ser suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Los SC pueden prepararse moliendo con bolas o perlas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión en partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la que se asientan las partículas. Como alternativa, se puede moler en seco un compuesto de fórmula (I) y agregarlo al agua, con los agentes descritos hasta aquí, para obtener el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un agente de propulsión adecuado (por ejemplo n-butano). Un compuesto de fórmula (I) también puede disolverse o dispersarse en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible en agua, tal como n-propanol) para obtener composiciones para usar en bombas de pulverización manuales, no presurizadas.

Un compuesto de fórmula (I) puede mezclarse en su estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto.

Las suspensiones encapsuladas (CS) pueden prepararse de modo similar a la preparación de formulaciones EW pero con una etapa adicional de polimerización de tal manera que se obtiene una dispersión acuosa de gotitas oleosas, en la que cada gotita oleosa está encapsulada en una envoltura polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, de manera opcional, un vehículo o diluyente para el mismo. La cubierta polimérica puede obtenerse mediante reacción de policondensación interfacial o bien por un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden servir para la liberación controlada del compuesto de fórmula (I) y pueden usarse para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula (I) también puede formularse en una matriz polimérica biodegradable para lograr la liberación lenta y controlada del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el desempeño biológico de la composición (por ejemplo mejorar la humectación, retención o distribución en la superficie; la resistencia a la lluvia en las superficies tratadas; o la absorción o movilidad de un compuesto de fórmula (I)). Estos aditivos pueden ser agentes tensioactivos, aditivos en forma de rocío a base de aceites, por ejemplo algunos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de poroto

de soja y semilla de colza), y mezclas de estos con otros adyuvantes biopotenciadores (ingredientes que pueden ayudar en o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).

También puede formularse un compuesto de fórmula (I) para aplicar en el tratamiento de una semilla, por ejemplo como composición en polvo, incluyendo un polvo para el tratamiento de semillas en seco (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para el tratamiento en suspensión (WS), o como composición líquida, incluyendo un concentrado fluido (FS), una solución (LS) o una suspensión en cápsulas (CS). La preparación de composiciones DS, SS, WS, FS y LS es muy similar a la de las composiciones DP, SP, WP, SC y DC, respectivamente, descritas más arriba. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente para facilitar la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película). Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser SFA de tipo catiónico, aniónico, anfotérico o no iónico.

Los SFA adecuados del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetil amonio), imidazolinas y sales de amina. Entre los SFA aniónicos adecuados se incluyen sales de metales alcalinos de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo lauril sulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecylbencenosulfonato de sodio, dodecylbencenosulfonato de calcio, sulfonato de butilnaftaleno y mezclas de sulfonatos de di-isopropil- y tri-isopropil-naftaleno de sodio), sulfatos de éter, sulfatos de éter de alcohol (por ejemplo lauret-3-sulfato de sodio), carboxilatos de éter (por ejemplo lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico

(sobre todo mono-ésteres) o pentóxido de fósforo (sobre todo di-ésteres), por ejemplo la reacción entre alcohol de laurilo y ácido tetrafosfórico; por otra parte estos productos pueden estar etoxilados), sulfosuccinamatos, sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de parafina u olefina. Entre los SFA adecuados del tipo anfotérico se incluyen betaínas, propionatos y glicinatos. Entre los SFA adecuados del tipo no iónico se incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de la condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo ésteres de polietilen glicol de ácido graso); óxidos de amina (por ejemplo óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas.

Entre los agentes de suspensión adecuados se incluyen coloides hidrofílicos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas de dilatación (tales como bentonita o atapulgita).

Un compuesto de fórmula (I) puede suministrarse a través de cualquier medio conocido para aplicar compuestos fungicidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formulado o sin formular, a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, tallos, ramas o raíces, a la semilla antes de plantarla o a otros medios en los que se desarrollan las plantas o en el que se plantarán éstas (tales como el suelo que circunda las raíces, el suelo en general, el agua de arrozal o sistemas de cultivo hidropónico), directamente o se puede rociar sobre, espolvorear sobre, aplicar por inmersión, aplicar como formulación en crema o en pasta, aplicar como vapor o

aplicar por distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en tierra o un ambiente acuático.

Un compuesto de fórmula (I) también puede inyectarse en las plantas o rociarse sobre la vegetación usando técnicas de pulverización electrodinámica u otros métodos de bajo volumen, o aplicarse mediante sistemas de irrigación terrestres o aéreos.

Las composiciones para usar como preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se suministran en general en forma de un concentrado que contiene una alta proporción del ingrediente activo, concentrado que se integra al agua antes de su uso. Con frecuencia se necesita que estos concentrados, que pueden ser DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG y CS, resistan el almacenamiento durante periodos prolongados y, luego de ese tiempo, estén en condiciones de soportar la adición de agua para formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo suficiente que permita su aplicación mediante equipo de pulverización convencional. Estas preparaciones acuosas pueden contener diversas cantidades de un compuesto de fórmula (I) (por ejemplo 0,0001 a 10%, en peso) según el objetivo al que esté destinado su uso.

Un compuesto de fórmula (I) puede usarse en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes que contienen nitrógeno, potasio o fósforo). Entre los tipos de formulación adecuados se incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen de preferencia hasta 25% en peso del compuesto de fórmula (I).

La invención, por lo tanto, también propone una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de fórmula (I).

Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que poseen actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos que poseen actividad fungicida similar o complementaria o que poseen actividad herbicida, insecticida, nematocida, acaricida o reguladora del crecimiento vegetal.

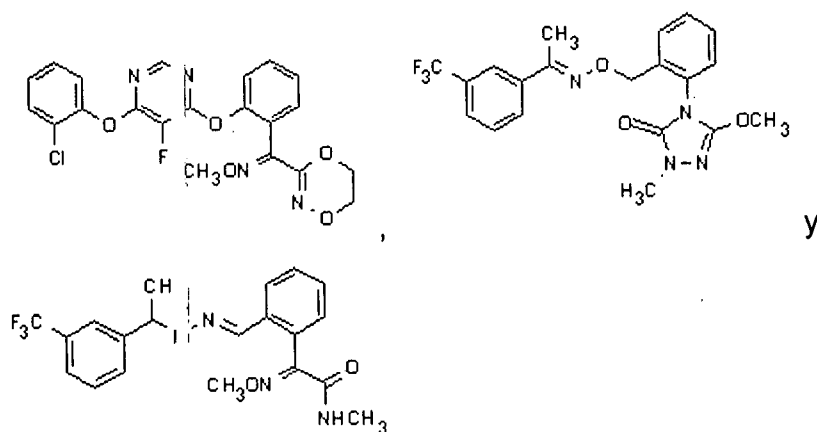
Si se incluye otro fungicida, la composición resultante puede contar con un espectro de actividad más amplio o un nivel mayor de actividad intrínseca que el compuesto de fórmula (I) por sí solo. Además, el otro fungicida puede producir un efecto sinérgico sobre la actividad fungicida del compuesto de fórmula (I).

El compuesto de fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede mezclarse con uno o más ingredientes activos adicionales tales como un pesticida, fungicida, sinergista, herbicida o regulador del crecimiento vegetal cuando corresponda. El ingrediente activo adicional puede: proporcionar una composición que posee un espectro de actividad más amplio o mayor persistencia en un locus; sinergizar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentar la velocidad del efecto o vencer la repelencia) del compuesto de fórmula (I); o ayudar a vencer o impedir el desarrollo de la resistencia a los componentes individuales. El ingrediente activo adicional en particular depende del objetivo al que se destine la composición.

Ejemplos de compuestos fungicidas que pueden incluirse en la composición de la invención son AC 382042 (N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi) propionamida), acibenzolar-S-metilo, alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azafenidina, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, boscalid (nuevo nombre del nicobifeno), bromuconazol, bupirinato, captafol, captan, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxin, carpropamid, carvona, CGA 41396, CGA 41397, chinometionato, clorbenzotiazona, clorotalonil,

clorozolinato, clozilacon, compuestos que contienen cobre tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre, y mezcla Bordeaux, ciamidazosulfamid, ciazofamid (IKF-916), ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, 1,1'-dióxido de di-2-piridil disulfuro, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de O,O-di-iso-propil-S-bencilo, dimefluazol, dimetconazol, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, dinocap, ditianon, cloruro de amonio de dodecil dimetilo, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, (Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioetilidenaminooxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanil (AC 382042), fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, flumorf, fluorimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpyr, guazatina, hexaconazol, hidroxiiisoxazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, carbamato de isopropanil butilo, isoprotilano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY 248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metalaxilo M, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, metrafenona, MON65500 (N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida), miclobutanil, NTN0301, neoasozin, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotaI-iso-propilo, nuarimol, ofurace, compuestos de mercurio orgánico, oisastrobina, oxadixilo, oxasulfuron, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicuron, óxido de fenazina, ácidos de fósforo, ftaluro, picoxistrobina, polioxin D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb clorhidrato,

propiconazol, propineb, ácido propiónico, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirazofos, pirfenox, pirimetanilo, piroquilon, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifeno, quintoceno, siltiofam (MON 65500), S-mazalilo, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomicina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnaceno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, timibenconazol, tolclofos-metilo, tolilfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, tricloclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, XRD-563, zineb, ziram, zoxamida y los compuestos de las fórmulas:



Los compuestos de fórmula (I) pueden mezclarse con tierra, turba u otros medios para el arraigamiento para la protección de plantas contra enfermedades con inicio en la semilla, terreno o follaje, causadas por hongos.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que poseen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de tal modo que no se prestan todos fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias pueden prepararse otros tipos de formulación. Por ejemplo, cuando un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro es un líquido

insoluble en agua, es posible, sin embargo, dispersar cada uno de los ingredientes activos en la misma fase acuosa continua dispersando el ingrediente activo sólido en forma de suspensión (usando una preparación análoga a la de un SC) pero dispersando el ingrediente activo líquido en forma de emulsión (usando una preparación análoga a la de un EW). La composición resultante es una formulación en forma de uspoemulsión (SE).

La invención se ilustra mediante los siguientes Ejemplos en los que se usan las siguientes abreviaturas:

ml = mililitros

g = gramos

THF = tetrahidrofurano

M⁺ = ión de masa

s = singlete

HOBT = 1-hidroxibenzotriazol

s amp = singlete amplio

t = triplete

c = cuartete

m = multiplete

ppm = partes por millón

M = molar

p.f. = punto de fusión (sin corregir)

p.e. = punto de ebullición

DMSO = dimetilsulfóxido

DMF = N, N-dimetilformamida

d = doblete

HOAT = 7-aza-1-hidroxibenzotriazol

RMN = resonancia magnética nuclear

HPLC = cromatografía líquida de alto
rendimiento

TLC = cromatografía de capa delgada

glc = cromatografía gas-líquido

EDC = 1-etil-3-N,N-dimetilamino
propilcarbodiimida clorhidrato

EJEMPLO 1

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (Compuesto No. 12 de la Tabla 2)

Etapa 1. Preparación de 3-bromo-7-cloro-quinolin-6-ol

Paso 1

Se trató 3-cloro-4-metoxi anilina (10 g) en ácido acético (100 ml) con 2,2,3-tribromopropional (18,8 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas luego de lo cual se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NaOH 2N, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó bajo presión reducida para obtener el producto deseado, 3-bromo-7-cloro-6-metoxi-quinolina, en forma de un sólido amarillo según la cromatografía (sílice; hexano/acetato de etilo) (M^+ 274).

RMN ^1H ($CDCl_3$) δ ppm: 8,78 (1H, d); 8,21 (1H, d); 8,10 (1H, s); 7,03 (1H, s).

Paso 2

Se llevó a reflujo una mezcla del producto del Paso 1 (1,4 g) y ácido bromhídrico (solución en agua 48 % en peso) (100 ml x2) durante 62 horas. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con agua, se trató con carbonato de sodio e hidrógeno y se extrajo con acetato de etilo. El extracto se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se evaporó bajo presión reducida para obtener el producto buscado, 3-bromo-7-cloro-quinolin-6-ol (M^+ 260). RMN ^1H (DMSO) δ ppm: 7,34 (1H, s); 7,07 (1H, s); 8,60 (1H, d); 8,73 (1H, d); 11,12 (1H, s).

Etapa 2: Preparación de metil éster de ácido (3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético

Paso 1

A una solución agitada de (metiltio)acetato de metilo (10,8 ml) en diclorometano (300 ml) enfriada hasta -15°C se agregó por goteo cloruro de sulfuro (8,1 ml). La mezcla se dejó templar hasta temperatura ambiente en un espacio de dos horas y entonces se concentró bajo presión reducida para obtener metil éster de ácido cloro-metilsulfanil-acético en crudo en forma de un líquido incoloro. El producto se usó en el siguiente paso sin purificación adicional. RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,33 (3H, s); 3,83 (3H, s); 5,49 (1H, s).

Paso 1:

A una solución agitada de 3-bromo-7-cloro-quinolin-6-ol de la Etapa 1, Paso 2 (1,1 g) en DMF seca (17 ml) que contenía carbonato de potasio anhidro (3,1 g) a temperatura ambiente se agregó metil éster de ácido cloro-metilsulfanil-acético (0,79 g) por goteo. La mezcla se calentó durante 1 hora a $60-65^{\circ}\text{C}$, entonces se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron bajo presión reducida. La purificación del material en crudo por cromatografía (sílice; acetato de etilo/hexano 1:4 en volumen) proporcionó el compuesto del título, metil éster de ácido 3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M^+ 378). RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 2,29 (3H, s); 3,89 (3H, s); 5,74 (1H, s); 7,18 (1H, s); 8,16 (1H, s); 8,23 (1H, s); 8,82 (1H, s).

Etapa 3: Preparación de ácido (3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético

A una solución agitada del producto de la Etapa 2, Paso 2 (1,1 g) en etanol (14 ml) a temperatura ambiente se agregó una solución de hidróxido de sodio 2N en agua (2,2 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y entonces

se vertió en agua helada y se acidificó con ácido clorhídrico 2M. El precipitado resultante se filtró de la solución, se lavó con agua fría y se secó al vacío para obtener ácido (3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M+ 364). RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 2,20 (3H, s); 6,18 (1H, s); 7,57 (1H, s); 8,19 (1H, s); 8,28 (1H, d); 8,88 (1H, d); 13,7 (1H, s amp).

Etapla 4: Preparación de 2-(3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida

El producto de la anterior Etapa 3, ácido 3-bromo-7-cloro-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (85 mg) de en N,N-dimetilformamida seca (2 ml) se trató con t-butilamina (17 mg), N-(3-dimetilamino-propil)-N'-etil carbodiimida clorhidrato (45 mg), HOAt (32 mg) y trietilamina (24 mg) a temperatura ambiente con agitación durante 3 horas. La mezcla se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo (tres veces) y los extractos se combinaron, se lavaron con solución saturada acuosa de carbonato de sodio, agua (tres veces) entonces se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se evaporaron bajo presión reducida para obtener un aceite. El aceite se fraccionó por cromatografía (sílice; hexano/acetato de etilo, 3:1 en volumen) para obtener el producto buscado en forma de un sólido blanco (p.f. 172-174°C, M+ 419). RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,46 (9H, s); 2,18 (3H, s); 5,63 (1H, s); 6,89 (1H, s amp); 7,28 (1H, s); 7,28 (1H, s); 8,18 (1H, s), 8,27 (1H, d); 8,83 (1H, d).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto No. 238 de la Tabla 2: usando 1,1-dimetil-prop-2-inilamina, p.f. 169-171°C; RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm: 1,75 (6H, s); 2,19 (3H, s); 2,41 (1H, s); 5,69 (1H, s); 7,16 (1H, s amp); 7,29 (1H, s); 8,18 (1H, s); 8,27 (1H, d); 8,83 (1H, d).

Compuesto No. 52 de la Tabla 2: usando 2-amino-3-metoxi-2-metil-propionitrilo, RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómerica (1/1); 1,82 y 1,84 (3H, 2xs); 2,18 y 2,20 (3H, 2xs); 3,52 y 3,53 (3H, 2xs); 3,64-3,84 (2H, 2xdd); 5,76 y 5,77 (1H, 2xs); 7,29 y 7,30 (1H, 2xs); 7,59 y 7,61 (1H, 2xs amp); 8,18 (1H, s); 8,29 (1H, d); 8,85 (1H, s).

Compuesto No. 244 de la Tabla 2: usando 1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 160-162°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,71 (6H, s); 1,83 (3H, s); 2,19 (3H, s); 5,66 (1H, s); 7,15 (1H, s amp); 7,27 (1H, s); 8,18 (1H, s); 8,27 (1H, d); 8,83 (1H, d).

Compuesto No. 251 de la Tabla 2: usando 4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 124-125°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,75 (6H, s); 2,19 (3H, s); 3,39 (3H, s); 4,13 (2H, s); 5,67 (1H, s); 7,17 (1H, s amp); 7,28 (1H, s); 8,18 (1H, s); 8,28 (1H, d); 8,84 (1H, d).

EJEMPLO 2

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-7-metil-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (Compuesto No. 12 de la Tabla 13)

Etapas 1. Preparación de 3-bromo-7-metil-quinolin-6-ol

Se trató 4-amino-2-metil-fenol (5 g) en ácido acético (60 ml) con 2,2,3-tribromopropanal (11,9 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas luego de lo cual se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con NH_4OH acuoso, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó bajo presión reducida para obtener el producto buscado, 3-bromo-7-metil-6-quinolin-6-ol que se usó como tal en el siguiente paso (M^+ 240), RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm: 2,32 (3H, s); 7,12 (1H, s); 7,75 (1H, s); 8,46 (1H, d); 8,64 (1H, d); 10,35 (1H, s amp).

Etapa 2: Preparación de 3-bromo-7-metil-quinolinil-6-oxi-2-metiltioacetato de metilo

En un procedimiento similar al de la Etapa 2, Paso 2 del Ejemplo 1, se hizo reaccionar 3-bromo-7-metil-quinolin-6-ol con 2-bromo-2-metiltioacetato de metilo para obtener 3-bromo-7-metil-quinolinil-6-oxi-2-metiltioacetato de metilo (M^+ 358). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,25 (3H, s); 2,50 (3H, s); 3,88 (3H, s); 5,73 (1H, s); 6,99 (1H, s); 7,86 (1H, s); 8,19 (1H, d), 8,76 (1H, d).

Etapa 3: Preparación de ácido (3-bromo-7-metil-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético

En un procedimiento similar al de la Etapa 3 del Ejemplo 1, se hidrolizó 3-bromo-7-metil-quinolinil-6-oxi-2-metiltioacetato de metilo para obtener ácido (3-bromo-7-metil-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M^+ 344). RMN H^1 (DMSO) δ ppm: 2,19 (3H, s); 2,42 (3H, s); 6,07 (1H, s); 7,42 (1H, s); 7,86 (1H, s); 8,52 (1H, s), 8,78 (1H, s), 13,55 (1H, s amp).

Etapa 4: Preparación de 2-(3-bromo-7-metil-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida

En un procedimiento similar al de la Etapa 4 del Ejemplo 1, se condensó ácido 2-(3-bromo-7-metil-quinolinil-6-oxi)-2-metiltioacético con t-butilamina para obtener 2-(3-bromo-7-metil-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (p.f. 132-134°C, M^+ 344). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,44 (9H, s); 2,19 (3H, s); 2,49 (3H, s); 5,60 (1H, s); 6,48 (1H, s amp); 7,10 (1H, s); 7,89 (1H, s); 8,21 (1H, d), 8,78 (1H, d).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto No. 16 de la Tabla 13: usando 1,1-dimetil-propilamina, p.f. 135-137°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 0,88 (3H, t); 1,39 (6H, s); 1,79 (2H, c); 2,20 (3H, s);

2,48 (3H, s); 5,59 (1H, s); 6,39 (1H, s amp); 7,10 (1H, s); 7,89 (1H, s); 8,21 (1H, d); 8,78 (1H, d).

Compuesto No. 238 de la Tabla 13: usando 1,1-dimetil-prop-2-inilamina, p.f. 141-146°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,74 (6H, s); 2,19 (3H, s); 2,41 (1H, s); 2,50 (3H, s); 5,65 (1H, s); 6,77 (1H, s amp); 7,10 (1H, s); 7,89 (1H, s); 8,21 (1H, d); 8,78 (1H, d).

Compuesto No. 52 de la Tabla 13: usando 2-amino-3-metoxi-2-metil-propionitrilo, RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómerica (1/1); 1,81 y 1,83 (3H, 2xs); 2,20 y 2,21 (3H, 2xs); 2,48 (3H, s); 3,50 y 3,53 (3H, 2xs); 3,61-3,82 (2H, 2xdd); 5,72 y 5,75 (1H, 2xs); 7,11 y 7,13 (1H, 2xs); 7,32 y 7,34 (1H, 2xs amp); 7,90 (1H, s); 8,23 (1H, s); 8,79 (1H, s).

Compuesto No. 221 de la Tabla 13: usando 1,1-dimetil-2-prop-2-iniloxi-etilamina, p.f. 114-116°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,41 (3H, s); 1,44 (3H, s); 2,18 (3H, s); 2,50 (1H, t); 3,54 (2H, dd); 4,19 (2H, d); 5,61 (1H, s); 6,92 (1H, s amp); 7,10 (1H, s); 7,88 (1H, s); 8,22 (1H, d); 8,77 (1H, d).

Compuesto No. 251 de la Tabla 13: usando 4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 129-132°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,73 (6H, s); 2,20 (3H, s); 2,49 (3H, s); 3,37 (3H, s); 4,11 (2H, s); 5,63 (1H, s); 6,76 (1H, s amp); 7,10 (1H, s); 7,89 (1H, s); 8,21 (1H, d); 8,78 (1H, d).

EJEMPLO 3

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (Compuesto No. 12 de la Tabla 6)

Etapas 1. Preparación de 3-bromo-7-fluor-quinolin-6-ol

Paso 1

En un procedimiento similar al del Paso 1, Etapa 1 del Ejemplo 1, se trató 3-fluor-4-metoxi-fenilamina (2 g) en ácido acético (25 ml) con 2,2,3 tribromopropanal (4,2 g) para obtener 3-bromo-7-fluor-6-metoxi-quinolina (M^+ 258). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 4,02 (3H, s); 7,07 (1H, d); 7,75 (1H, d); 8,23 (1H, d); 8,78 (1H, d).

Paso 2

En un procedimiento similar al del Paso 1, Etapa 2 del Ejemplo 1, se trató 3-bromo-7-fluor-6-metoxi-quinolina del paso anterior con ácido bromhídrico para obtener 3-bromo-7-fluor-quinolin-6-ol (M^+ 244). RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ ppm: 7,35 (1H, d); 7,77 (1H, d); 8,59 (1H, d); 8,74 (1H, d), 10,93 (1H, s).

Etapa 2: Preparación de metil éster de ácido (3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil- acético

En un procedimiento similar al de la Etapa 2, Paso 2 del Ejemplo 1, se hizo reaccionar 3-bromo-7-fluor-quinolin-6-ol del paso anterior con 2-bromo-2-metiltioacetato de metilo de la Etapa 2, Paso 1 del Ejemplo 1, para obtener 3-bromo-7-fluor-quinolinil-6-oxi-2-metiltioacetato de metilo (M^+ 362). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 2,27 (3H, s); 3,89 (3H, s); 5,77 (1H, s) 7,26 (1H, d); 7,77 (1H, s); 8,23 (1H, s); 8,83 (1H, s).

Etapa 3: Preparación de ácido (3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético

En un procedimiento similar al de la Etapa 3 del Ejemplo 1, se hidrolizó 3-bromo-7-fluor-quinolinil-6-oxi-2-metiltio-acetato de metilo para obtener ácido (3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M^+ 348). RMN H^1 ($DMSO-d_6$) δ

ppm: 6,16 (1H, s); 7,71 (1H, d) 7,90 (1H, d); 8,62 (1H, d), 8,88 (1H, d), 13,69 (1H, s amp).

Etapa 4: Preparación de 2-(3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida

En un procedimiento similar al de la Etapa 4 del Ejemplo 1, se condensó ácido 2-(3-bromo-7-fluor-quinolinil-6-oxi)-2-metiltio acético con t-butilamina para obtener 2-(3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (p.f. 144-145°C, M⁺ 403). RMN H¹ (CDCl₃) δ ppm: 1,45 (9H, s); 2,19 (3H, s); 5,62 (1H, s); 6,62 (1H, s amp); 7,30 (1H, d); 7,79 (1H, d); 8,26 (1H, d), 8,84 (1H, d).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto No. 238 de la Tabla 6: usando 1,1-dimetil-prop-2-inilamina, p.f. 167-169°C; RMN H¹ (CDCl₃) δ ppm: 1,75 (6H, s); 2,21 (3H, s); 2,41 (1H, s); 2,50 (3H, s); 5,68 (1H, s); 6,89 (1H, s amp); 7,33 (1H, d); 7,79 (1H, d); 8,26 (1H, d); 8,84 (1H, d).

Compuesto No. 52 de la Tabla 6: usando 2-amino-3-metoxi-2-metil-propionitrilo, RMN H¹ (CDCl₃) δ ppm: mezcla diastereoisómerica (1/1); 1,81 y 1,83 (3H, 2xs); 2,21 y 2,22 (3H, 2xs); 3,52 y 3,54 (3H, 2xs); 3,64-3,84 (2H, 2xdd); 5,75 y 5,76 (1H, 2xs); 7,33-7,36 (2H, m); 7,80 (1H, d); 8,28 (1H, d); 8,85 (1H, d).

Compuesto No. 221 de la Tabla 6: usando 1,1-dimetil-2-prop-2-iniloxi-etilamina, p.f. 115-117°C; RMN H¹ (CDCl₃) δ ppm: 1,44 (3H, s); 1,46 (3H, s); 2,20 (3H, s); 2,45 (1H, t); 3,61 (2H, dd); 4,20 (2H, d); 5,63 (1H, s); 6,90 (1H, s amp); 7,28 (1H, d); 7,78 (1H, d); 8,26 (1H, d); 8,83 (1H, d).

Compuesto No. 251 de la Tabla 6: usando 4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 115-117°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,74 (6H, s); 2,21 (3H, s); 2,49 (3H, s); 3,38 (3H, s); 4,12 (2H, s); 5,65 (1H, s); 6,88 (1H, s amp); 7,31 (1H, d); 7,79 (1H, d); 8,26 (1H, d); 8,84 (1H, d).

Compuesto No. 244 de la Tabla 6: usando 1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 130-132°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,70 (6H, s); 1,83 (3H, s); 2,21 (3H, s); 5,65 (1H, s); 6,86 (1H, s amp); 7,31 (1H, d); 7,78 (1H, d); 8,25 (1H, d); 8,84 (1H, d).

Compuesto No. 68 de la Tabla 6: usando 2-etoxi-1,1-dimetil-etilamina, p.f. 111-113°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,21 (3H, t); 1,43 (H, s); 1,46 (3H, s); 2,20 (3H, s); 3,43 (2H, dd); 3,51-3,58 (2H, m), 5,63 (1H, s); 7,17 (1H, s amp); 7,28 (1H, d); 7,78 (1H, d); 8,25 (1H, d); 8,83 (1H, d).

Compuesto No. 277 de la Tabla 6: usando 5-metoxi-1,1-dimetil-pent-2-inilamina, p.f. 104-106°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,71 (6H, s); 2,20 (3H, s); 2,48 (2H, t); 3,37 (3H, s); 3,50 (2H, t); 5,65 (1H, s); 6,88 (1H, s amp); 7,31 (1H, d); 7,79 (1H, d); 8,26 (1H, d); 8,84 (1H, d).

Compuesto No. 256 de la Tabla 6: usando 6-cloro-1,1-dimetil-hex-2-inilamina, p.f. 95-97°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,70 (6H, s); 1,96 (2H, quin); 2,20 (3H, s); 2,90 (2H, t); 3,68 (2H, t); 3,50 (2H, t); 5,66 (1H, s); 6,87 (1H, s amp); 7,31 (1H, d); 7,79 (1H, d); 8,26 (1H, d); 8,84 (1H, d).

EJEMPLO 4

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida (Compuesto No. 12 de la Tabla 7)

Etapa 1: Preparación de 3-iodo-6-hidroxiquinolina

A una mezcla agitada de 3-bromo-7-fluor-6-hidroxiquinolina del Ejemplo 3, Etapa 1, Paso 2 (0,50 g), yoduro de sodio (0,62 g) y yoduro de cobre (0,08 g) en dioxano (3,0 ml) se agregó N,N,N',N'-tetrametil-etan-1,2-diamina (0,07 g) en un tubo sellado. La mezcla se agitó a 120°C durante 14 horas y luego de enfriarse se trató con amoníaco acuoso y a continuación ácido clorhídrico acuoso. La extracción con acetato de etilo, el secado de la fase orgánica sobre sulfato de magnesio, la filtración y evaporación bajo presión reducida proporcionó el producto buscado (M^+ 290) en forma de un polvo de color marrón claro que se usó como tal en el siguiente paso. RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 7,30 (1H, d); 7,72 (1H, d); 8,02 (1H, d), 8,73 (1H, d); 8,83 (1H, d), 10,88 (1H, s).

Etapa 2: Preparación de N-terc-butil-2-(3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-2-metilsulfanil-acetamida

En un procedimiento similar al de la Etapa 2, Paso 1 del Ejemplo 1, se hizo reaccionar 3-iodo-7-fluor-6-hidroxiquinolina con etil éster de ácido clorometilsulfanil-acético para obtener etil éster de ácido (3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M^+ 408).

En un procedimiento similar al de la Etapa 3 del Ejemplo 1, se hidrolizó etil éster de ácido (3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético para obtener ácido (3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético (M^+ 394).

En un procedimiento similar al de la Etapa 4 del Ejemplo 1, se condensó ácido (3-iodo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-metilsulfanil-acético con t-butilamina para obtener N-terc-butil-2-(3-iodo-quinolin-6-iloxi)-2-metilsulfanil-acetamida en forma de un sólido blanco (p.f. 165-166°C, M^+ 449).

RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,44 (9H, s); 2,18 (3H, s); 5,60 (1H, s); 6,62 (1H, s amp); 7,27 (1H, d); 7,76 (1H, dd); 8,47 (1H, d); 8,97 (1H, d).

Las siguientes amidas se prepararon usando un procedimiento similar.

Compuesto No. 238 de la Tabla 7: usando 1,1-dimetil-prop-2-inilamina, p.f. 150-152°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,75 (6H, s); 2,20 (3H, s); 2,40 (1H, s); 5,66 (1H, s); 6,88 (1H, s amp); 7,27 (1H, s); 7,77 (1H, s); 8,47 (1H, d); 8,97 (1H, d).

Compuesto No. 52 de la Tabla 7: usando 2-amino-3-metoxi-2-metil-propionitrilo, RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: mezcla diastereoisómerica (1/1); 1,82 y 1,84 (3H, 2xs); 2,20 y 2,22 (3H, 2xs); 3,53 y 3,54 (3H, 2xs); 3,64-3,84 (2H, 2xdd); 5,73 y 5,75 (1H, 2xs); 7,27-7,36 (3H, m); 7,77 (1H, d); 8,49 (1H, d); 8,98 (1H, s).

Compuesto No. 244 de la Tabla 7: usando 1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 142-145°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,70 (6H, s); 1,83 (3H, s); 2,20 (3H, s); 5,64 (1H, s); 6,87 (1H, s amp); 7,27 (1H, d); 7,76 (1H, d); 8,47 (1H, d); 8,96 (1H, d).

Compuesto No. 251 de la Tabla 7: usando 4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inilamina, p.f. 110-112°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,74 (6H, s); 2,20 (3H, s); 3,38 (3H, s); 4,13 (2H, s); 5,65 (1H, s); 6,89 (1H, s amp); 7,27 (1H, d); 7,78 (1H, d); 8,47 (1H, d); 8,97 (1H, d).

EJEMPLO 5

Este ejemplo ilustra la preparación de N-terc-butil-2-(7-fluor-3-tiofen-3-il-quinolin-6-iloxi)-2-metilsulfanil-acetamida (Compuesto No. 12 de la Tabla 30).

Etapas 1: se calentó una mezcla agitada de 2-(3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-terc-butil-2-metilsulfanil-acetamida del Ejemplo 3, Etapa 4 (160 mg), cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) (1,4 mg), ácido 3-tiofen borónico (56 mg) y carbonato de

sodio e hidrógeno (101 mg) en dioxano/agua (mezcla 1:1, 4,8 ml) a 70°C durante 14 horas. Luego de enfriarse, la mezcla de reacción se trató con carbonato de sodio e hidrógeno saturado acuoso (5 ml). La extracción con acetato de etilo, el secado de la fase orgánica sobre sulfato de magnesio, la filtración y evaporación bajo presión reducida proporcionó el producto en crudo que se fraccionó por cromatografía (sílice; hexano/acetato de etilo, 2:1 en volumen) para obtener el producto buscado en forma de un sólido blanco (p.f. 170-173°C, M+ 405). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,46 (9H, s); 2,20 (3H, s); 5,64 (1H, s); 6,66 (1H, s amp); 7,42 (1H, d); 7,51 (2H, m); 7,66 (1H, m), 7,80 (1H, d), 8,22 (1H, d); 9,13 (1H, d).

La siguiente amida se preparó usando un procedimiento similar.

Se preparó 2-(7-fluor-3-tiofen-3-il-quinolin-6-iloxi)-N-(4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inil)-2-metil-sulfanil-acetamida (Compuesto No. 251 de la Tabla 30) p.f. 132-134°C; RMN H^1 ($CDCl_3$) δ ppm: 1,75 (6H, s); 2,22 (3H, s); 3,39 (3H, s); 4,13 (2H, s); 5,68 (1H, s); 6,93 (1H, s amp); 7,42 (1H, d); 7,51 (2H, m); 7,66 (1H, m), 7,82 (1H, d), 8,22 (1H, d); 9,13 (1H, d), a partir de 2-(3-bromo-7-fluor-quinolin-6-iloxi)-N-(4-metoxi-1,1-dimetil-but-2-inil)-2-metilsulfanil-acetamida del Ejemplo 3, Etapa 4, más arriba.

EJEMPLO 6

Este Ejemplo ilustra las propiedades fungicidas de los compuestos de fórmula (I).

Los compuestos se evaluaron mediante un ensayo con discos foliares, según los métodos descritos a continuación. Los compuestos de prueba se disolvieron en DMSO y se diluyeron en agua a 200 ppm. En el caso de la prueba con *Pythium ultimum*, se disolvieron en DMSO y se diluyeron en agua a 20 ppm.

Erysiphe graminis f.sp. *tritici* (mildíu polvoriento del trigo): se colocaron segmentos de hojas de trigo sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Puccinia recondita f.sp. *tritici* (añublo marrón del trigo): Se colocaron segmentos de hojas de trigo sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto nueve días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Septoria nodorum (mancha de la gluma del trigo): Se colocaron segmentos de hojas de trigo sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Pyrenophora teres (mancha red de la cebada): Se colocaron segmentos de hojas de cebada sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Pyricularia oryzae ("quemado" del arroz): Se colocaron segmentos de hojas de arroz sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Botrytis cinerea (moho gris): Se colocaron discos de hojas de poroto sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Phytophthora infestans (tizón tardío de la papa en el tomate): Se colocaron discos de hojas de tomate sobre agar acuoso en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto cuatro días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Plasmopara viticola (mildíu vellosa de los viñedos): Se colocaron discos de hojas de vid sobre agar en una placa de 24 pocillos y se rociaron con una solución del compuesto de prueba. Después de dejar secar completamente, durante entre 12 y 24 horas, los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo. Después de la debida incubación, se confirmó la actividad de un compuesto siete días luego de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Septoria tritici (mancha foliar): Conidios del hongo almacenados criogénicamente se mezclaron directamente en caldo nutriente (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos de prueba en una placa para microtítulos (formato de 96 pocillos) se agregó el caldo nutriente con las esporas de hongos. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y se determinó la inhibición del crecimiento por fotometría 72 horas más tarde.

Fusarium culmorum (podredumbre de la raíz): Conidios del hongo almacenados criogénicamente se mezclaron directamente en caldo nutriente (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos de prueba en una placa para microtítulos (formato de 96 pocillos) se agregó el caldo nutriente con las esporas de hongos. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y se determinó la inhibición del crecimiento por fotometría 48 horas más tarde.

Pythium ultimum (ahogamiento): Fragmentos de micelios del hongo, preparados de un caldo de cultivo líquido fresco, se mezclaron en caldo de dextrosa de papa. Se diluyó una solución del compuesto de prueba en sulfóxido de dimetilo con agua a 20 ppm y entonces se colocó en una placa para microtítulos de 96 pocillos y se agregó el caldo nutriente con las esporas de hongos. La placa de prueba se incubó a 24°C y se determinó la inhibición del crecimiento por fotometría 48 horas más tarde.

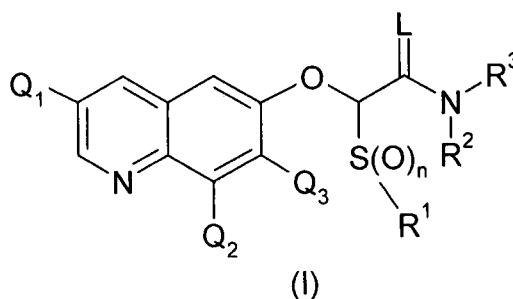
Con los siguientes compuestos (número del compuesto primero, seguido del número de tabla entre paréntesis) se obtuvo por lo menos un 60% de control de las siguientes infecciones fúngicas a 200 ppm:

Plasmopara viticola, compuestos 9 (6), 12 (7), 38 (6), 52 (6), 52 (7), 60 (6), 95 (6), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (7), 238 (10), 244 (6), 244 (7), 251 (2), 251 (7), 251 (10), 251 (13), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 277 (6), 278 (6), *Phytophthora infestans*, compuestos 12 (6), 12 (10), 52 (7), 52 (13), 221 (6), 221 (13), 238 (7), 238 (10), 238 (13), 244 (6), 244 (7), 251 (7), 251 (10), 256 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), *Erysiphe graminis* f.sp. *tritici*, compuestos 9 (6), 12 (6), 12 (13), 28 (6), 38 (6), 52 (6), 52 (7), 52 (13), 68 (6), 86 (6), 181 (6), 189 (6), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 238 (10), 238 (13), 244 (6), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 268 (6), 275 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), 281 (6), 284 (6), *Pyricularia oryzae*, compuestos 9 (6), 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 238 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 275 (7), 277 (6), 278 (6), *Puccinia recondita* f.sp. *tritici*, compuestos 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 238 (7), 251 (2), 264 (6), *Septoria nodorum*, compuestos 9 (6), 12 (2), 12 (7), 12 (10), 12 (13), 12 (30), 52 (6), 52 (7), 68 (6), 221 (6), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 244 (6), 244 (7), 244 (13), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 256 (6), 264 (6), 277 (6), 278 (6), 281 (6), *Septoria tritici*, compuestos 9 (6), 12 (6), 12 (7), 12 (13), 16 (13), 38 (6), 52 (2), 52 (6), 52 (7), 52 (13), 68 (6), 95 (6), 122 (6), 221 (6), 221 (13), 224 (6), 235 (6), 238 (6), 238 (7), 238 (13), 244 (2), 244 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 251 (2), 251 (30), 256 (6), 264 (6), 268 (6), 275 (7), 277 (6), 278 (6), 281 (6), 284 (6), 287 (6), 291 (6), *Fusarium culmorum*, compuestos 9 (6), 12 (6), 12 (7), 221 (6), 238 (6), 238 (7), 244 (6), 244 (7), 251 (6), 251 (7), 251 (13), 284 (6).

Con los siguientes compuestos (número de compuesto primero, seguido del número de tabla entre paréntesis) se obtuvo por lo menos un 60% de control de la siguiente infección fúngica a 20 ppm: *Pythium ultimum*, compuestos 9 (6), 12 (10), 52 (6), 52 (13), 221 (6), 221 (13), 235 (6), 238 (6), 244 (6), 251 (6), 251 (10), 251 (13), 251 (30), 264 (6), 275 (7), 278 (6), 281 (6).

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la Fórmula General I



donde

Q^1 , Q^2 y Q^3 , independientemente uno del otro, son halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, heterociclilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, que contiene por lo menos un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^0 , donde R^0 es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alquino(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alquinox(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, alquinox(C_{2-6}) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, arilalquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, arilalcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heteroarilalquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, heteroarilalcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, $-SF_5$ o $-S(O)_u$ alquilo(C_{1-6}), donde u es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q^1 , Q^2 y Q^3 , independientemente uno del otro, son $-OSO_2$ alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q^1 , Q^2 y Q^3 , independientemente uno del otro, son $-\text{CONR}^u\text{R}^v$, $-\text{COR}^u$, $-\text{CO}_2\text{R}^u$, $-\text{CR}^u=\text{NR}^v$, $-\text{NR}^u\text{R}^v$, $-\text{NR}^u\text{COR}^v$, $-\text{NR}^u\text{CO}_2\text{R}^v$, $-\text{SO}_2\text{NR}^u\text{R}^v$ o $-\text{NR}^u\text{SO}_2\text{R}^w$, donde R^w es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido y R^u y R^v , independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno, o, en el caso de $-\text{CONR}^u\text{R}^v$ o $-\text{SO}_2\text{NR}^u\text{R}^v$, R^uR^v se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o , donde R^o es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, o, en el caso de $-\text{CR}^u=\text{NR}^v$, R^v es hidroxilo o alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido o heteroariloxi opcionalmente sustituido, o

Q^1 y Q^2 , independientemente uno del otro, indican además hidrógeno,

R^1 es alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, alqueno(C_{2-4}) opcionalmente sustituido, alquino(C_{2-4}) opcionalmente sustituido o cicloalquilo(C_{3-4}) opcionalmente sustituido,

R^2 es hidrógeno, alquilo(C_{1-8}), cicloalquilo(C_{3-4}), alqueno(C_{2-8}), ciano, hidroxilo, alcoxi, cianoalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o benciloxialquilo(C_{1-4}), donde el anillo fenilo está opcionalmente sustituido con alcoxi(C_{1-4}),

R^3 es $-(\text{CR}^a\text{R}^b)_p(\text{CR}^c\text{R}^d)_q(\text{X})_r(\text{CR}^e\text{R}^f)_s\text{R}^4$, donde

R^a , R^b , R^c , R^d , R^e y R^f , independientemente uno del otro, son hidrógeno, alquilo(C_{1-4}), halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi(C_{1-4}) o alcóxicarbonilo(C_{1-4}), o

R^aR^b , R^cR^d o R^eR^f se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 8 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o , donde R^o es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido,

X es (CO), (CO)O, O(CO), O, S(O)_t, donde t es 0, 1 o 2, o X es NH o Nalquilo(C₁₋₆),

p, r y s, independientemente uno del otro, son 0 o 1,

q es 0, 1 o 2,

R⁴ es alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, alqueno(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, -CR^{uu}=NR^{vv}, donde R^{uu} es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) y R^{vv} es hidroxilo o alcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o -CH₂-C≡C-R⁵, donde

R⁵ es hidrógeno, alquilo(C₁₋₈) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquilo(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialkilo(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o R⁵ es cicloalkilo(C₃₋₆) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquilo(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialkilo(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o

R⁵ es cicloalkilo(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₄), donde la porción alquilo y/o cicloalkilo está opcionalmente sustituida con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquilo(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquilo(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialkilo(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o

R⁵ es arilo opcionalmente sustituido, arilalkilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, ariloxialquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heteroarilalkilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido o heteroariloxialquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, o

R^4 es cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, cicloalquenilo(C_{5-6}) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o un anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^0 , donde R^0 es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido, o

cuando R^3 es $-(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR^4$, R^2 y R^3 se pueden unir para formar un anillo de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo(C_{1-4}), mono- o di- alquilo(C_{1-4}) aminocarbonilo, y que opcionalmente contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^{00} , donde R^{00} es alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi(C_{1-6}) o ciano, o R^{00} es fenilo opcionalmente sustituido con nitro, alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alquilo(C_{1-4})carbonilo o heteroarilo, o R^2 y R^3 se pueden unir para formar un biciclo de 6,6 miembros opcionalmente sustituido,

R^3 es $-(CR^{30}R^{40})C\equiv CR^{50}$, donde

R^{30} y R^{40} , independientemente uno del otro, son hidrógeno, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-3}), alquenilo (C_{2-3}) o alquinilo(C_{2-3}), o

R^{30} y R^{40} se unen con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^{000} , donde R^{000} es hidrógeno o alquilo(C_{1-4}), donde el anillo carbocíclico o heterocíclico está opcionalmente sustituido con halo o alquilo(C_{1-4}),

R^{50} es hidrógeno, alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente

sustituido que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^{000} , donde R^{000} es hidrógeno o alquilo (C_{1-6}),

L es azufre u oxígeno, y

n es 0, 1 o 2, y

sales y N-óxidos de los compuestos de la Fórmula I.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^2 es hidrógeno, Q^1 y Q^3 son como se definieron en la reivindicación 1.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno, arilo o heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como se definió en la reivindicación 1.

4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es arilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como se definió en la reivindicación 1.

5. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es como se definió en la reivindicación 1.

6. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 y Q^3 son halógeno y Q^2 es hidrógeno.

7. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es arilo o heteroarilo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es halógeno.

8. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 y Q^2 son hidrógeno y Q^3 es halógeno o alquilo opcionalmente sustituido.

9. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es alquilo opcionalmente sustituido.

10. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 y Q^2 son halógeno y Q^3 es alquilo opcionalmente sustituido.
11. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es bromo.
12. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es yodo.
13. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es cloro.
14. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es flúor.
15. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^3 es halógeno.
16. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^3 es flúor.
17. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es bromo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es flúor.
18. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es bromo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es cloro.
19. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es yodo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es flúor.
20. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es yodo, Q^2 es hidrógeno y Q^3 es cloro.
21. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es hidrógeno, halógeno, arilo o heteroarilo.
22. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es alquilo(C_{1-4}) o haloalquilo(C_{1-4}).
23. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es metilo.
24. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^1 es etilo.

25. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^2 es hidrógeno o metilo.

26. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^2 es hidrógeno.

27. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 , Q^2 y Q^3 son halógeno.

28. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es halógeno.

29. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 28, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es cloro.

30. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 28, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es alquilo(C_{1-4}) y Q^3 es flúor.

31. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es halógeno.

32. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

33. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es halógeno, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

34. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es bromo, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

35. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es bromo, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

36. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es yodo, Q^2 es metilo y Q^3 es cloro.

37. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 31, donde Q^1 es yodo, Q^2 es metilo y Q^3 es flúor.

38. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q^1 es halógeno y Q^2 y Q^3 son alquilo(C_{1-4}).

39. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^3 es terc-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1,1-dihalo-2-metilprop-2-ilo, 1,1,1-trihalo-2-metilprop-2-ilo, 1-alcoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alqueniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-alquiniloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-ciano-2-metil-prop-2-ilo, 1-alcoxialcoxi-2-metil-prop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1,1-dihalo-3-metilbut-3-ilo, 1,1,1-trihalo-3-metilbut-3-ilo, 1-alcoxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alqueniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-alquiniloxi-3-metilbut-3-ilo, 1-ciano-3-metilbut-3-ilo, 2-cianoprop-2-ilo, 2-metoxycarbonilprop-2-ilo o 2-metilaminocarbonilprop-2-ilo, 1-alquiltio-2-metilprop-2-ilo, 1-alquilsulfinil-2-metilprop-2-ilo, 1-alquilsulfonil-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-alcoxiprop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-hidroxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-alcoxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-ariloxiimino]-prop-2-ilo, 2-metil-1-[(E y/o Z)-heteroariloxiimino]-prop-2-ilo, 1-alcoxi-prop-2-ilo, 1-halo-prop-2-ilo, 3-metil-but-1-in-3-ilo, 1-alquil-3-metil-but-1-in-3-ilo, 4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-hidroxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxialcoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-alcoxialcoxialquil-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-cianoalquil-3-metilbut-3-ilo, 1-haloalquil-3-metilbut-3-ilo.

40. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 39, donde R^3 es terc-butilo, 1-halo-2-metilprop-2-ilo, 1-fluor-2-metilprop-2-ilo, 1-metoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-etoxi-2-metilprop-2-ilo, 1-aliloxi-2-metilprop-2-ilo, 1-(prop-2-iniloxi)-2-metilprop-2-ilo, 2-ciano-1-etoxi-prop-2-ilo, 2-ciano-1-metoxiprop-2-ilo, 1-halo-3-metilbut-3-ilo, 1-fluor-3-metilbut-3-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo, 5-metil-hex-3-in-5-ilo, 1-

metoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-aliloxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-propargiloxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo, 1-etoxi-4-metil-pent-2-in-4-ilo.

41. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino o trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con benciloxialquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino o trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con alqueniloxi(C_{2-6}) o $-S(O)_x$ alquilo(C_{1-6}), donde x es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, mono- o di-alquilo(C_{1-6})amino, $-NH$ alquilo(C_{1-4})=NOR, donde R es hidrógeno o alquilo(C_{1-4}), o donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con trialquilo(C_{1-4})sililo, o R^4 es $-CR^{uu}=NR^{vv}$, donde R^{uu} es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) y R^{vv} es hidroxilo o alcoxi(C_{1-6}) opcionalmente sustituido.

42. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde los anillos o porciones arilo opcionalmente sustituido y heteroarilo opcionalmente sustituido de los valores R_5 están opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-6}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), alquenilo(C_{2-6}), haloalquenilo(C_{2-6}), alquinilo(C_{2-6}), haloalquinilo(C_{2-6}), alcoxi(C_{1-6}), haloalcoxi(C_{1-6}), alqueniloxi(C_{2-6}), haloalqueniloxi(C_{2-6}), alquiniloxi(C_{2-6}), haloalquiniloxi(C_{2-6}), arilo, ariloxi, arilalquilo(C_{1-6}), arilalcoxi(C_{1-6}), heteroarilo, heteroariloxi, heteroarilalquilo(C_{1-6}), heteroarilalcoxi(C_{1-6}), $-SF_5$, $-S(O)_g$ alquilo(C_{1-4}) donde g es 0, 1 o 2 y el alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^5 está opcionalmente sustituido con $-OSO_2$ alquilo(C_{1-4}), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^5 está opcionalmente sustituido con

$-\text{CONR}^g\text{R}^h$, $-\text{COR}^g$, $-\text{CO}_2\text{R}^g$, $-\text{R}^g=\text{NR}^h$, $-\text{NR}^g\text{R}^h$, $-\text{NR}^g\text{COR}^h$, $-\text{NR}^g\text{CO}_2\text{R}^h$, $-\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$ o $-\text{NR}^g\text{SO}_2\text{R}^i$, donde R^i es alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno y R^g y R^h , independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno, o, en el caso de $-\text{CONR}^g\text{R}^h$ o $-\text{SO}_2\text{NR}^g\text{R}^h$, R^gR^h se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR^0 , donde R^0 es hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido.

43. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde el anillo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o el anillo de 5 a 8 miembros opcionalmente sustituido R^4 está opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C_{1-6}), haloalquilo(C_{1-6}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), alqueno(C_{2-6}), haloalqueno(C_{2-6}), alquino(C_{2-6}), haloalquino(C_{2-6}), alcoxi(C_{1-6}), haloalcoxi(C_{1-6}), alquenoilo(C_{2-6}), haloalquenoilo(C_{2-6}), alquinoilo(C_{2-6}), haloalquinoilo(C_{2-6}), $-\text{SF}_5$, $-\text{S}(\text{O})_x\text{alquilo}(\text{C}_{1-6})$, donde x es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halo, o R^4 está opcionalmente sustituido con $-\text{OSO}_2\text{alquilo}(\text{C}_{1-4})$, donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, $-\text{CONR}^x\text{R}^y$, $-\text{CON}(\text{OR}^x)\text{R}^y$, $-\text{COR}^x$, $-\text{CO}_2\text{R}^x$, $-\text{CR}^x=\text{NR}^y$, $-\text{NR}^x\text{R}^y$, $-\text{NR}^x\text{COR}^y$, $-\text{NR}^x\text{CO}_2\text{R}^y$, $-\text{SO}_2\text{NR}^x\text{R}^y$ o $-\text{NR}^x\text{SO}_2\text{R}^z$, donde R^z es alquilo(C_{1-8}) opcionalmente sustituido con halógeno y R^x y R^y , independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C_{1-6}) opcionalmente sustituido con halógeno.

44. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^{50} es alquilo(C_{1-4}) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C_{1-6}), alqueno(C_{2-6}), alquino(C_{2-6}), alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4}), ciano, alquilo(C_{1-4})carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di-alquilo(C_{1-4})amino-carbonilo, $\text{S}(\text{O})_p\text{alquilo}(\text{C}_{1-6})$, donde p es 0, 1 o 2, triazolilo, pirazolilo, imidazolilo, trialquilo(C_{1-4})sililo, fenoxi

opcionalmente sustituido, tieniloxi opcionalmente sustituido, benciloxi opcionalmente sustituido o tienilmetoxi opcionalmente sustituido.

45. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde R^{50} es cicloalquilo(C_{3-6}) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C_{1-6}), alcoxi(C_{1-4})alcoxi(C_{1-4}), ciano, alquilo(C_{1-4})carboniloxi, aminocarboniloxi, mono- o di-alquilo(C_{1-4})amino-carboniloxi, $S(O)_p$ alquilo(C_{1-6}), donde p es 0, 1 o 2, triazolilo, pirazolilo, imidazolilo, trialkilosililoxi(C_{1-4}), fenoxi opcionalmente sustituido, tieniloxi opcionalmente sustituido, benciloxi opcionalmente sustituido o tienilmetoxi opcionalmente sustituido.

46. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde el arilo opcionalmente sustituido o el heteroarilo opcionalmente sustituido R^{50} está opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, mercapto, alquilo(C_{1-4}), alqueno(C_{2-4}), alquino(C_{2-4}), alcoxi(C_{1-4}), alquenoiloxi(C_{2-4}), alquinoiloxi(C_{2-4}), haloalquilo(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), haloalquiltio(C_{1-4}), hidroxialquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenoxi, benciloxi, benzoiloxi, ciano, isociano, tiocianato, isotiocianato, nitro, NR^pR^q , $NHCOR^p$, $-NHCONR^pR^q$, $CONR^pR^q$, $-SO_2R^o$, OSO_2R^o , COR^p , $CR^p=NR^q$ o $N=CR^pR^q$, donde R^o es alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}), y R^p y R^q son independientemente hidrógeno, alquilo(C_{1-4}), haloalquilo(C_{1-4}), alcoxi(C_{1-4}), haloalcoxi(C_{1-4}), alquiltio(C_{1-4}), cicloalquilo(C_{3-6}), cicloalquilo(C_{3-6})alquilo(C_{1-4}), fenilo o bencilo, los grupos fenilo y bencilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, alquilo(C_{1-4}) o alcoxi(C_{1-4}).

47. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde L es oxígeno.

48. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, donde n es 0.

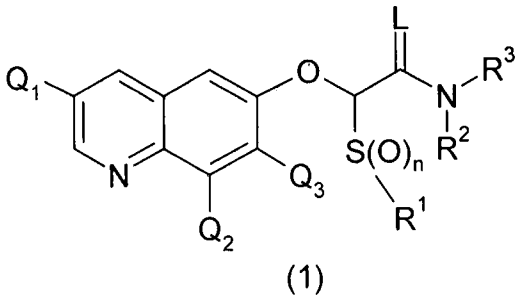
49. Un proceso para preparar un compuesto de la Fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 como se describe en la presente.

50. Una composición fungicida que comprende una cantidad efectiva como fungicida de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y un vehículo o diluyente adecuado para el mismo.

51. Un método para combatir o controlar hongos fitopatógenicos que comprende aplicar una cantidad efectiva como fungicida de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a una planta, a una semilla de una planta, al locus de la planta o semilla o al suelo o cualquier otro medio para el crecimiento de una planta.

RESUMEN

Los compuestos de la Fórmula General



donde los sustituyentes son como se definió en la reivindicación 1, son útiles como fungicidas.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION PCT X MODELO DE UTILIDAD DISEÑO INDUSTRIAL

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional :

(71) Solicitante(s) **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

(72) Inventor(es) **FIONA MURPHY KESSABI, RENAUD BEAUDEGNIES, LAURA QUARANTA, HANS-GEORG BRUNNER, FREDRIK CEDERBAUM**

(74) Apoderado: **DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

(30) Prioridad

(31) No. Prioridad

32)

Fecha

(33)

País

0617574.9

06/09/2006

GB

(85) Fecha inicio fase nacional:

(87) Publicación internacional

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

Fecha: **13/03/2008**

Fecha de presentación de la solicitud: **04/09/2007**

N° publicación: **WO 2008/028624 A1**

No. de solicitud **PCT/EP2007/007700**

(34) Título: **FUNGICIDAS**



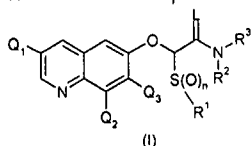
Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

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.:	
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG	
(30) Prioridad	(31) N° Prioridad 0617574.9	32) Fecha 06/09/2006	(33) País GB
		(72) Inventor(es) FIONA MURPHY KESSABI RENAUD BEAUDEGNIES LAURA QUARANTA HANS-GEORG BRUNNER FREDRIK CEDERBAUM	
		(74) Apoderado: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO	
(85)	Fecha limite inicio fase nacional:		(87)
(86)	Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Publicación internacional
	Fecha de presentación de la solicitud: 04/09/2007		Fecha: 13/03/2008
	N° de solicitud PCT/EP2007/007700		N° publicación: WO 2008/028624 A1
(54) Titulo: FUNGICIDAS			

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de la Fórmula General I



donde

Q¹, Q² y Q³, independientemente uno del otro, son halógeno, ciano, nitro, azido, alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₃₋₆) opcionalmente sustituido, heterocíclico(C₃₋₆) opcionalmente sustituido, que contiene por lo menos un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno o NR⁰, donde R⁰ es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, cicloalquilo(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, alquénilo(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alquínilo(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, alquénilo(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, alquínilo(C₂₋₆) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, arilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilalquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilalcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heteroarilalquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, heteroarilalcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, -SF₅ o -S(O)_ualquilo(C₁₋₆), donde u es 0, 1 o 2 y el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q1, Q2 y Q3, independientemente uno del otro, son -OSO₂alquilo(C1-4), donde el grupo alquilo está opcionalmente sustituido con halógeno, o

Q¹, Q² y Q³, independientemente uno del otro, son -CONR^uR^v, -COR^u, -CO₂R^u, -CR^u=NR^v, -NR^uR^v, -NR^uCOR^v, -NR^uCO₂R^v, -SO₂NR^uR^v o -NR^uSO₂R^w, donde R^w es alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido y R^u y R^v, independientemente uno del otro, son hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido con halógeno, o, en el caso de -CONR^uR^v o -SO₂NR^uR^v, R^uR^v se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, o, en el caso de -CR^u=NR^v, R^v es hidroxilo o alcoxi(C₁₋₆) opcionalmente sustituido, arilo o arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o

Q¹ y Q², independientemente uno del otro, indican además hidrógeno,

R¹ es alquilo(C₁₋₄) opcionalmente sustituido, alqueni(C₂₋₄) opcionalmente sustituido, alquini(C₂₋₄) opcionalmente sustituido o cicloalquilo(C₃₋₄)opcionalmente sustituido, R² es hidrógeno, alquilo(C₁₋₈), cicloalquilo(C₃₋₄), alqueni(C₂₋₈), ciano, hidroxilo, alcoxi, cianoalquilo(C₁₋₄), alcoxi(C₁₋₄)alquilo(C₁₋₄), alcoxi(C₁₋₄)alcoxi(C₁₋₄)alquilo(C₁₋₄) o benciloxialquilo(C₁₋₄), donde el anillo fenilo está opcionalmente sustituido con alcoxi(C₁₋₄).

R³ es -(CR^aR^b)_p(CR^cR^d)_q(X)_r(CR^eR^f)_sR⁴, donde
R^a, R^b, R^c, R^d, R^e y R^f, independientemente uno del otro, son
hidrógeno, alquilo(C₁₋₄), halógeno, ciano, hidroxi, alcoxi(C₁₋₄) o
alcoxicarbonilo(C₁₋₄), o

R^aR^b, R^cR^d o R^eR^f se pueden unir para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3 a 8 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado entre azufre, oxígeno y NR^o, donde R^o es hidrógeno o alquilo(C₁₋₆) opcionalmente sustituido.

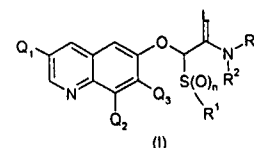
X es (CO), (CO)O, O(CO), O, S(O)_t, donde t es 0, 1 o 2, o X es NH o Nalquilo(C₁₋₆).

p, r y s , independientemente uno del otro, son 0 o 1,

q es 0, 1 o 2,

R⁴ es alquilo(C1-6) opcionalmente sustituido, alqueno(C2-6) opcionalmente sustituido, -CR^{uu}=NR^w, donde R^{uu} es hidrógeno o alquilo(C1-6) y R^w es hidróxido o alcoxi(C1-6) opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido, o -CH₂-C≡C-R⁵, donde

R⁵ es hidrógeno, alquilo(C₁₋₈) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquil(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquil(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialkil(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o R⁵ es cicloalquilo(C₃₋₆) opcionalmente sustituido con halógeno, hidroxilo, alcoxi(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₃)alcoxi(C₁₋₃), ciano, alquil(C₁₋₄)carbonilo, aminocarbonilo, mono- o di- alquil(C₁₋₄)aminocarbonilo, trialkil(C₁₋₄)sililo o -S(O)_galquilo(C₁₋₆), donde g es 0, 1 o 2, o



DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT

El (los) suscrito (s), en su calidad de inventor (es) de

FUNGICIDAS.

declara (an) que cede (n) y traspasa (n) todos los derechos que les correspondan en y sobre el invento atrás mencionado a **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland**, en cuanto se refiere a la República de Colombia.

The undersigned, as inventor (s) of

FUNGICIDES

hereby declare (s) that assign (s) all the rights in and to the aforementioned invention to **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, as far as the Republic of Colombia is concerned.

Fiona Murphy Kessabi

Fiona MURPHY KESSABI,
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG,
Schaffhauserstrasse, 4332 Stein, Switzerland,
citizen of Ireland

FIRMA DEL CEDENTE
domiciliado en

Renaud Beaudegnies

Renaud BEAUDEGNIES,
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG,
Schaffhauserstrasse, 4332 Stein, Switzerland,
citizen of Belgium

Laura Quaranta

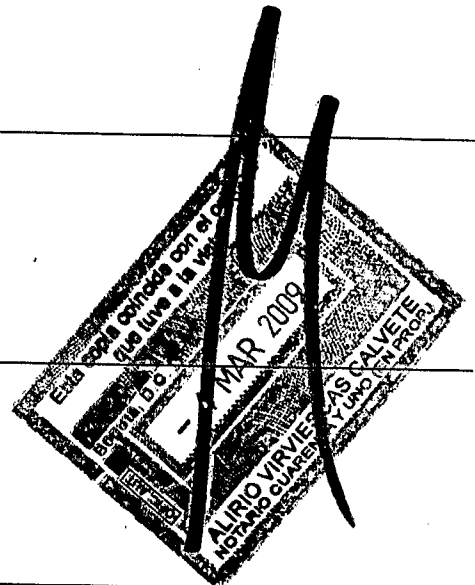
Laura QUARANTA,
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG,
Schaffhauserstrasse, 4332 Stein, Switzerland,
citizen of Italy

Hans-Georg Brunner

Hans-Georg BRUNNER,
Wannenstrasse 14, 4415 Lausen, Switzerland,
citizen of Switzerland

Fredrik Cederbaum

Fredrik CEDERBAUM,
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG,
Schaffhauserstrasse, 4332 Stein, Switzerland,
citizen of Sweden



Attestation

I, the undersigned, notary public of Basel, Switzerland, Dr. Roland M. Müller, certify herewith the authenticity of the signature attached heretofore of **Ms. Fiona Murphy Kessabi**, Irish citizen, residing in Basel/Switzerland; of **Mr. Renaud Beaudegnies**, Belgian citizen, residing in Movelier/Switzerland; of **Ms. Laura Quaranta**, Italian citizen, residing in Basel/Switzerland; of **Mr. Hans-Georg Brunner**, citizen of Uster/Switzerland, residing in Lausen/Switzerland; and of **Mr. Fredrick Cederbaum**, Swedish citizen, residing in Hofstetten/Switzerland.

The authenticity of the signature was established by means of comparison.

BASEL (SWITZERLAND), this 30th (thirtieth) day of January 2009 (twothousandandnine)

[Handwritten signature of Dr. R. M. Müller]
[Handwritten signature]

Dr. R. M. Müller
Notar in Basel

Leg.Prot.Nr. 58 /2009

APOSTILLE
(Hague Convention of October 5th, 1961)

1. Country: Switzerland (Schweiz / Suisse)
This official document

2. is signed by *Dr. Müller*
R. Müller

3. in his/her function as *off. Notar*

4. and certified by the seal of the *Gemeinde*

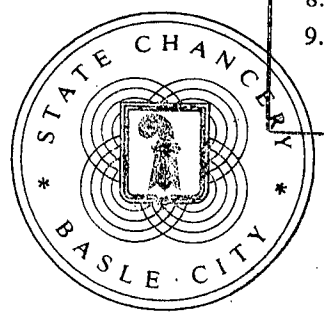
Certified

5. in Basel (Bâle) 6. on *2 Feb. 2009*

7. by the State Chancery of the Canton of Basel-Stadt

8. no. *669/020*

9. Seal /stamp: 10. Signature: *H. Lauener*
Hanna Lauener



TRADUCCION OFICIAL No. 053-09, DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLÉS, SELLADO CON EL SELLO DEL SUSCRITO TRADUCTOR OFICIAL, HOY MARZO 3, 2009, EN LA CIUDAD DE BOGOTÁ D.C., REPÚBLICA DE COLOMBIA.

(DOCUMENTO DE CESION DE SYNGENTA PARTICIPATIONS AG ESCRITO EN ESPAÑOL).

En la parte posterior del documento se encuentra lo siguiente:

CERTIFICACIÓN

Yo, el suscrito Notario Público de Basel, Suiza, Dr. Roland M. Müller, certificado por medio del presente la autenticidad de la anterior firma de Ms.DFiona Myrphy Kessabi, Ciudadano Irlandés, residente en Basel/ Suiza; del Sr. Renaud Beaudegnies, Ciudadano Belga, residente en Movelier/Suiza; de Ms. Laura Quaranta, ciudadana Italiana, residente en Basel/ Suiza; del Sr. Hans-Georg Brunner, ciudadano de Uster/Suiza, residente en Lausen/ Suiza; y del Sr. Fredrick Cederbaum, Ciudadano Sueco, residente en Hosftetten/Suiza.

La autenticidad de la firma fue establecida por medio de comparación.

Basel, (Suiza), este día 30 (treinta) de Enero del 2009 (dos mil nueve)

Firma y sello de

DR. R. M. Müller



Traductor e Interprete Oficial
Resol. No. 2839 Minjusticia 1991

NOTARIO

PROT. LEG. No.58/2009

APOSTILLE

(CONVENCION DE LA HAYE DE 5 OCTOBRE 1961)

- 1. PAIS: SUIZA
- ESTE DOCUMENTO PUBLICO
- 2. HA SIDO FIRMADO POR: DR. R.M. MÜLLER
- 3. ACTUANDO EN CAPACIDAD DE: NOTARIO PUBLICO
- 4. Y CERTIFICADO POR EL SELLO DE: GEN ANNISTERN

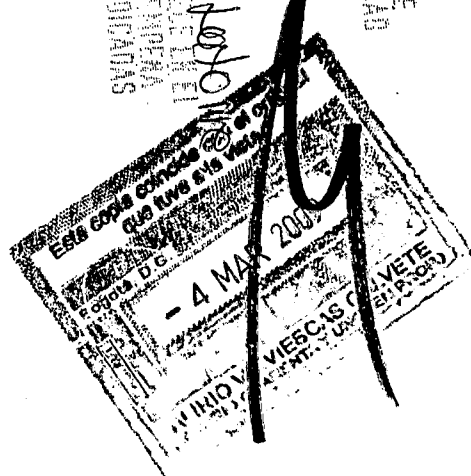
CERTIFICADO

- 5. EN: BASEL (BALE)
- 6. EL DIA: FEB. 2, 2009
- 7. POR: EL CANCELLER DE ESTADO DEL CANTON DE BASEL-STADT
- 8. No. 669/ 1220
- 9. SELLO/ESTAMPILLA
- 10. FIRMA

FIRMADO POR:
HANNA LAUENER

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
2009 MAR - 3
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

882854
RESPONSABILIDAD
DEL TEXTO
882854



Sergio Eleuterio Jarama Mendoza
Traductor e Interpretre Oficial
Resol. No. 2839 Minjusticia 1991

20

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
Apoderado(a) y/o Representante de
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

REFERENCIA	Radicación No.	9 22189
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/007700
	Fecha inicio fase nacional	06/04/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	5099

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. El solicitante debe presentar un nuevo título que permita identificar la materia de la cual trata la solicitud, ya que el título relacionado no se encuentra con la precisión necesaria para identificar claramente el objeto de la solicitud de patente. (Regla 4.3 PCT, Art 26-27 D-486, Circular única 5.2.9)

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 10 8 MAYO 2009
jfernand