



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

República de Colombia
Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

SUPERINTENDENCIA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL
INVENTARIO

OK
267

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD DE

**PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL**

09 - 3380

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO: NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA

52. CLASIFICACION INTERNACIONAL: C07D 401/04, A01N 43/58

71. SOLICITANTE: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO: Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea -
SUIZA

74. APODERADO: Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.

22. BOGOTA, D.C., 16 ENE. 2009



No. 09-003380- -00000-0000

adicación

Fecha: 2009-01-16 15:19:42 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 177

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 ☐

Cual

Número

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 ☐

Cual

Número 39'779.654 TPA 70,819

④

INVENTOR (ES) (72)

STEPHAN TRAH

Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
4058 Basilea - SUIZA

SEBASTIAN VOLKER WENDEBORN

Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
4058 Basilea - SUIZA

CLEMENS LAMBERTH

Syngenta Crop Protection AG
Schwarzwaldallee 215
4058 Basilea - SUIZA

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2007/006304

Fecha 16/07/2007

Publicación Internacional No. WO 2008/009406

Fecha 24/01/2008

⑥

Título (54)

NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07D 401/04, A01N 43/58

⑧

Prioridad

(33) Pais de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐

GB

17/07/2006

0614153,5

⑨

Comprobante de pago No.

094,005 y 09-4,006

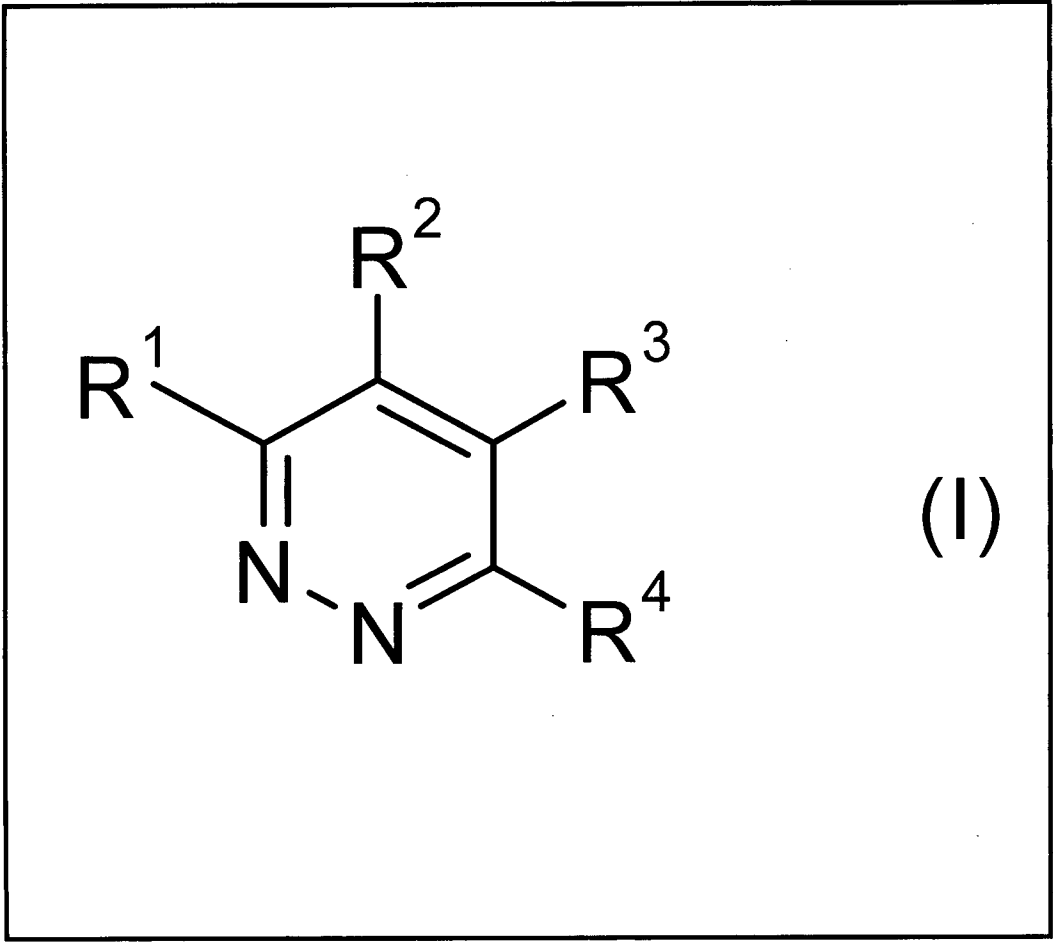
Fecha Enero 16 de 2009

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:

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

16 ENE. 2009

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
24 January 2008 (24.01.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/009406 A1

(51) International Patent Classification:

C07D 401/04 (2006.01) C07D 409/04 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01) C07D 417/04 (2006.01)
C07D 407/04 (2006.01) A01N 43/58 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/EP2007/006304

(22) International Filing Date: 16 July 2007 (16.07.2007)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:

0614153.5 17 July 2006 (17.07.2006) GB

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

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): TRAH, Stephan [DE/CH]; Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). LAMBERTH, Clemens [DE/CH]; Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). WENDEBORN, Sebastian, Volker [DE/CH]; Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).

(74) Common Representative: SYNGENTA PARTICIPATIONS 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:

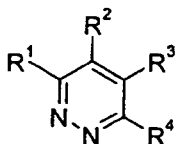
— with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.



WO 2008/009406 A1

(54) Title: NOVEL PYRIDAZINE DERIVATIVES



(I)

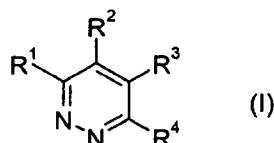
(57) Abstract: The present invention relates to novel pyridazine derivatives of formula I as active ingredients which have microbiocidal activity, in particular fungicidal activity: wherein R¹ is hydrogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl or C₃-C₆cycloalkyl; R² is an optionally substituted heteroaryl; R³ is an optionally substituted aryl; and R⁴ is hydrogen, halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, (VC)haloalkoxy, hydroxy or cyano; or an agrochemically usable salt form thereof.

- 1 -

Novel pyridazine derivatives

The present invention relates to novel pyridazine derivatives as active ingredients which have microbiocidal activity, in particular fungicidal activity. The invention also relates to preparation of these active ingredients, to novel heterocyclic derivatives used as intermediates in the preparation of these active ingredients, to preparation of these novel intermediates, to agrochemical compositions which comprise at least one of the novel active ingredients, to preparation of these compositions and to use of the active ingredients or compositions in agriculture or horticulture for controlling or preventing infestation of plants, harvested food crops or non-living materials by phytopathogenic microorganisms, preferably fungi.

The present invention provides a compound of formula I:



wherein

- 15 R¹ is hydrogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl or C₃-C₆cycloalkyl;
R² is an optionally substituted heteroaryl;
R³ is an optionally substituted aryl; and
R⁴ is hydrogen, halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy, hydroxy or cyano;
20 or an agrochemically usable salt form thereof.

In the above definition aryl includes aromatic hydrocarbon rings like phenyl, naphthyl, anthracenyl, phenanthrenyl and biphenyl, with phenyl being preferred.

- 25 Heteroaryl stands for aromatic ring systems comprising mono-, bi- or tricyclic systems wherein at least one oxygen, nitrogen or sulfur atom is present as a ring member. Examples are furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl,

- 2 -

pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothiophenyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinoliny, quinolyl, isoquinoliny, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxaliny, quinazolinyl, cinnoliny and naphthyridinyl. Each heteroaryl can be linked by a carbon atom or by a nitrogen atom to the pyridazine.

5

The above aryl and heteroaryl groups may be optionally substituted. This means that they may carry one or more identical or different substituents. Normally not more than three substituents are present at the same time. Examples of substituents of aryl or heteroaryl groups are: halogen, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkenyl, haloalkenyl, cycloalkenyl, alkynyl, haloalkynyl, alkyloxy, haloalkyloxy, cycloalkoxy, alkenyloxy, haloalkenyloxy, alkynyloxy, haloalkenyloxy, alkylthio, haloalkylthio, cycloalkylthio, alkenylthio, alkynylthio, alkylcarbonyl, haloalkylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkynylcarbonyl, alkoxyalkyl, cyano, nitro, hydroxy, mercapto, amino, alkylamino, dialkylamino. Typical examples for optionally substituted aryl include 2-fluorophenyl, 2-chlorophenyl, 2-trifluoromethylphenyl, 2-methylphenyl, 2,3-difluorophenyl, 2,4-difluorophenyl, 2,5-difluorophenyl, 2,6-difluorophenyl, 2,3-dichlorophenyl, 2,4-dichlorophenyl, 2,5-dichlorophenyl, 2,6-dichlorophenyl, 2-chloro-3-fluorophenyl, 2-chloro-4-fluorophenyl, 2-chloro-5-fluorophenyl, 2-chloro-6-fluorophenyl, 3-chloro-2-fluorophenyl, 4-chloro-2-fluorophenyl, 5-chloro-2-fluorophenyl, 2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl, 2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl, 2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl, 2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl, 2-chloro-3-trifluoromethylphenyl, 2-chloro-4-trifluoromethylphenyl, 2-chloro-5-trifluoromethylphenyl, 2-chloro-6-trifluoromethylphenyl, 4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl, 4-chloro-2-trifluoromethylphenyl, 2-fluoro-3-methylphenyl, 2-fluoro-4-methylphenyl, 2-fluoro-5-methylphenyl, 2-fluoro-6-methylphenyl, 2-chloro-3-methylphenyl, 2-chloro-4-methylphenyl, 2-chloro-5-methylphenyl, 2-chloro-6-methylphenyl, 4-fluoro-2-methylphenyl, 4-chloro-2-methylphenyl, 2,4,6-trifluorophenyl, 2,3,6-trifluorophenyl, 2,3,4-trifluorophenyl, 2,4,6-trichlorophenyl, 2,3,6-trichlorophenyl, 2,3,4-trichlorophenyl, 2,6-difluoro-4-methoxyphenyl, 2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl, 2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl, 2,6-difluoro-4-cyanophenyl, 2,6-difluoro-4-methylphenyl, 2,6-dichloro-4-methoxyphenyl, 2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl, 2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl, 2,6-dichloro-4-cyanophenyl, 2,6-dichloro-4-methylphenyl, pentafluorophenyl. Typical examples for optionally substituted heteroaryl include 5-chlorothiophen-2-yl, 4-bromo-5-methylthiophen-2-yl, 4-bromothiophen-2-

10

15

20

25

30

- 3 -

yl, 5-bromothiophen-2-yl, 5-methylthiophen-2-yl, 5-bromofuran-2-yl, 4,5-dimethylfuran-2-yl, 5-methylfuran-2-yl, 5-chlorofuran-2-yl, 3-methylisothiazol-4-yl, 5-methylisoxazol-3-yl, 6-chloropyridin-2-yl, 6-methylpyridin-2-yl, 6-chloropyridin-3-yl, 6-bromopyridin-3-yl, 5-bromopyridin-3-yl, 6-methylpyridin-3-yl, 6-methoxypyridin-3-yl, 5,6-dichloropyridin-3-yl, 2-chloropyridin-4-yl, 2-methylpyridin-4-yl, 2,6-dichloropyridin-4-yl, 2-methylpyrimidin-4-yl.

In the above definition halogen is fluorine, chlorine, bromine or iodine.

The alkyl, alkenyl or alkynyl radicals may be straight-chained or branched.

Alkyl on its own or as part of another substituent is, depending upon the number of carbon atoms mentioned, for example, methyl, ethyl, propyl, butyl, pentyl, hexyl and the isomers thereof, for example, isopropyl, isobutyl, sec-butyl, tert-butyl, isopentyl or tert-pentyl.

A haloalkyl group may contain one or more identical or different halogen atoms and, for example, may stand for CH_2Cl , CHCl_2 , CCl_3 , CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CF_3CH_2 , CH_3CF_2 , CF_3CF_2 or CCl_3CCl_2 .

Cycloalkyl on its own or as part of another substituent is, depending upon the number of carbon atoms mentioned, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl or cyclohexyl.

Alkenyl on its own or as part of another substituent is, depending upon the number of carbon atoms mentioned, for example, ethenyl, allyl, 1-propenyl, buten-2-yl, buten-3-yl, penten-1-yl, penten-3-yl, hexen-1-yl or 4-methyl-3-pentenyl.

Alkynyl on its own or as part of another substituent is, depending upon the number of carbon atoms mentioned, for example, ethynyl, propyn-1-yl, propyn-2-yl, butyn-1-yl, butyn-2-yl, 1-methyl-2-butyne, hexyn-1-yl or 1-ethyl-2-butyne.

The presence of one or more possible asymmetric carbon atoms in a compound of formula I means that the compounds may occur in optically isomeric, that means enantiomeric or diastereomeric forms. As a result of the presence of a possible aliphatic

- 4 -

C=C double bond, geometric isomerism, that means cis-trans or (E)-(Z) isomerism may also occur. Also atropisomers may occur as a result of restricted rotation about a single bond. Formula I is intended to include all those possible isomeric forms and mixtures thereof. The present invention intends to include all those possible isomeric forms and mixtures thereof

5 for a compound of formula I.

In a first embodiment, R¹ is C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl or C₃-C₆cycloalkyl.

In a second embodiment, R² is an optionally substituted furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothiophenyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolinyl, quinolyl, isoquinolinyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalinyl, quinazolinyl, cinnolinyl or naphthyridinyl.

10

15

In a third embodiment, R³ is an optionally substituted R³ is an optionally substituted phenyl, naphthyl, anthracenyl, phenanthrenyl, or biphenyl.

In a fourth embodiment, R⁴ halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy, hydroxy or cyano.

20

Preferred subgroups of compounds of formula I according to the invention are those wherein R¹ is C₁-C₆alkyl or C₁-C₆haloalkyl;

R² is an optionally substituted furyl, thienyl imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, benzothiophenyl, benzofuranyl, benzothiazolyl, quinolyl or quinoxalinyl;

25

R³ is an optionally substituted phenyl, naphthyl or biphenyl; and

R⁴ is halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy or hydroxy.

More preferred subgroups of compounds of formula I according to the invention are those wherein

30

R¹ is C₁-C₆alkyl;

- 5 -

R² is an optionally substituted furyl, thienyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or benzofuranyl;
R³ is an optionally substituted phenyl or naphthyl; and
R⁴ is halogen, C₁-C₃alkyl, C₁-C₆alkoxy or hydroxy.

5

Most preferred subgroups of compounds of formula I according to the invention are those wherein

R¹ is C₁-C₃alkyl;

R² is an optionally substituted substituted furyl, thienyl, pyridyl, pyridazinyl or pyrimidinyl;

10 R³ is an optionally substituted phenyl; and

R⁴ is fluoro, chloro, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃alkoxy or hydroxy.

Especially preferred subgroups of compounds of formula I according to the invention are those wherein

15 R¹ is methyl or ethyl;

R² is an optionally substituted substituted furyl, thienyl, pyridyl or pyrimidinyl;

R³ is 2,4,6-trifluorophenyl, 2-chloro-6-fluorophenyl or 2,6-dichloro-4-methoxyphenyl; and

R⁴ is fluoro, chloro, methyl, methoxy or hydroxy.

20

Preferred individual compounds are:

3-chloro-5-furan-2-yl-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-(5-bromofuran-2-yl)-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-5-(5-chlorothiophen-2-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

25 3-chloro-6-methyl-5-pyridin-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-5-(6-chloropyridin-2-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-pyridin-3-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-5-(6-chloropyridin-3-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-pyridin-4-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

30 3-chloro-5-(2,6-dichloropyridin-4-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-pyrimidin-4-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-(2-methylpyrimidin-4-yl)-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

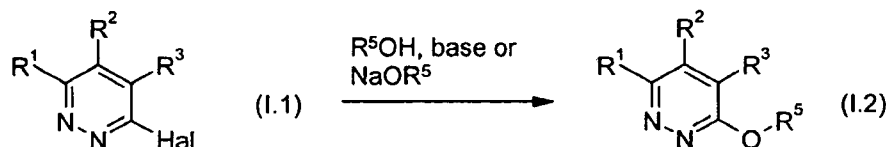
- 6 -

3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-pyridazine,
 3-fluoro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine, and
 3,6-dimethyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine.

Certain pyridazine derivatives with two phenyl groups in positions 4 and 5 have been proposed for controlling plant-destructive fungi, for example in WO 2005/121104 and WO 2006/001175. However, the action of those preparations is not satisfactory in all aspects of agricultural needs. Surprisingly, with the compounds of formula I, new kinds of fungicides having a high level of biological activity have now been found.

Compounds of formula (I.1), (I.2), (I.3), (I.4) and (I.5), in which R^1 , R^2 , R^3 , R^5 and R^6 have the meanings given above, are all examples of compounds of general formula (I) and can be made as shown in the following schemes.

The compounds of formula I.2, wherein R^1 , R^2 , R^3 and R^5 are as defined for compound of formula I and R^5 is C_1 - C_6 alkyl or C_1 - C_6 haloalkyl, can be obtained by reaction of a compound of formula I.1, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, preferably fluorine, chlorine or bromine, with an alcohol R^5OH , wherein R^5 is C_1 - C_6 alkyl or C_1 - C_6 haloalkyl, and a base or with a sodium alkoxide $NaOR^5$, wherein R^5 is C_1 - C_6 alkyl or C_1 - C_6 haloalkyl.



The compounds of formula I.3, wherein R^1 , R^2 , R^3 and R^6 are as defined for compound of formula I and R^6 is C_1 - C_6 alkyl, can be obtained by transformation of a compound of formula I.1, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, preferably chlorine or bromine, with a Grignard reagent R^6MgHal , wherein R^6 is C_1 - C_6 alkyl and Hal is halogen, preferably chlorine or bromine, in the presence of a transition metal catalyst.

- 7 -



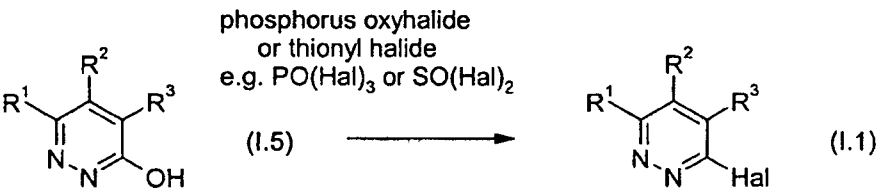
5 The compounds of formula I.4, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, can be obtained by transformation of a compound of formula I.1, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, preferably chlorine or bromine, with a inorganic fluoride, e.g. potassium fluoride.



10

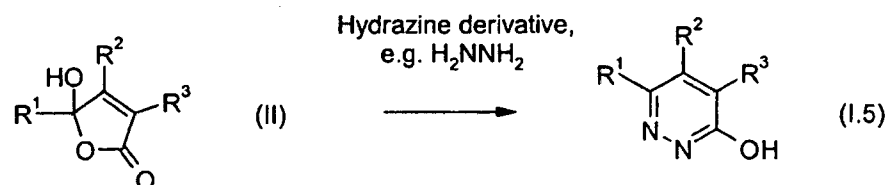
The compounds of formula I.1, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, preferably chlorine or bromine, can be obtained by reaction of a compound of formula I.5, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with a phosphorus oxyhalide, e.g. phosphorus oxychloride or phosphorus oxybromide, or thionyl halide, e.g. thionyl chloride or thionyl bromide.

15

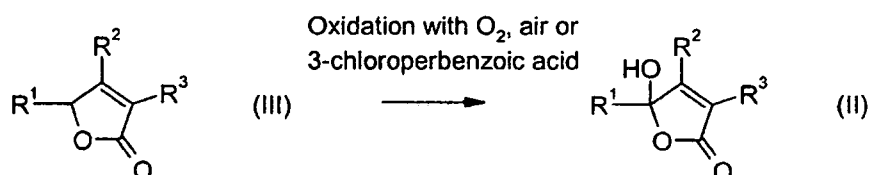


20 The compounds of formula I.5, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, can be obtained by reaction of a compound of formula II, wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with a hydrazine derivative, e.g. hydrazine hydrate.

- 8 -



The compounds of formula II, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I, can be obtained by oxidation of a compound of formula III, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I, with oxygen, air or 3-chloroperbenzoic acid.

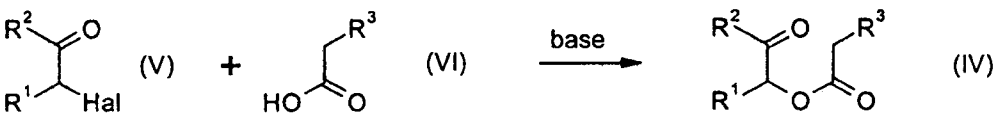


The compounds of formula III, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I, can be obtained by reaction of a compound of formula IV, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I, with a base, e.g. pyridine, triethylamine, diisopropylethylamine, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-ene or 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene.



The compounds of formula IV, wherein R^1 , R^2 and R^3 are as defined for compound of formula I, can be obtained by reaction of a compound of formula V, wherein R^1 and R^2 are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, preferably chlorine or bromine, with a compound of formula VI, wherein R^3 is as defined for compound of formula I, and a base, e.g. pyridine, triethylamine, diisopropylethylamine, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-ene or 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene.

- 9 -



Surprisingly, it has now been found that the novel compounds of formula I have, for practical purposes, a very advantageous spectrum of activities for protecting plants against diseases that are caused by fungi as well as by bacteria and viruses.

The compounds of formula I can be used in the agricultural sector and related fields of use as active ingredients for controlling plant pests or on non-living materials for control of spoilage microorganisms or organisms potentially harmful to man. The novel compounds are distinguished by excellent activity at low rates of application, by being well tolerated by plants and by being environmentally safe. They have very useful curative, preventive and systemic properties and are used for protecting numerous cultivated plants. The compounds of formula I can be used to inhibit or destroy the pests that occur on plants or parts of plants (fruit, blossoms, leaves, stems, tubers, roots) of different crops of useful plants, while at the same time protecting also those parts of the plants that grow later e.g. from phytopathogenic microorganisms.

It is also possible to use compounds of formula I as dressing agents for the treatment of plant propagation material, e.g., seed, such as fruits, tubers or grains, or plant cuttings (for example rice), for the protection against fungal infections as well as against phytopathogenic fungi occurring in the soil. The propagation material can be treated with a composition comprising a compound of formula I before planting: seed, for example, can be dressed before being sown. The active ingredients according to the invention can also be applied to grains (coating), either by impregnating the seeds in a liquid formulation or by coating them with a solid formulation. The composition can also be applied to the planting site when the propagation material is being planted, for example, to the seed furrow during sowing. The invention relates also to such methods of treating plant propagation material and to the plant propagation material so treated.

- 10 -

Furthermore the compounds according to present invention can be used for controlling fungi in related areas, for example in the protection of technical materials, including wood and wood related technical products, in food storage, in hygiene management.

- 5 In addition, the invention could be used to protect non-living materials from fungal attack, e.g. lumber, wall boards and paint.

- The compounds of formula I are, for example, effective against the phytopathogenic fungi of the following classes: Fungi imperfecti (e.g. *Botrytis* spp., *Alternaria* spp.) and
- 10 Basidiomycetes (e.g. *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.). Additionally, they are also effective against Ascomycetes (e.g. *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Podosphaera leucotricha*, *Monilinia* spp., *Fusarium* spp., *Uncinula* spp., *Mycosphaerella* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium secalis*, *Magnaporthe* spp., *Colletotrichum* spp., *Gaeumannomyces graminis*, *Tapesia* spp.,
- 15 *Ramularia* spp., *Microdochium nivale*, *Sclerotinia* spp.) and Oomycetes (e.g. *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Pseudoperonospora cubensis*). Outstanding activity has been observed against powdery mildews (e.g. *Uncinula necator*), rusts (e.g. *Puccinia* spp.) and leaf spots (e.g. *Septoria tritici*). Furthermore, the novel compounds of formula I are effective against phytopathogenic bacteria and viruses (e.g. against *Xanthomonas* spp.,
- 20 *Pseudomonas* spp., *Erwinia amylovora* as well as against the tobacco mosaic virus).

- Within the scope of present invention, target crops to be protected typically comprise the following species of plants: cereal (wheat, barley, rye, oat, rice, maize, sorghum and related species); beet (sugar beet and fodder beet); pomes, drupes and soft fruit (apples,
- 25 pears, plums, peaches, almonds, cherries, strawberries, raspberries and blackberries); leguminous plants (beans, lentils, peas, soybeans); oil plants (rape, mustard, poppy, olives, sunflowers, coconut, castor oil plants, cocoa beans, groundnuts); cucumber plants (pumpkins, cucumbers, melons); fibre plants (cotton, flax, hemp, jute); citrus fruit (oranges, lemons, grapefruit, mandarins); vegetables (spinach, lettuce, asparagus, cabbages, carrots,
- 30 onions, tomatoes, potatoes, paprika); lauraceae (avocado, cinnamomum, camphor) or plants such as tobacco, nuts, coffee, eggplants, sugar cane, tea, pepper, vines, hops, bananas and natural rubber plants, as well as turf and ornamentals.

The target crops in accordance with the invention include conventional as well as genetically enhanced or engineered varieties such as, for example, insect resistant (e.g. Bt. and VIP varieties) as well as disease resistant, herbicide tolerant (e.g. glyphosate- and glufosinate-resistant maize varieties commercially available under the trade names RoundupReady® and LibertyLink®) and nematode tolerant varieties. By way of example, suitable genetically enhanced or engineered crop varieties include the Stoneville 5599BR cotton and Stoneville 4892BR cotton varieties.

10 The compounds of formula I are used in unmodified form or, preferably, together with the adjuvants conventionally employed in the art of formulation. To this end they are conveniently formulated in known manner to emulsifiable concentrates, coatable pastes, directly sprayable or dilutable solutions or suspensions, dilute emulsions, wettable powders, soluble powders, dusts, granulates, and also encapsulations e.g. in polymeric substances. As with
15 the type of the compositions, the methods of application, such as spraying, atomising, dusting, scattering, coating or pouring, are chosen in accordance with the intended objectives and the prevailing circumstances. The compositions may also contain further adjuvants such as stabilizers, antifoams, viscosity regulators, binders or tackifiers as well as fertilizers, micronutrient donors or other formulations for obtaining special effects.

20 Suitable carriers and adjuvants can be solid or liquid and are substances useful in formulation technology, e.g. natural or regenerated mineral substances, solvents, dispersants, wetting agents, tackifiers, thickeners, binders or fertilizers. Such carriers are for example described in WO 97/33890.

25 The compounds of formula I are normally used in the form of compositions and can be applied to the crop area or plant to be treated, simultaneously or in succession with further compounds. These further compounds can be e.g. fertilizers or micronutrient donors or other preparations, which influence the growth of plants. They can also be selective herbicides as
30 well as insecticides, fungicides, bactericides, nematocides, molluscicides or mixtures of several of these preparations, if desired together with further carriers, surfactants or application promoting adjuvants customarily employed in the art of formulation.

- 12 -

The compounds of formula I are normally used in the form of fungicidal compositions for controlling or protecting against phytopathogenic microorganisms, comprising as active ingredient at least one compound of formula I, in free form or in agrochemically usable salt form, and at least one of the above-mentioned adjuvants.

The compounds of formula I can be mixed with other fungicides, resulting in some cases in unexpected synergistic activities. Mixing components which are particularly preferred are:

- 10 Azoles, such as azaconazole, BAY 14120, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, pefurazoate, penconazole, prothioconazole, pyrifenoxy, prochloraz, propiconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizole,
- 15 triticonazole;
- Pyrimidinyl carbinols, such as ancymidol, fenarimol, nuarimol;
- 2-amino-pyrimidines, such as bupirimate, dimethirimol, ethirimol;
- Morpholines, such as dodemorph, fenpropidine, fenpropimorph, spiroxamine, tridemorph;
- 20 Anilinopyrimidines, such as cyprodinil, mepanipyrim, pyrimethanil;
- Pyrroles, such as fenpiclonil, fludioxonil;
- Phenylamides, such as benalaxyl, furalaxyl, metalaxyl, R-metalaxyl, ofurace, oxadixyl;
- Benzimidazoles, such as benomyl, carbendazim, debacarb, fuberidazole, thiabendazole;
- 25 Dicarboximides, such as chlozolinate, dichlozoline, iprodione, myclozoline, procymidone, vinclozoline;
- Carboxamides, such as boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad, thifluzamide; guanidines, such as guazatine, dodine, iminoctadine;
- Strobilurines, such as azoxystrobin, dimoxystrobin, enestroburin, fluoxastrobin,
- 30 kresoxim-methyl, metominostrobin, trifloxystrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin;

- 13 -

Dithiocarbamates, such as ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, thiram, zineb, ziram;

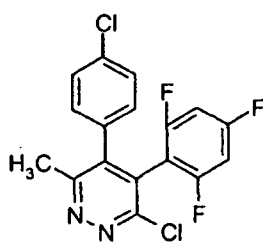
N-halomethylthiotetrahydrophthalimides, such as captafol, captan, dichlofluanid, fluoromides, folpet, tolyfluanid;

5 Copper-compounds, such as Bordeaux mixture, copper hydroxide, copper oxychloride, copper sulfate, cuprous oxide, mancopper, oxine-copper;

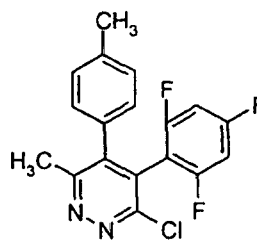
Nitrophenol-derivatives, such as dinocap, nitrothal-isopropyl;

Organo-phosphor-derivatives, such as edifenphos, iprobenphos, isoprothiolane, phosdiphen, pyrazophos, tolclofos-methyl;

10 Pyridazine-derivatives which are known and may be prepared by methods as described in WO 05/121104 and WO 06/001175, such as 3-chloro-5-(4-chloro-phenyl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (formula P.1) and 3-chloro-6-methyl-5-p-tolyl-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (formula P.2);

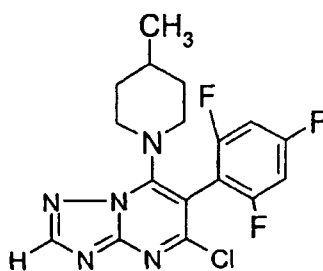


P.1



P.2

15 Triazolopyrimidine derivatives which are known and may be prepared by methods as described in WO98/46607, such as 5-chloro-7-(4-methyl-piperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluoro-phenyl)- [1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine (formula T.1);

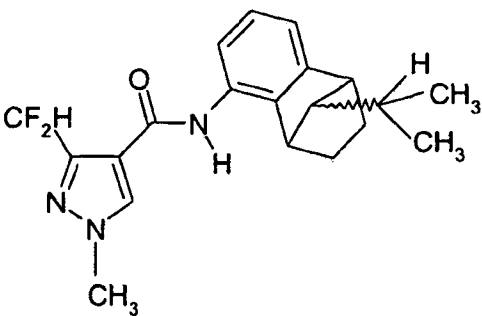


T.1

20 Carboxamide derivatives which are known and may be prepared by methods as described in WO04/035589 and in WO06/37632, such as 3-difluoromethyl-1-methyl-1H-

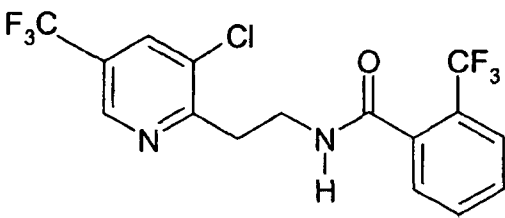
- 14 -

pyrazole-4-carboxylic acid (9-isopropyl-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methano-naphthalen-5-yl)-amide (formula U.1);



U.1

Benzamide derivatives which are known and may be prepared by methods as described in WO 2004/016088, such as N-{-2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]ethyl}-2-trifluoromethylbenzamide, which is also known under the name fluopyram (formula V.1);



V.1

and

Various others, such as acibenzolar-S-methyl, anilazine, benthiavalicarb, blasticidin-S, chinomethionate, chloroneb, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dichlone, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, dimethomorph, flumorph, dithianon, ethaboxam, etridiazole, famoxadone, fenamidone, fenoxanil, fentin, ferimzone, fluazinam, fluopicolide, flusulfamide, fenhexamid, fosetyl-aluminium, hymexazol, iprovalicarb, cyazofamid, kasugamycin, mandipropamid, methasulfocarb, metrafenone, nicobifen, pencycuron, phthalide, polyoxins, probenazole, propamocarb, proquinazid, pyroquilon, quinoxifen, quintozone, sulfur, tiadinil, triazoxide, tricyclazole, triforine, validamycin, zoxamide and glyphosate.

- 15 -

Another aspect of the invention is related to the use of a compound of formula I, of a composition comprising at least one compound of formula I or of a fungicidal mixture comprising at least one compound of formula I in admixture with other fungicides, as described above, for controlling or preventing infestation of plants, harvested food crops or
5 non-living materials by phytopathogenic microorganisms, preferably fungal organisms.

A further aspect of the invention is related to a method of controlling or preventing an infestation of crop plants or of non-living materials by phytopathogenic or spoilage microorganisms or organisms potentially harmful to man, especially fungal organisms, which
10 comprises the application of a compound of formula I as active ingredient to the plants, to parts of the plants or to the locus thereof, or to any part of the non-living materials. Controlling or preventing means reducing the infestation of crop plants or of non-living materials by phytopathogenic or spoilage microorganisms or organisms potentially harmful to man, especially fungal organisms, to such a level that an improvement is demonstrated.

15

A preferred method of controlling or preventing an infestation of crop plants by phytopathogenic microorganisms, especially fungal organisms, which comprises the application of a compound of formula I, or an agrochemical composition which contains at least one of said compounds, is foliar application. The frequency of application and the rate
20 of application will depend on the risk of infestation by the corresponding pathogen. However, the compounds of formula I can also penetrate the plant through the roots via the soil (systemic action) by drenching the locus of the plant with a liquid formulation, or by applying the compounds in solid form to the soil, e.g. in granular form (soil application). In crops of water rice such granulates can be applied to the flooded rice field. The compounds of
25 formula I may also be applied to seeds (coating) by impregnating the seeds or tubers either with a liquid formulation of the fungicide or coating them with a solid formulation.

A formulation [that is, a composition containing the compound of formula I] and, if desired, a solid or liquid adjuvant or monomers for encapsulating the compound of formula I,
30 is prepared in a known manner, typically by intimately mixing and/or grinding the compound with extenders, for example solvents, solid carriers and, optionally, surface active compounds (surfactants).

- 16 -

The agrochemical formulations will usually contain from 0.1 to 99% by weight, preferably from 0.1 to 95% by weight, of the compound of formula I, 99.9 to 1% by weight, preferably 99.8 to 5% by weight, of a solid or liquid adjuvant, and from 0 to 25% by weight, preferably from 0.1 to 25% by weight, of a surfactant.

Advantageous rates of application are normally from 5g to 2kg of active ingredient (a.i.) per hectare (ha), preferably from 10g to 1kg a.i./ha, most preferably from 20g to 600g a.i./ha. When used as seed drenching agent, convenient dosages are from 10mg to 1g of active substance per kg of seeds.

Whereas it is preferred to formulate commercial products as concentrates, the end user will normally use dilute formulations.

The following non-limiting examples illustrate the above-described invention in more detail.

Example 1: This example illustrates the preparation of 3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.198)

a) Preparation of 2-bromo-1-thiophen-2-yl-propan-1-one

Bromine (3.7 ml) is added to the mixture of 1-(2-thienyl)-1-propane (10 g), 0.1 ml of hydrobromic acid (48 % solution) and 80 ml of acetic acid at 0 °C under a nitrogen atmosphere. Subsequently, the mixture is stirred for 2.5 h at room temperature. The reaction mixture is evaporated under reduced pressure. 2-Bromo-1-thiophen-2-yl-propan-1-one is obtained as a brown oil, which is used in the next step without further purification.

b) Preparation of 5-hydroxy-5-methyl-4-thiophen-2-yl-3-(2,4,6-trifluorophenyl)-5H-furan-2-one (Compound No. II.h.040)

A mixture of 2-bromo-1-thiophen-2-yl-propan-1-one (2.1 g), 2,4,6-trifluorophenylacetic acid (2.0 g), 1.5 ml of triethylamine and 30 ml of acetonitrile is stirred for 16 h at room temperature. Subsequently 30 ml of acetonitrile and 3.4 ml of 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-

- 17 -

7-ene (DBU) are added under cooling and stirring is continued for further 2.5 h. Then air is blown through the reaction mixture for 3 h. An aqueous ammonium chloride solution is added and the mixture is extracted with ethyl acetate. The combined organic layer is washed with a saturated aqueous sodium bicarbonate solution and with brine, dried over sodium sulfate and evaporated under reduced pressure. The remainder is purified by chromatography on silica gel, using a mixture of heptane / ethyl acetate 2 : 1 as eluent to obtain 5-hydroxy-5-methyl-4-thiophen-2-yl-3-(2,4,6-trifluorophenyl)-5H-furan-2-one (Compound No. II.h.040) as colourless crystals, m.p. 134 – 136 °C.

c) Preparation of 6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-2H-pyridazin-3-one (Compound No. I.h.196)

A mixture of 5-hydroxy-5-methyl-4-thiophen-2-yl-3-(2,4,6-trifluorophenyl)-5H-furan-2-one (1.9 g), 0.3 ml of hydrazine hydrate and 30 ml of 1-butanol is heated for 16 h to 120 °C.

Subsequently, the mixture is cooled to 0 °C. The hereby obtained solid is filtered and washed with hexane to obtain 6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-2H-pyridazin-3-one (Compound No. I.h.196) as colourless crystals, m.p. 249-251 °C.

d) A mixture of 6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-2H-pyridazin-3-one (Compound No. I.h.196, 1.2 g) and 6.5 ml of phosphorus oxychloride are mixed and heated at 110 °C for 1 h. After cooling the reaction mixture is evaporated under reduced pressure. The remainder is taken up with ethyl acetate and water and the phases are separated. The organic layer is washed with water and brine, dried over sodium sulfate and evaporated under reduced pressure. The residue is recrystallised from hexane to deliver 3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.198) as beige crystals, m.p. 90-92 °C.

Example 2: This example illustrates the preparation of 3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.199) and 4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-pyridazine (Compound No.I.h.254)

A mixture of 3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-y-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.198, 0.7 g), sodium methoxide (30% solution in methanol, 0.4 g) and 10

ml of methanol is heated for 16 h to 60 °C. Subsequently the reaction mixture is cooled, diluted with water and extracted with ethyl acetate. The combined organic layer is washed with water and brine, dried over sodium sulfate and evaporated under reduced pressure. The remainder is purified by chromatography on silica gel, using a mixture of heptane / ethyl acetate 9 : 1 as eluent to obtain 3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound I.h.199), m.p. 124-125 °C and 4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-pyridazine (Compound I.h.254), m.p. 130-133 °C.

10 Example 3: This example illustrates the preparation of 3-fluoro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.197)

A mixture of 3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (Compound No. I.h.198, 0.25 g), potassium fluoride (0.1 g) and 5 ml of dimethyl sulfoxide are mixed and heated to 140 °C for 48 h. Subsequently the reaction mixture is cooled, diluted with water and extracted with ethyl acetate. The combined organic layer is washed with water and brine, dried over sodium sulfate and evaporated under reduced pressure. The remainder is purified by chromatography on silica gel, using a mixture of hexane / ethyl acetate 9 : 1 as eluent to obtain 3-fluoro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluoro-phenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.197) as beige crystals (from diethyl ether/hexane), m.p. 71-74°C.

25 Example 4: This example illustrates the preparation of 3,6-dimethyl-4-thiophen-2-yl-5-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.200)

1.2 ml of a 3 M solution of methylmagnesium bromide in diethyl ether is mixed with 5 ml of tetrahydrofuran and added slowly at – 70 °C to a solution of 3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.198, 0.26 g) and iron(III) acetylacetonate (0.03 g) in 20 ml of tetrahydrofuran and 1.5 ml of 1-methyl-2-pyrrolidinone (NMP). After 0.5 h at – 70 °C the mixture is stirred for another 2.5 h at room temperature. The reaction is quenched with dilute HCl and the aqueous phase is extracted with tert-butyl methyl ether. The combined organic layer is dried over sodium sulfate and evaporated under

reduced pressure. The residue is purified by chromatography on silica gel, using a mixture of hexane / ethyl acetate 3:1 as eluent to give 3,6 dimethyl-4-thiophen-2-yl-5-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine (Compound No.I.h.200) as beige crystals, m.p. 100-102 °C.

5 Tables 1 and 2 below illustrate examples of individual compounds of formula I and formula II according to the invention.

Table 1: individual compounds of formula I according to the invention

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
001	CH ₃	2-fluorophenyl	OH
002	CH ₃	2-fluorophenyl	F
003	CH ₃	2-fluorophenyl	Cl
004	CH ₃	2-fluorophenyl	OCH ₃
005	CH ₃	2-fluorophenyl	CH ₃
006	CH ₃	2-chlorophenyl	OH
007	CH ₃	2-chlorophenyl	F
008	CH ₃	2-chlorophenyl	Cl
009	CH ₃	2-chlorophenyl	OCH ₃
010	CH ₃	2-chlorophenyl	CH ₃
011	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	OH
012	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	F
013	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	Cl
014	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
015	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	CH ₃
016	CH ₃	2-methylphenyl	OH
017	CH ₃	2-methylphenyl	F
018	CH ₃	2-methylphenyl	Cl
019	CH ₃	2-methylphenyl	OCH ₃
020	CH ₃	2-methylphenyl	CH ₃

- 20 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
021	CH ₃	2,3-difluorophenyl	OH
022	CH ₃	2,3-difluorophenyl	F
023	CH ₃	2,3-difluorophenyl	Cl
024	CH ₃	2,3-difluorophenyl	OCH ₃
025	CH ₃	2,3-difluorophenyl	CH ₃
026	CH ₃	2,4-difluorophenyl	OH
027	CH ₃	2,4-difluorophenyl	F
028	CH ₃	2,4-difluorophenyl	Cl
029	CH ₃	2,4-difluorophenyl	OCH ₃
030	CH ₃	2,4-difluorophenyl	CH ₃
031	CH ₃	2,5-difluorophenyl	OH
032	CH ₃	2,5-difluorophenyl	F
033	CH ₃	2,5-difluorophenyl	Cl
034	CH ₃	2,5-difluorophenyl	OCH ₃
035	CH ₃	2,5-difluorophenyl	CH ₃
036	CH ₃	2,6-difluorophenyl	OH
037	CH ₃	2,6-difluorophenyl	F
038	CH ₃	2,6-difluorophenyl	Cl
039	CH ₃	2,6-difluorophenyl	OCH ₃
040	CH ₃	2,6-difluorophenyl	CH ₃
041	CH ₃	2,3-dichlorophenyl	OH
042	CH ₃	2,3-dichlorophenyl	F
043	CH ₃	2,3-dichlorophenyl	Cl
044	CH ₃	2,3-dichlorophenyl	OCH ₃
045	CH ₃	2,3-dichlorophenyl	CH ₃
046	CH ₃	2,4-dichlorophenyl	OH
047	CH ₃	2,4-dichlorophenyl	F
048	CH ₃	2,4-dichlorophenyl	Cl
049	CH ₃	2,4-dichlorophenyl	OCH ₃

- 21 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
050	CH ₃	2,4-dichlorophenyl	CH ₃
051	CH ₃	2,5-dichlorophenyl	OH
052	CH ₃	2,5-dichlorophenyl	F
053	CH ₃	2,5-dichlorophenyl	Cl
054	CH ₃	2,5-dichlorophenyl	OCH ₃
055	CH ₃	2,5-dichlorophenyl	CH ₃
056	CH ₃	2,6-dichlorophenyl	OH
057	CH ₃	2,6-dichlorophenyl	F
058	CH ₃	2,6-dichlorophenyl	Cl
059	CH ₃	2,6-dichlorophenyl	OCH ₃
060	CH ₃	2,6-dichlorophenyl	CH ₃
061	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	OH
062	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	F
063	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	Cl
064	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	OCH ₃
065	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	CH ₃
066	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	OH
067	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	F
068	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	Cl
069	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	OCH ₃
070	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	CH ₃
071	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	OH
072	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	F
073	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	Cl
074	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	OCH ₃
075	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	CH ₃
076	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	OH
077	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	F
078	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	Cl

- 22 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
079	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	OCH ₃
080	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	CH ₃
081	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	OH
082	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	F
083	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	Cl
084	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	OCH ₃
085	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	CH ₃
086	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	OH
087	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	F
088	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	Cl
089	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	OCH ₃
090	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	CH ₃
091	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	OH
092	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	F
093	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	Cl
094	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	OCH ₃
095	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	CH ₃
096	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	OH
097	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	F
098	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	Cl
099	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
100	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	CH ₃
101	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	OH
102	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	F
103	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
104	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
105	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	CH ₃
106	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	OH
107	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	F

- 23 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
108	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	Cl
109	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
110	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	CH ₃
111	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	OH
112	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	F
113	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	Cl
114	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
115	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	CH ₃
116	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	OH
117	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	F
118	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	Cl
119	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
120	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	CH ₃
121	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	OH
122	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	F
123	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
124	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
125	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	CH ₃
126	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	OH
127	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	F
128	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	Cl
129	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
130	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	CH ₃
131	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	OH
132	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	F
133	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	Cl
134	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
135	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	CH ₃
136	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	OH

- 24 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
137	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	F
138	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	Cl
139	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
140	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	CH ₃
141	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	OH
142	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	F
143	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	Cl
144	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
145	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	CH ₃
146	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	OH
147	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	F
148	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	Cl
149	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	OCH ₃
150	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	CH ₃
151	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	OH
152	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	F
153	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	Cl
154	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	OCH ₃
155	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	CH ₃
156	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	OH
157	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	F
158	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	Cl
159	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	OCH ₃
160	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	CH ₃
161	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	OH
162	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	F
163	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	Cl
164	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	OCH ₃
165	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	CH ₃

- 25 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
166	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	OH
167	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	F
168	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	Cl
169	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	OCH ₃
170	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	CH ₃
171	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	OH
172	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	F
173	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	Cl
174	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	OCH ₃
175	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	CH ₃
176	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	OH
177	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	F
178	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	Cl
179	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	OCH ₃
180	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	CH ₃
181	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	OH
182	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	F
183	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	Cl
184	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	OCH ₃
185	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	CH ₃
186	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	OH
187	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	F
188	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	Cl
189	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	OCH ₃
190	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	CH ₃
191	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	OH
192	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	F
193	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	Cl
194	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	OCH ₃

- 26 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
195	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	CH ₃
196	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	OH
197	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	F
198	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	Cl
199	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	OCH ₃
200	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	CH ₃
201	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	OH
202	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	F
203	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	Cl
204	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	OCH ₃
205	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	CH ₃
206	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	OH
207	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	F
208	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	Cl
209	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	OCH ₃
210	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	CH ₃
211	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	OH
212	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	F
213	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	Cl
214	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	OCH ₃
215	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	CH ₃
216	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	OH
217	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	F
218	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	Cl
219	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	OCH ₃
220	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	CH ₃
221	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	OH
222	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	F
223	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	Cl

- 27 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
224	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	OCH ₃
225	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	CH ₃
226	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	OH
227	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	F
228	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	Cl
229	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	OCH ₃
230	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	CH ₃
231	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	OH
232	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	F
233	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	Cl
234	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	OCH ₃
235	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
236	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	OH
237	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	F
238	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
239	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
240	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	CH ₃
241	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	OH
242	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	F
243	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	Cl
244	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	OCH ₃
245	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	CH ₃
246	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	OH
247	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	F
248	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	Cl
249	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	OCH ₃
250	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	CH ₃
251	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	OH
252	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	F

- 28 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
253	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	Cl
254	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	OCH ₃
255	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	CH ₃
256	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	OH
257	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	F
258	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	Cl
259	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	OCH ₃
260	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	CH ₃
261	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	OH
262	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	F
263	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
264	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	OCH ₃
265	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	CH ₃
266	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	OH
267	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	F
268	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	Cl
269	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	OCH ₃
270	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	CH ₃
271	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	OH
272	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	F
273	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	Cl
274	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	OCH ₃
275	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	CH ₃
276	CH ₃	pentafluorophenyl	OH
277	CH ₃	pentafluorophenyl	F
278	CH ₃	pentafluorophenyl	Cl
279	CH ₃	pentafluorophenyl	OCH ₃
280	CH ₃	pentafluorophenyl	CH ₃
281	CH ₂ CH ₃	2-fluorophenyl	OH

- 29 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
282	CH ₂ CH ₃	2-fluorophenyl	Cl
283	CH ₂ CH ₃	2-chlorophenyl	OH
284	CH ₂ CH ₃	2-chlorophenyl	Cl
285	CH ₂ CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	OH
286	CH ₂ CH ₃	2-trifluoromethylphenyl	Cl
287	CH ₂ CH ₃	2-methylphenyl	OH
288	CH ₂ CH ₃	2-methylphenyl	Cl
289	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorophenyl	OH
290	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorophenyl	Cl
291	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorophenyl	OH
292	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorophenyl	Cl
293	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorophenyl	OH
294	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorophenyl	Cl
295	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorophenyl	OH
296	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorophenyl	Cl
297	CH ₂ CH ₃	2,3-dichlorophenyl	OH
298	CH ₂ CH ₃	2,3-dichlorophenyl	Cl
299	CH ₂ CH ₃	2,4-dichlorophenyl	OH
300	CH ₂ CH ₃	2,4-dichlorophenyl	Cl
301	CH ₂ CH ₃	2,5-dichlorophenyl	OH
302	CH ₂ CH ₃	2,5-dichlorophenyl	Cl
303	CH ₂ CH ₃	2,6-dichlorophenyl	OH
304	CH ₂ CH ₃	2,6-dichlorophenyl	Cl
305	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	OH
306	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl	Cl
307	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	OH
308	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl	Cl
309	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	OH
310	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl	Cl

- 30 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
311	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	OH
312	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl	Cl
313	CH ₂ CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	OH
314	CH ₂ CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl	Cl
315	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	OH
316	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl	Cl
317	CH ₂ CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	OH
318	CH ₂ CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl	Cl
319	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	OH
320	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	Cl
321	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	OH
322	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
323	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	OH
324	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	Cl
325	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	OH
326	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	Cl
327	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	OH
328	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl	Cl
329	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	OH
330	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
331	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	OH
332	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl	Cl
333	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	OH
334	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl	Cl
335	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	OH
336	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl	Cl
337	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	OH
338	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl	Cl
339	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	OH

- 31 -

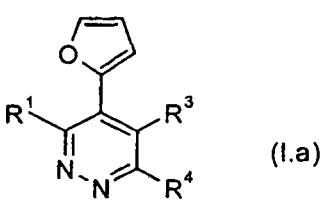
Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
340	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl	Cl
341	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	OH
342	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl	Cl
343	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	OH
344	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl	Cl
345	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	OH
346	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl	Cl
347	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	OH
348	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl	Cl
349	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	OH
350	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl	Cl
351	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	OH
352	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl	Cl
353	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	OH
354	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl	Cl
355	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	OH
356	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl	Cl
357	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	OH
358	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl	Cl
359	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	OH
360	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl	Cl
361	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	OH
362	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl	Cl
363	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	OH
364	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl	Cl
365	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	OH
366	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl	Cl
367	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	OH
368	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl	Cl

- 32 -

Compound No.	R ¹	R ³	R ⁴
369	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	OH
370	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl	Cl
371	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	OH
372	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl	Cl
373	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	OH
374	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl	Cl
375	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	OH
376	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
377	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	OH
378	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanophenyl	Cl
379	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	OH
380	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl	Cl
381	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	OH
382	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl	Cl
383	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	OH
384	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl	Cl
385	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	OH
386	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl	Cl
387	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	OH
388	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl	Cl
389	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	OH
390	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl	Cl
391	CH ₂ CH ₃	pentafluorophenyl	OH
392	CH ₂ CH ₃	pentafluorophenyl	Cl

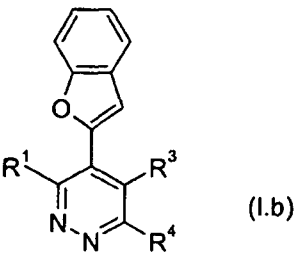
where

a) 392 compounds of formula (I.a):



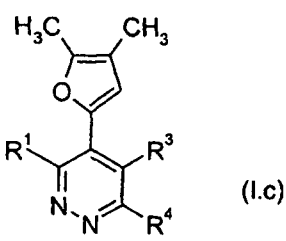
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 b) 392 compounds of formula (I.b):



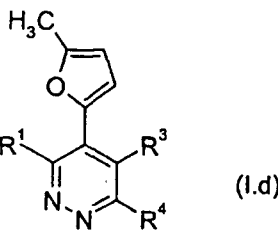
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

c) 392 compounds of formula (I.c):



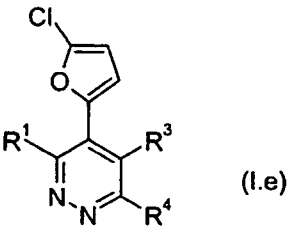
10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

d) 392 compounds of formula (I.d):



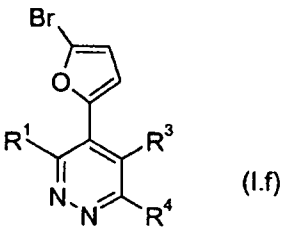
15 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

e) 392 compounds of formula (I.e):



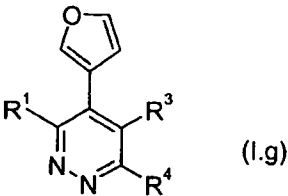
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 f) 392 compounds of formula (I.f):



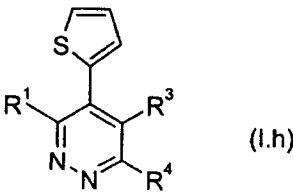
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

g) 392 compounds of formula (I.g):



10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

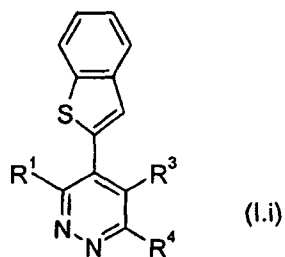
h) 392 compounds of formula (I.h):



15 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

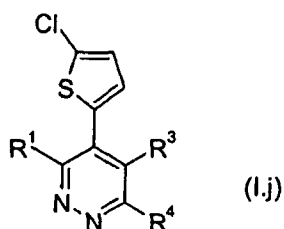
- 35 -

i) 392 compounds of formula (I.i):



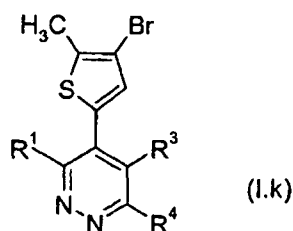
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 j) 392 compounds of formula (I.j):



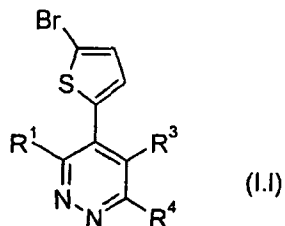
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

k) 392 compounds of formula (I.k):



10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

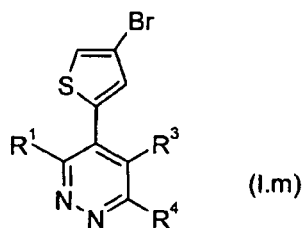
l) 392 compounds of formula (I.l):



15 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

- 36 -

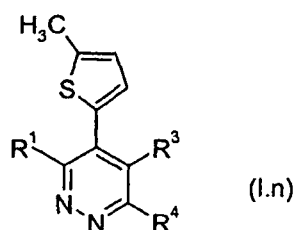
m) 392 compounds of formula (I.m):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

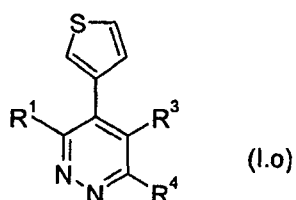
5

n) 392 compounds of formula (I.n):



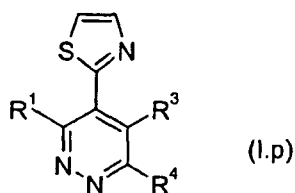
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

10 o) 392 compounds of formula (I.o):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

p) 392 compounds of formula (I.p):

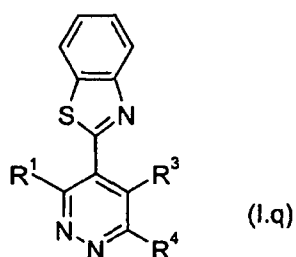


15

wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

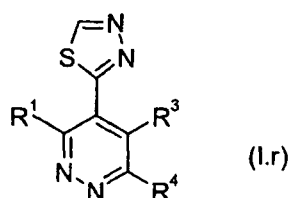
- 37 -

q) 392 compounds of formula (I.q):



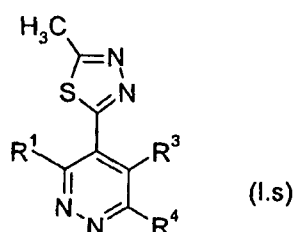
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 r) 392 compounds of formula (I.r):



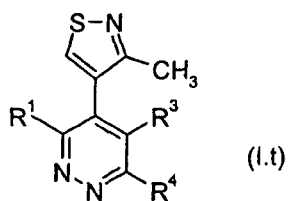
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

10 s) 392 compounds of formula (I.s):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

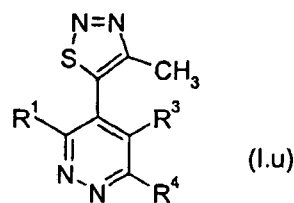
t) 392 compounds of formula (I.t):



15

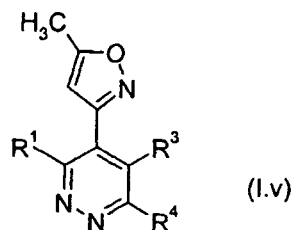
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

u) 392 compounds of formula (I.u):



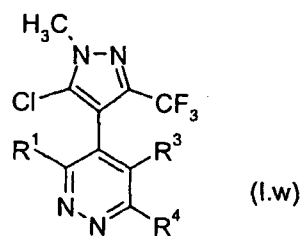
5 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

v) 392 compounds of formula (I.v):



10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

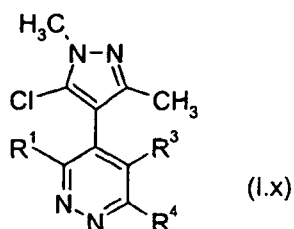
w) 392 compounds of formula (I.w):



15 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

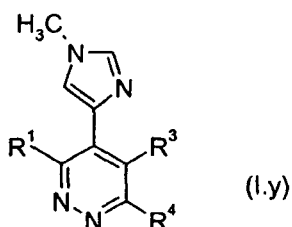
- 39 -

x) 392 compounds of formula (I.x):



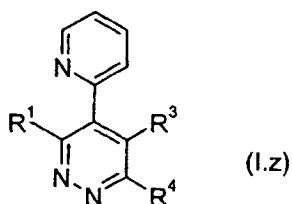
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 y) 392 compounds of formula (I.y):



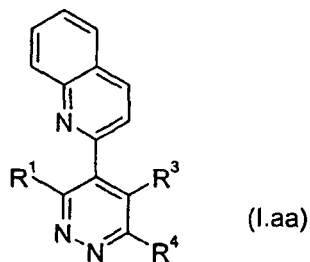
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

z) 392 compounds of formula (I.z):



10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

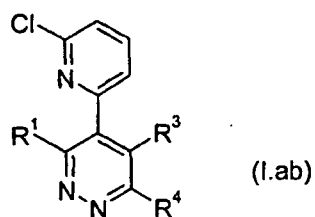
aa) 392 compounds of formula (I.aa):



15 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

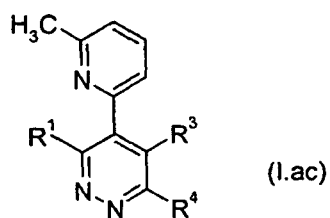
- 40 -

ab) 392 compounds of formula (I.ab):



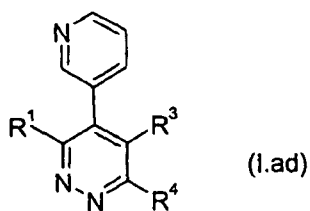
wherein R^1 , R^3 and R^4 are as defined in Table 1.

5 ac) 392 compounds of formula (I.ac):



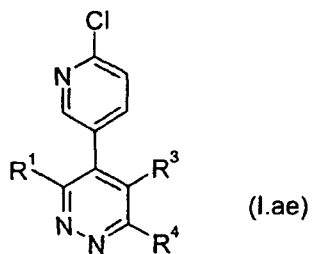
wherein R^1 , R^3 and R^4 are as defined in Table 1.

10 ad) 392 compounds of formula (I.ad):



wherein R^1 , R^3 and R^4 are as defined in Table 1.

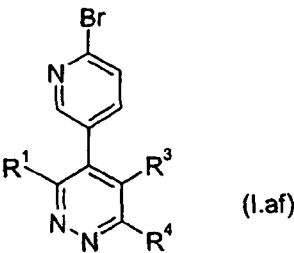
ae) 392 compounds of formula (I.ae):



15

wherein R^1 , R^3 and R^4 are as defined in Table 1.

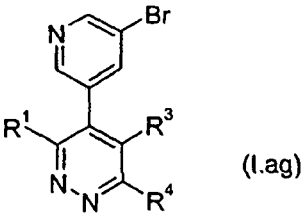
af) 392 compounds of formula (I.af):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

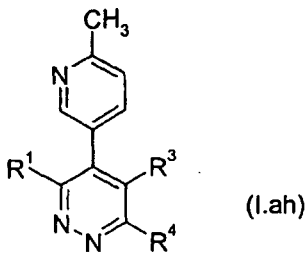
5

ag) 392 compounds of formula (I.ag):



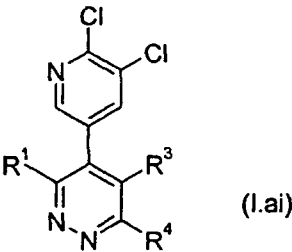
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

10 ah) 392 compounds of formula (I.ah):



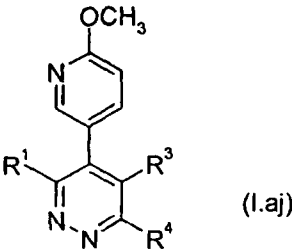
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

ai) 392 compounds of formula (I.ai):



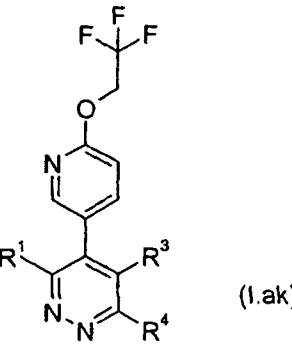
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 aj) 392 compounds of formula (I.aj):



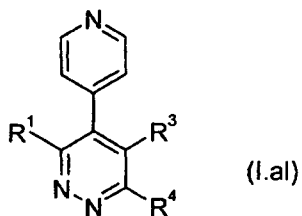
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

ak) 392 compounds of formula (I.ak):



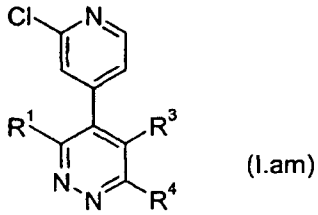
10 wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

al) 392 compounds of formula (I.al):



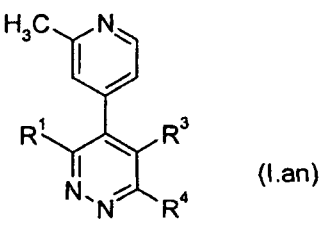
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 am) 392 compounds of formula (I.am):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

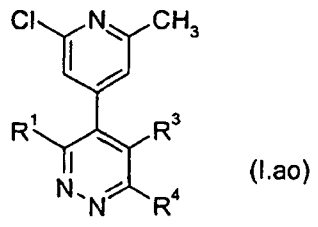
an) 392 compounds of formula (I.an):



10

wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

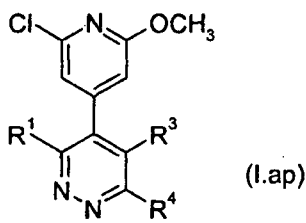
ao) 392 compounds of formula (I.ao):



15

wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

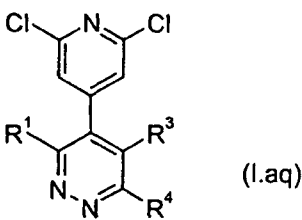
ap) 392 compounds of formula (I.ap):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5

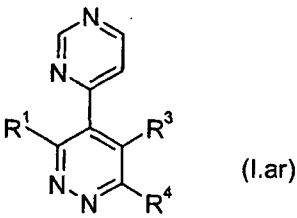
aq) 392 compounds of formula (I.aq):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

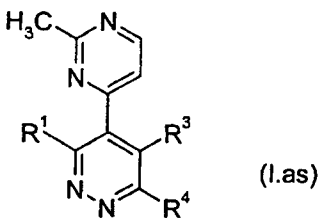
10

ar) 392 compounds of formula (I.ar):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

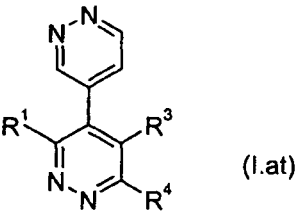
as) 392 compounds of formula (I.as):



15

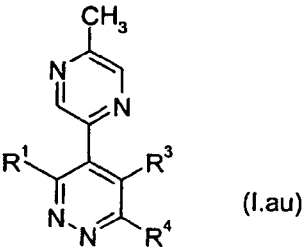
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

at) 392 compounds of formula (I.at):



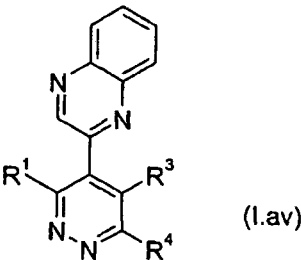
wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5 au) 392 compounds of formula (I.au):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

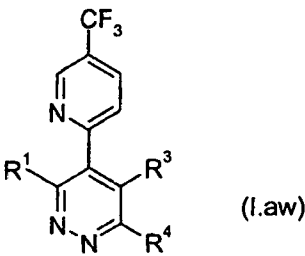
av) 392 compounds of formula (I.av):



10

wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

aw) 392 compounds of formula (I.aw):



wherein R¹, R³ and R⁴ are as defined in Table 1.

5

Table 2: individual compounds of formula II according to the invention

Compound No.	R ¹	R ³
001	CH ₃	2-fluorophenyl
002	CH ₃	2-chlorophenyl
003	CH ₃	2-trifluoromethylphenyl
004	CH ₃	2-methylphenyl
005	CH ₃	2,3-difluorophenyl
006	CH ₃	2,4-difluorophenyl
007	CH ₃	2,5-difluorophenyl
008	CH ₃	2,6-difluorophenyl
009	CH ₃	2,3-dichlorophenyl
010	CH ₃	2,4-dichlorophenyl
011	CH ₃	2,5-dichlorophenyl
012	CH ₃	2,6-dichlorophenyl
013	CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl
014	CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl
015	CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl
016	CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl
017	CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl
018	CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl
019	CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl

Compound No.	R ¹	R ³
020	CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl
021	CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl
022	CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl
023	CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl
024	CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl
025	CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl
026	CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl
027	CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl
028	CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl
029	CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl
030	CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl
031	CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl
032	CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl
033	CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl
034	CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl
035	CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl
036	CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl
037	CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl
038	CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl
039	CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl
040	CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl
041	CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl
042	CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl
043	CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl
044	CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl
045	CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl
046	CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl
047	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl
048	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl

Compound No.	R ¹	R ³
049	CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanoxyphenyl
050	CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl
051	CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl
052	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl
053	CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl
054	CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl
055	CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl
056	CH ₃	pentafluorophenyl
057	CH ₂ CH ₃	2-fluorophenyl
058	CH ₂ CH ₃	2-chlorophenyl
059	CH ₂ CH ₃	2-trifluoromethylphenyl
060	CH ₂ CH ₃	2-methylphenyl
061	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorophenyl
062	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorophenyl
063	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorophenyl
064	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorophenyl
065	CH ₂ CH ₃	2,3-dichlorophenyl
066	CH ₂ CH ₃	2,4-dichlorophenyl
067	CH ₂ CH ₃	2,5-dichlorophenyl
068	CH ₂ CH ₃	2,6-dichlorophenyl
069	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-fluorophenyl
070	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-fluorophenyl
071	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-fluorophenyl
072	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-fluorophenyl
073	CH ₂ CH ₃	3-chloro-2-fluorophenyl
074	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-fluorophenyl
075	CH ₂ CH ₃	5-chloro-2-fluorophenyl
076	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl
077	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl

- 49 -

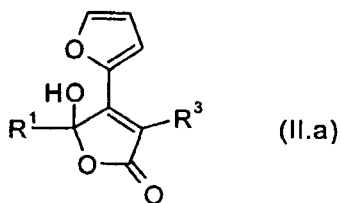
Compound No.	R ¹	R ³
078	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl
079	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl
080	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-trifluoromethylphenyl
081	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-trifluoromethylphenyl
082	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-trifluoromethylphenyl
083	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-trifluoromethylphenyl
084	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluoromethylphenyl
085	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-trifluoromethylphenyl
086	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-methylphenyl
087	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-methylphenyl
088	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-methylphenyl
089	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-methylphenyl
090	CH ₂ CH ₃	2-chloro-3-methylphenyl
091	CH ₂ CH ₃	2-chloro-4-methylphenyl
092	CH ₂ CH ₃	2-chloro-5-methylphenyl
093	CH ₂ CH ₃	2-chloro-6-methylphenyl
094	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-methylphenyl
095	CH ₂ CH ₃	4-chloro-2-methylphenyl
096	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorophenyl
097	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorophenyl
098	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorophenyl
099	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trichlorophenyl
100	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trichlorophenyl
101	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trichlorophenyl
102	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methoxyphenyl
103	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethoxyphenyl
104	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluoromethylphenyl
105	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cyanoxyphenyl
106	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-methylphenyl

- 50 -

Compound No.	R ¹	R ³
107	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methoxyphenyl
108	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethoxyphenyl
109	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-trifluoromethylphenyl
110	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-cyanophenyl
111	CH ₂ CH ₃	2,6-dichloro-4-methylphenyl
112	CH ₂ CH ₃	pentafluorophenyl

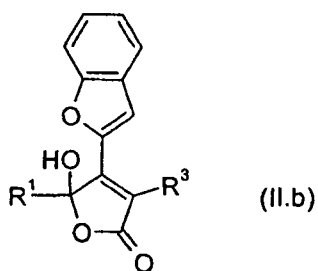
where

a) 112 compounds of formula (II.a):



5 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

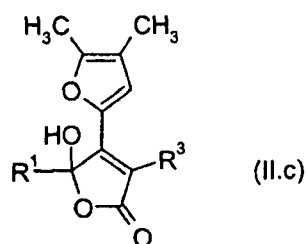
b) 112 compounds of formula (II.b):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

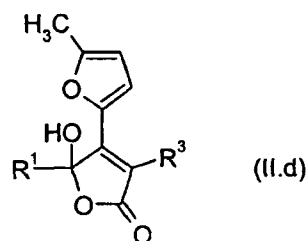
- 51 -

c) 112 compounds of formula (II.c):



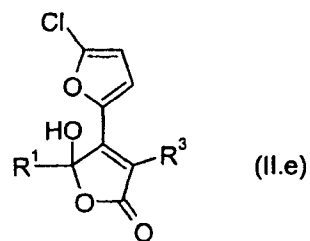
wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

5 d) 112 compounds of formula (II.d):



wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

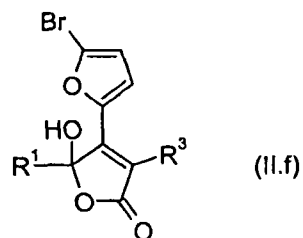
e) 112 compounds of formula (II.e):



10

wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

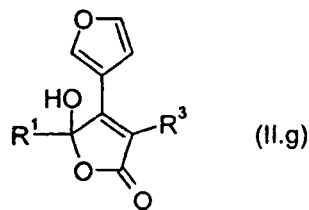
f) 112 compounds of formula (II.f):



15

wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

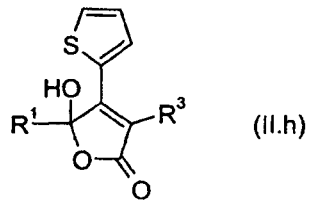
g) 112 compounds of formula (II.g):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5

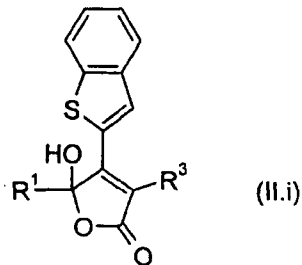
h) 112 compounds of formula (II.h):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

10

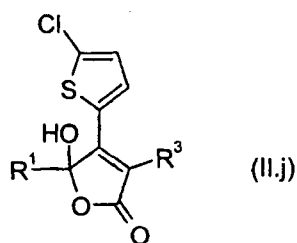
i) 112 compounds of formula (II.i):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

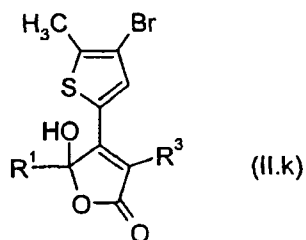
- 53 -

j) 112 compounds of formula (II.j):



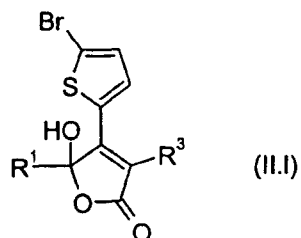
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 k) 112 compounds of formula (II.k):



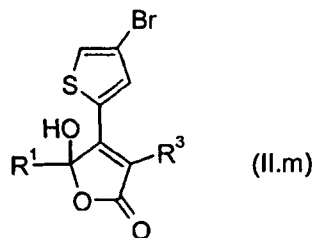
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

l) 112 compounds of formula (II.l):



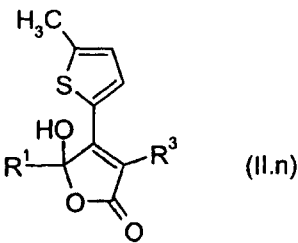
10 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

m) 112 compounds of formula (II.m):



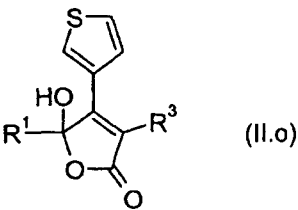
15 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

n) 112 compounds of formula (II.n):



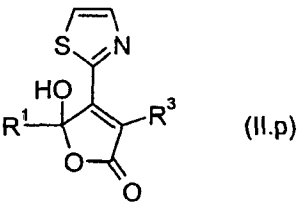
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 o) 112 compounds of formula (II.o):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

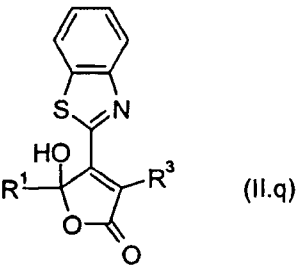
p) 112 compounds of formula (II.p):



10

wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

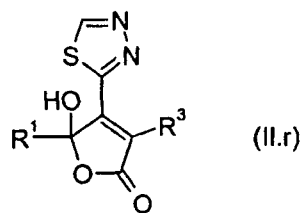
q) 112 compounds of formula (II.q):



15

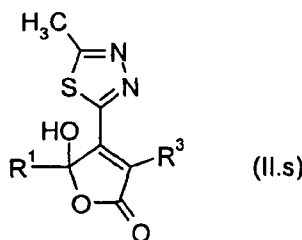
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

r) 112 compounds of formula (II.r):



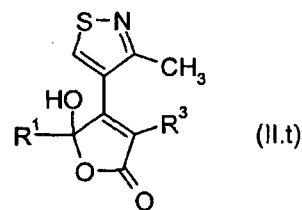
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 s) 112 compounds of formula (II.s):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

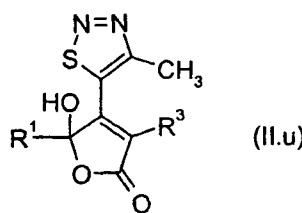
t) 112 compounds of formula (II.t):



10

wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

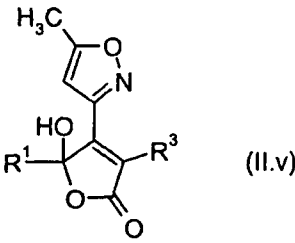
u) 112 compounds of formula (II.u):



15

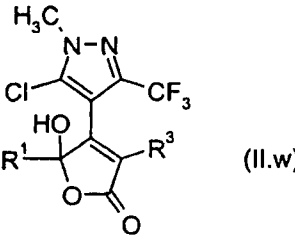
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

v) 112 compounds of formula (II.v):



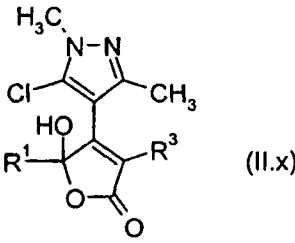
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 w) 112 compounds of formula (II.w):



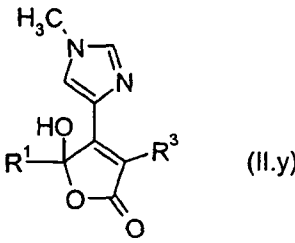
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

x) 112 compounds of formula (II.x):



10 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

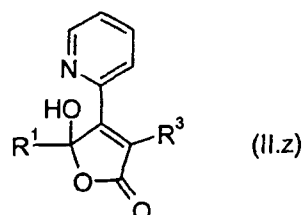
y) 112 compounds of formula (II.y):



15 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

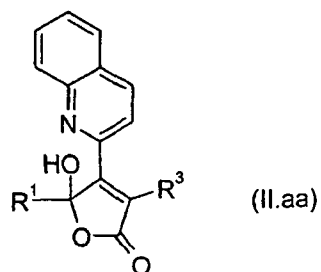
- 57 -

z) 112 compounds of formula (II.z):



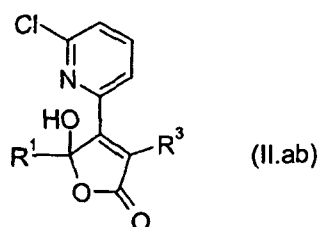
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 aa) 112 compounds of formula (II.aa):



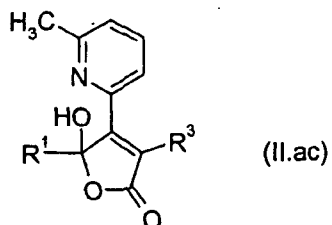
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

ab) 112 compounds of formula (II.ab):



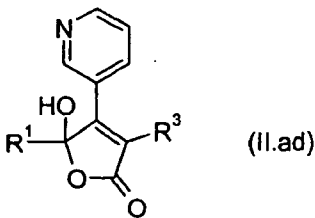
10 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

ac) 112 compounds of formula (II.ac):



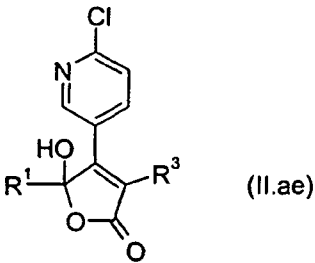
15 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

ad) 112 compounds of formula (II.ad):



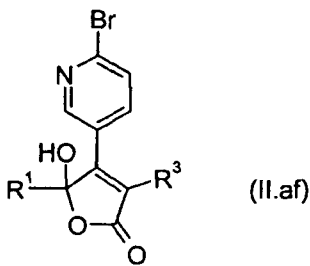
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 ae) 112 compounds of formula (II.ae):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

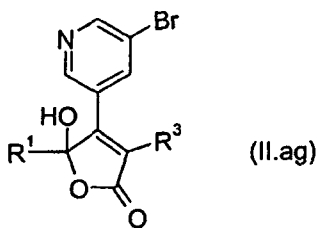
af) 112 compounds of formula (II.af):



10

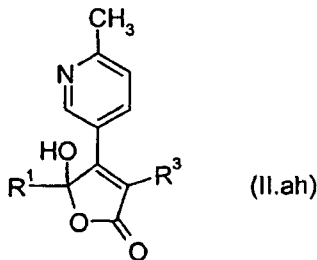
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

ag) 112 compounds of formula (II.ag):



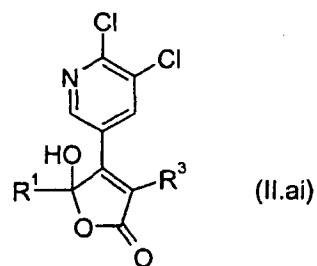
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 ah) 112 compounds of formula (II.ah):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

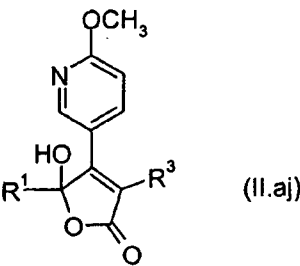
ai) 112 compounds of formula (II.ai):



10

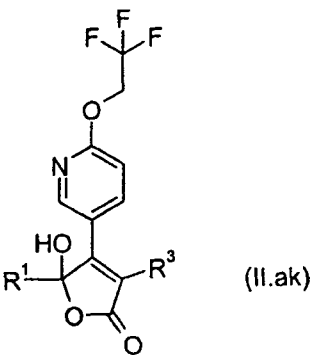
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

aj) 112 compounds of formula (II.aj):



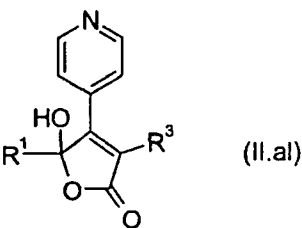
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 ak) 112 compounds of formula (II.ak):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

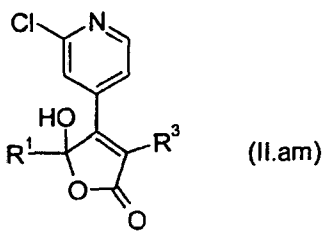
al) 112 compounds of formula (II.al):



10

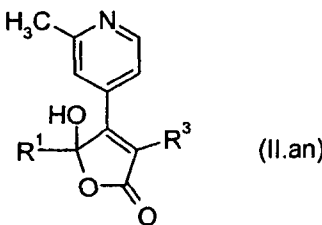
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

am) 112 compounds of formula (II.am):



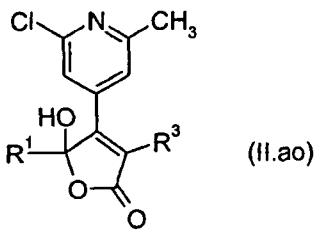
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 an) 112 compounds of formula (II.an):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

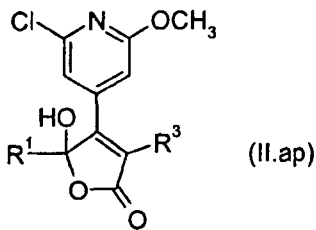
ao) 112 compounds of formula (II.ao):



10

wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

ap) 112 compounds of formula (II.ap):

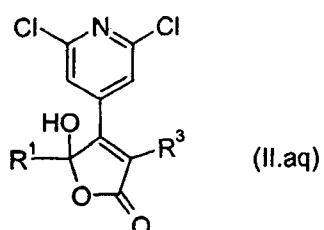


15

wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

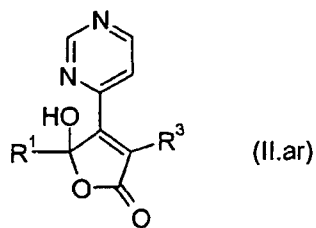
- 62 -

aq) 112 compounds of formula (II.aq):



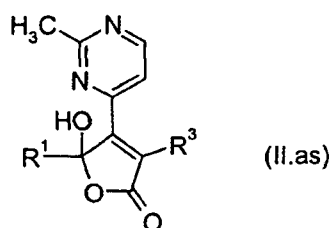
wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

5 ar) 112 compounds of formula (II.ar):



wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

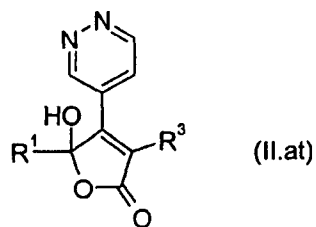
as) 112 compounds of formula (II.as):



10

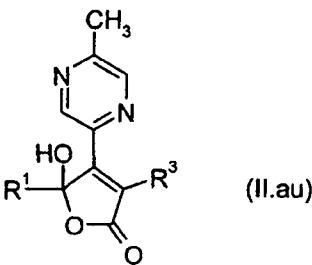
wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

at) 112 compounds of formula (II.at):



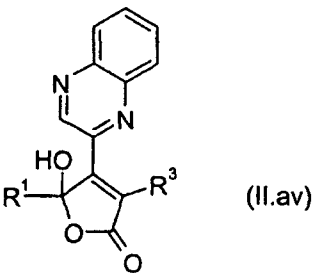
15 wherein R^1 and R^3 are as defined in Table 2.

au) 112 compounds of formula (II.au):



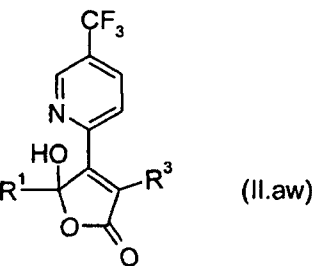
wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

5 av) 112 compounds of formula (II.av):



wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

aw) 112 compounds of formula (II.aw):



10 wherein R¹ and R³ are as defined in Table 2.

15 Throughout this description, temperatures are given in degrees Celsius and "%" is percent by weight, unless corresponding concentrations are indicated in other units.

Table 3 shows selected melting point (unless otherwise stated, no attempt is made to list all characterising data in all cases) for compounds of Tables 1 and 2.

Table 3: Melting point for compounds of Tables 1 and 2

5

Compound Number	m.p. (°C)
I.a.196	230 - 232
I.a.197	84 - 86
I.a.198	106 - 107
I.a.199	109 - 111
I.a.200	103 - 105
I.a.254	116 - 118
I.b.199	147 - 148
I.f.196	194 - 195
I.f.198	59 - 60
I.h.196	249 - 251
I.h.197	71 - 74
I.h.198	90 - 92
I.h.199	124 - 125
I.h.200	100 - 102
I.h.254	130 - 133
I.j.197	91 - 92
I.j.198	102 - 103
I.j.199	111 - 112
I.j.200	111- 113
I.j.359	222 - 223
I.k.197	65 - 67
I.k.198	77 - 78
I.k.199	165 - 171
I.k.254	169 - 171
I.l.196	239 - 241

- 65 -

Compound Number	m.p. (°C)
I.l.198	131 - 132
I.l.199	134 - 136
I.ad.196	246 - 247
I.ad.198	154 - 155
I.ae.078	166 - 167
I.ae.080	177 - 178
I.ae.198	182 - 183
I.ae.199	123 - 124
I.ae.200	126 - 127
I.ai.198	185 - 188
I.aj.078	121 - 122
I.aj.079	107 - 110
I.ak.196	257 - 259
I.ak.198	160 - 161
I.ak.199	129 - 130
I.ak.200	138 - 139
I.am.198	138 - 139
I.aw.198	131 - 132
II.a.040	160 - 162
II.f.040	158 - 159
II.h.040	134 - 136
II.j.040	155 - 156
II.j.096	173 - 175
II.l.040	156 - 158
II.v.040	152 - 155
II.ad.040	129 - 130

The compounds according to the present invention can be prepared according to the above-mentioned reaction schemes, in which, unless otherwise stated, the definition of each variable is as defined above for a compound of formula (I).

- 66 -

Biological examplesAlternaria solani / tomato / preventive (Action against Alternaria on tomato)

- 4 weeks old tomato plants cv. Roter Gnom are treated with the formulated test compound in a spray chamber. Two days after application tomato plants are inoculated by spraying a spore suspension on the test plants. After an incubation period of 4 days at 22 °C / 18 °C and 95% r. h. in a greenhouse the disease incidence is assessed.

- Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.198, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibit fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

Botrytis cinerea / tomato / preventive (Action against Botrytis on tomato)

- 4 weeks old tomato plants cv. Roter Gnom are treated with the formulated test compound in a spray chamber. Two days after application tomato plants are inoculated by spraying a spore suspension on the test plants. After an incubation period of 3 days at 20 °C and 95% r. h. in a greenhouse the disease incidence is assessed.

- Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibit fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

Puccinia recondita / wheat / preventive (Action against brown rust on wheat)

- 1 week old wheat plants cv. Arina are treated with the formulated test compound in a spray chamber. One day after application wheat plants are inoculated by spraying a spore suspension (1 x 10⁵ uredospores/ml) on the test plants. After an incubation period of 1 day

- 67 -

at 20 °C and 95% r. h. plants are kept for 10 days 20 °C / 18 °C (day/night) and 60% r.h. in a greenhouse. The disease incidence is assessed 11 days after inoculation.

Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.197, I.a.198, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibits fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

10 *Magnaporthe grisea (Pyricularia oryzae)* / rice / preventive (Action against rice blast)

3 weeks old rice plants cv. Koshihikari are treated with the formulated test compound in a spray chamber. Two days after application rice plants are inoculated by spraying a spore suspension (1×10^5 conidia/ml) on the test plants. After an incubation period of 6 days at 25°C and 95% r. h. the disease incidence is assessed.

15

Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.198, I.a.199, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibit fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants is infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

20

Pyrenophora teres (Helminthosporium teres) / barley / preventive (Action against net blotch on barley)

1-week-old barley plants cv. Regina are treated with the formulated test compound in a spray chamber. Two days after application barley plants are inoculated by spraying a spore suspension (2.6×10^4 conidia/ml) on the test plants. After an incubation period of 4 days at 20 °C and 95% r. h. the disease incidence is assessed.

25

Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198 and I.ae.200 at 200 ppm inhibit

30

fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

Septoria tritici / wheat / preventive (Action against Septoria leaf spot on wheat)

5 2 weeks old wheat plants cv. Riband are treated with the formulated test compound in a spray chamber. One day after application wheat plants are inoculated by spraying a spore suspension (10^6 conidia/ml) on the test plants. After an incubation period of 1 day at 22 °C / 21 °C and 95% r. h. plants are kept at 22 °C / 21 °C and 70% r.h. in a greenhouse. The disease incidence is assessed 16 - 18 days after inoculation.

10

Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibits fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

15

Uncinula necator / grape / preventive (Action against powdery mildew on grape)

5 weeks old grape seedlings cv. Gutedel are treated with the formulated test compound in a spray chamber. One day after application grape plants are inoculated by shaking plants infected with grape powdery mildew above the test plants. After an incubation period of 7 days at 24 °C / 22 °C and 70% r. h. under a light regime of 14/10 h (light/dark) the disease incidence is assessed.

20

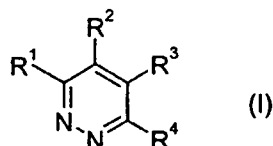
25 Compounds of formula I according to the invention, in particular compounds I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.198, I.ae.199 and I.ae.200 at 200 ppm inhibit fungal infestation in this test to at least 80 %, while under the same conditions untreated control plants are infected by the phytopathogenic fungi to over 80 %.

30

- 69 -

What is claimed is:

1. A compound of formula I:



wherein

- 5 R^1 is hydrogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl or C_3 - C_6 cycloalkyl;
 R^2 is an optionally substituted heteroaryl;
 R^3 is an optionally substituted aryl; and
 R^4 is hydrogen, halogen, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, hydroxy
 or cyano;
- 10 or an agrochemically usable salt form thereof.

2. The compound according to claim 1 wherein R^1 is C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl or C_3 - C_6 cycloalkyl.

- 15 3. The compound according to either claims 1 or 2 wherein R^2 is an optionally substituted
 furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl,
 oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl,
 triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothiophenyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, indazolyl,
 benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxaliny,
- 20 quinazolinyl, cinnolinyl or naphthyridinyl.

4. The compound according to any one of claims 1 to 3 wherein R^3 is an optionally
 substituted phenyl, naphthyl, anthracenyl, phenanthrenyl or biphenyl.

- 25 5. The compound according to any one of claims 1 to 4 wherein R^4 is halogen, C_1 - C_6 alkyl,
 C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, hydroxy or cyano.

6. The compound according to any one of claims 1 to 5 wherein
 R^1 is C_1 - C_6 alkyl or C_1 - C_6 haloalkyl;

- 70 -

R² is an optionally substituted furyl, thienyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, benzothiophenyl, benzofuranyl, benzothiazolyl, quinolyl or quinoxaliny;

R³ is an optionally substituted phenyl, naphthyl or biphenyl; and

5 R⁴ is halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy or hydroxy.

7. The compound according to any one of claims 1 to 6 wherein

R¹ is C₁-C₆alkyl;

R² is an optionally substituted furyl, thienyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl or benzofuranyl;

R³ is an optionally substituted phenyl or naphthyl; and

10 R⁴ is halogen, C₁-C₃alkyl, C₁-C₆alkoxy or hydroxy.

8. The compound according to any one of claims 1 to 7 wherein

15 R¹ is C₁-C₃alkyl;

R² is an optionally substituted substituted furyl, thienyl, pyridyl, pyridazinyl or pyrimidinyl;

R³ is an optionally substituted phenyl; and

R⁴ is fluoro, chloro, C₁-C₃alkyl, C₁-C₃alkoxy or hydroxy.

9. The compound according to any one of claims 1 to 8 wherein

R¹ is methyl or ethyl;

R² is an optionally substituted substituted furyl, thienyl, pyridyl or pyrimidinyl;

R³ is 2,4,6-trifluorophenyl, 2-chloro-6-fluorophenyl or 2,6-dichloro-4-methoxyphenyl; and

20 R⁴ is fluoro, chloro, methyl, methoxy or hydroxy.

25 10. A compound selected from

3-chloro-5-furan-2-yl-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-(5-bromofuran-2-yl)-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

30 3-chloro-5-(5-chlorothiophen-2-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

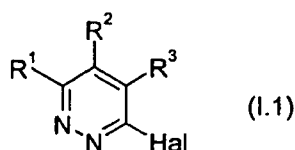
3-chloro-6-methyl-5-pyridin-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

3-chloro-5-(6-chloropyridin-2-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,

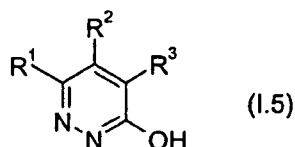
- 71 -

- 3-chloro-6-methyl-5-pyridin-3-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-chloro-5-(6-chloropyridin-3-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-chloro-6-methyl-5-pyridin-4-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-chloro-5-(2,6-dichloropyridin-4-yl)-6-methyl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 5 3-chloro-6-methyl-5-pyrimidin-4-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-chloro-6-methyl-5-(2-methylpyrimidin-4-yl)-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine,
 3-methoxy-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,6-difluoro-4-methoxyphenyl)-pyridazine,
 3-fluoro-6-methyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine, and
 10 3,6-dimethyl-5-thiophen-2-yl-4-(2,4,6-trifluorophenyl)-pyridazine.

11. A process for the preparation of a compound of formula I.1,

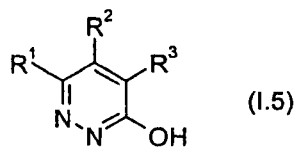


- wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I and Hal is halogen, which
 15 comprises reacting a compound of formula I.5,

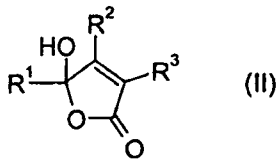


wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with a phosphorus
 oxyhalide or a thionyl halide.

- 20 12. A process for the preparation of a compound of formula I.5,

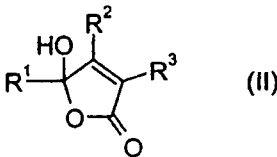


wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, which comprises reacting a
 compound of formula II,

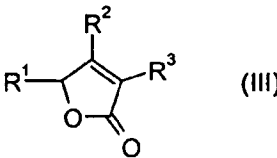


wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with a hydrazine derivative.

13. A process for the preparation of a compound of formula II,

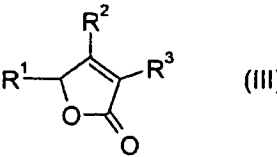


wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, which comprises oxidising a compound of formula III,

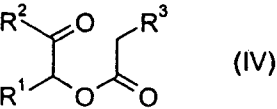


wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with oxygen, air or 3-chloroperbenzoic acid.

14. A process for the preparation of a compound of formula III,



wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, which comprises reacting a compound of formula IV,



wherein R¹, R² and R³ are as defined for compound of formula I, with a base.

- 73 -

15. A fungicidal composition for controlling or protecting against phytopathogenic microorganisms, comprising as active ingredient at least one compound as defined in any one of claims 1 to 10, in free form or in agrochemically usable salt form, and at least one adjuvant.

5

16. The composition according to claim 15, which comprises at least one additional fungicidally active compound, preferably selected from the group consisting of azoles, pyrimidinyl carbinols, 2-amino-pyrimidines, morpholines, anilinopyrimidines, pyrroles, phenylamides, benzimidazoles, dicarboximides, carboxamides, strobilurines, 10 dithiocarbamates, N-halomethylthiotetrahydrophthalimides, copper-compounds, nitrophenols, organo-phosphor-derivatives, pyridazines, triazolopyrimidines, carboxamides or benzamides.

17. The use of a compound as defined in any one of claims 1 to 10 for controlling or 15 preventing infestation of plants, harvested food crops or non-living materials by phytopathogenic microorganisms.

18. A method of controlling or preventing an infestation of crop plants, harvested food crops or non-living materials by phytopathogenic or spoilage microorganisms or organisms 20 potentially harmful to man, which comprises the application of a compound as defined in any one of claims 1 to 10, as active ingredient to the plant, to parts of the plants or to the locus thereof or to any part of the non-living materials.

19. The method according to claim 18, wherein the phytopathogenic microorganisms are 25 fungal organisms.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/006304

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D401/04 C07D403/04 C07D405/04 C07D407/04 C07D409/04 C07D413/04 C07D417/04 A01N43/58		
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, EMBASE, WPI Data, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 10 133342 A (KONISHIROKU PHOTO IND) 22 May 1998 (1998-05-22) page 6; compound 13	1,4
X	UDDIN MD J ET AL: "Design and Synthesis of Novel Rofecoxib Analogs as Potential Cyclooxygenase (COX-2) Inhibitors: Replacement of the Methylsulfonyl Pharmacophore by a Sulfonylazide Bioisostere" JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY 2003 UNITED STATES, vol. 40, no. 5, 2003, pages 861-868, XP002458294 ISSN: 0022-152X page 863; compounds 10,11	14
-/--		
☒ 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. *Z* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 13 November 2007		Date of mailing of the international search report 22/11/2007
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 Duval, Eric

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/006304

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	WO 2007/066601 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; MANABE AKIO [JP]) 14 June 2007 (2007-06-14) page 52; compound 9 -----	1-19
E	WO 2007/080720 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; SOUMA SHIN-ICHIRO [JP]; MANABE AKIO [JP]) 19 July 2007 (2007-07-19) pages 55-58; compounds 3-7 -----	1-19
A	WO 2006/001175 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; MORISHITA HIROSHI [JP]; MANABE AKIO [JP]) 5 January 2006 (2006-01-05) cited in the application claim 1 -----	1
A	WO 2005/121104 A (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; MORISHITA HIROSHI [JP]; MANABE AKIO [JP]) 22 December 2005 (2005-12-22) cited in the application claim 1 -----	1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

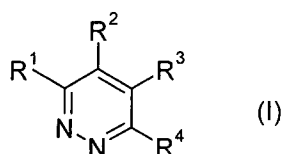
PCT/EP2007/006304

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 10133342	A	22-05-1998	NONE	
WO 2007066601	A	14-06-2007	NONE	
WO 2007080720	A	19-07-2007	NONE	
WO 2006001175	A	05-01-2006	EP 1775290 A1	18-04-2007
WO 2005121104	A	22-12-2005	AU 2005252061 A1	22-12-2005
			EP 1767529 A1	28-03-2007

NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA

La presente invención se refiere a nuevos derivados de piridazina como ingredientes activos con actividad microbicida, en particular actividad fungicida. La invención también se refiere a la preparación de estos ingredientes activos, a nuevos derivados heterocíclicos usados como intermediarios en la preparación de estos ingredientes activos, a la preparación de estos nuevos intermediarios, a composiciones agroquímicas que comprenden por lo menos uno de los nuevos ingredientes activos, a la preparación de estas composiciones y al uso de los ingredientes activos o composiciones en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, de cultivos para uso alimentario cosechados o de materiales inertes por parte de microorganismos patogénicos, preferiblemente hongos.

La presente invención proporciona un compuesto de Fórmula I:



donde

R¹ es hidrógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆;

R² es un heteroarilo opcionalmente sustituido;

R³ es un arilo opcionalmente sustituido; y

R⁴ es hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, hidroxilo o ciano;

o una forma sal del mismo utilizable como agroquímico.

En la definición anterior arilo incluye anillos de hidrocarburo aromático como fenilo, naftilo, antracenilo, fenantrenilo y bifenilo, entre los que fenilo es el preferido.

Heteroarilo se refiere a sistemas anulares aromáticos que comprenden sistemas mono-, bi- o tricíclicos donde por lo menos un átomo de oxígeno, nitrógeno o azufre está presente como miembro anular. Algunos ejemplos son furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo, quinolilo, isoquinolinilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinolinilo y naftiridinilo. Cada heteroarilo puede estar unido por un átomo de carbono o por un átomo de nitrógeno a la piridazina.

Los grupos arilo y heteroarilo precedentes pueden estar opcionalmente sustituidos. Esto significa que pueden portar uno o más sustituyentes idénticos o diferentes. Normalmente no están presentes más de tres sustituyentes al mismo tiempo. Ejemplos de sustituyentes de grupos arilo o heteroarilo son: halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenilo, haloalquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, alquiloxi, haloalquiloxi, cicloalcoxi, alqueniloxi, haloalqueniloxi, alquiniloxi, haloalqueniloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alqueniltio, alquiniltio, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxialquilo, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alquilamino, dialquilamino. Típicos ejemplos de arilo opcionalmente sustituido son 2-fluorfenilo, 2-clorofenilo, 2-trifluorometilfenilo, 2-metilfenilo, 2,3-difluorfenilo, 2,4-difluorfenilo, 2,5-difluorfenilo, 2,6-difluorfenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 2-cloro-3-fluorfenilo, 2-cloro-4-fluorfenilo, 2-cloro-5-fluorfenilo, 2-cloro-6-fluorfenilo, 3-cloro-

2-fluorfenilo, 4-cloro-2-fluorfenilo, 5-cloro-2-fluorfenilo, 2-fluoro-3-trifluorometilfenilo, 2-fluoro-4-trifluorometilfenilo, 2-fluoro-5-trifluorometilfenilo, 2-fluoro-6-trifluorometilfenilo, 2-cloro-3-trifluorometilfenilo, 2-cloro-4-trifluorometilfenilo, 2-cloro-5-trifluorometilfenilo, 2-cloro-6-trifluorometilfenilo, 4-fluoro-2-trifluorometilfenilo, 4-cloro-2-trifluorometilfenilo, 2-fluoro-3-metilfenilo, 2-fluoro-4-metilfenilo, 2-fluoro-5-metilfenilo, 2-fluoro-6-metilfenilo, 2-cloro-3-metilfenilo, 2-cloro-4-metilfenilo, 2-cloro-5-metilfenilo, 2-cloro-6-metilfenilo, 4-fluoro-2-metilfenilo, 4-cloro-2-metilfenilo, 2,4,6-trifluorfenilo, 2,3,6-trifluorfenilo, 2,3,4-trifluorfenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,3,6-triclorofenilo, 2,3,4-triclorofenilo, 2,6-difluoro-4-metoxifenilo, 2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo, 2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo, 2,6-difluoro-4-cianofenilo, 2,6-difluoro-4-metilfenilo, 2,6-dicloro-4-metoxifenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo, 2,6-dicloro-4-cianofenilo, 2,6-dicloro-4-metilfenilo, pentafluorfenilo. Típicos ejemplos de heteroarilo opcionalmente sustituido son 5-clorotiofen-2-ilo, 4-bromo-5-metiltiofen-2-ilo, 4-bromotiofen-2-ilo, 5-bromotiofen-2-ilo, 5-metiltiofen-2-ilo, 5-bromofuran-2-ilo, 4,5-dimetilfuran-2-ilo, 5-metilfuran-2-ilo, 5-clorofuran-2-ilo, 3-metilisotiazol-4-ilo, 5-metilisoxazol-3-ilo, 6-cloropiridin-2-ilo, 6-metilpiridin-2-ilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-bromopiridin-3-ilo, 5-bromopiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 5,6-dicloropiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, 2,6-dicloropiridin-4-ilo, 2-metilpirimidin-4-ilo.

En la definición anterior halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los radicales alquilo, alquenilo o alquinilo pueden ser de cadena recta o ramificada.

Alquilo por si solo o como parte de otro sustituyente es, según la cantidad de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo y los isómeros de los mismos, por ejemplo, isopropilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, isopentilo o terc-pentilo.

Un grupo haloalquilo puede contener uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes y, por ejemplo, puede representar CH_2Cl , CHCl_2 , CCl_3 , CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CF_3CH_2 , CH_3CF_2 , CF_3CF_2 o CCl_3CCl_2 .

5 Cicloalquilo por si solo o como parte de otro sustituyente es, según la cantidad de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Alquenilo por si solo o como parte de otro sustituyente es, según la cantidad de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, etenilo, alilo, 1-propenilo, buten-2-ilo, buten-3-ilo, penten-1-ilo, penten-3-ilo, hexen-1-ilo o 4-metil-10 3-pentenilo.

Alquinilo por si solo o como parte de otro sustituyente es, según la cantidad de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, etinilo, propin-1-ilo, propin-2-ilo, butin-1-ilo, butin-2-ilo, 1-metil-2-butinilo, hexin-1-ilo o 1-etil-2-butinilo.

La presencia de uno o más posibles átomos de carbono asimétricos en un 15 compuesto de Fórmula I indica que los compuestos pueden presentarse en formas ópticamente isoméricas, o sea formas enantioméricas o diastereoméricas. Como consecuencia de la presencia de un posible doble enlace $\text{C}=\text{C}$ alifático, también puede haber isomerismo geométrico, o sea isomerismo cis-trans o (E)-(Z). También pueden presentarse los atropisómeros como consecuencia de la 20 rotación restringida alrededor de un enlace simple. La Fórmula I incluye todas estas posibles formas isoméricas y mezclas de las mismas. La presente invención incluye todas estas posibles formas isoméricas y mezclas de las mismas para un compuesto de Fórmula I.

En una primera realización, R^1 es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o 25 cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$.

En una segunda realización, R^2 es un furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo, quinolilo, isoquinolinilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinolinilo o naftiridinilo opcionalmente sustituido.

En una tercera realización, R^3 es un fenilo, naftilo, antraceno, fenantreno, o bifenilo opcionalmente sustituido.

10 En una cuarta realización, R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , hidroxilo o ciano.

Subgrupos preferidos de compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos donde R^1 es alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ;

15 R^2 es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, benzotiazolilo, quinolilo o quinoxalinilo opcionalmente sustituido;

R^3 es un fenilo, naftilo o bifenilo opcionalmente sustituido; y

R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o hidroxilo.

20 Otros subgrupos más preferidos de compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos donde

R^1 es alquilo C_1-C_6 ;

25 R^2 es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo o benzofuranilo opcionalmente sustituido;

R^3 es un fenilo o naftilo opcionalmente sustituido; y

R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_6 o hidroxí.

Los subgrupos más preferidos de compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos donde

5 R^1 es alquilo C_1-C_3 ;

R^2 es un furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo o pirimidinilo opcionalmente sustituido;

R^3 es un fenilo opcionalmente sustituido; y

R^4 es flúor, cloro, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 o hidroxí.

10 Subgrupos especialmente preferidos de compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos donde

R^1 es metilo o etilo;

R^2 es un furilo, tienilo, piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituido;

R^3 es 2,4,6-trifluorfenilo, 2-cloro-6-fluorfenilo o 2,6-dicloro-4-metoxifenilo; y

15 R^4 es flúor, cloro, metilo, metoxi o hidroxí.

Los compuestos particulares preferidos son:

3-cloro-5-furan-2-il-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-(5-bromofuran-2-il)-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

20 3-cloro-5-(5-clorotiofen-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-piridin-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-5-(6-cloropiridin-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-piridin-3-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

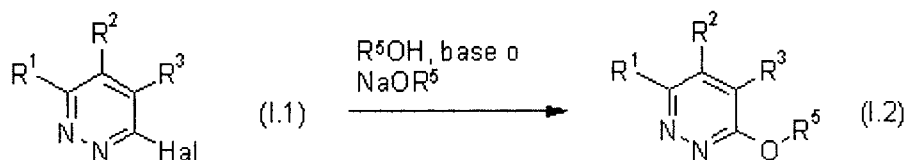
- 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
3-cloro-6-metil-5-piridin-4-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
3-cloro-5-(2,6-dicloropiridin-4-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
3-cloro-6-metil-5-pirimidin-4-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
5 3-cloro-6-metil-5-(2-metilpirimidin-4-il)-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-piridazina,
3-fluoro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina, y
3,6-dimetil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina.

- 10 Se ha sugerido que ciertos derivados de piridazina con dos grupos fenilo en las posiciones 4 y 5 controlan hongos perjudiciales para las plantas, por ejemplo en WO 2005/121104 y WO 2006/001175. Sin embargo, la acción de esos preparados no resulta satisfactoria para cubrir todos los aspectos de las necesidades de la agricultura. La novedad es que, con los compuestos de
15 Fórmula I} ahora se han descubierto nuevas clases de fungicidas que tienen un alto nivel de actividad biológica.

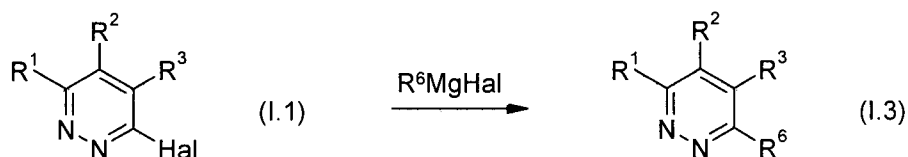
- Los compuestos de Fórmula (I.1), (I.2), (I.3), (I.4) y (I.5), en los que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados más arriba, son todos ejemplos de compuestos de la Fórmula General (I) y pueden prepararse como se ilustra en los
20 siguientes esquemas.

- Los compuestos de Fórmula I.2, donde R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son como se definió para los compuestos de Fórmula I y R^5 es alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , pueden obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de Fórmula I.1, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I y Hal es halógeno,
25 preferiblemente flúor, cloro o bromo, con un alcohol R^5OH , donde R^5 es alquilo C_1-

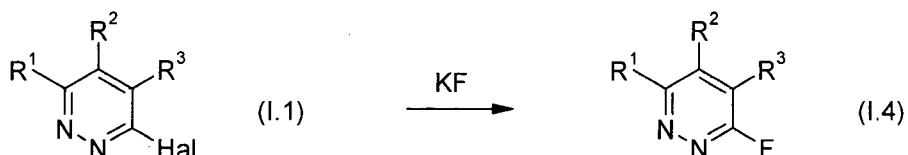
C₆ o haloalquiloC₁-C₆, y una base o con un alcóxido de sodio NaOR⁵, donde R⁵ es alquiloC₁-C₆ o haloalquiloC₁-C₆.



Los compuestos de Fórmula I.3, donde R¹, R², R³ y R⁶ son como se definió para los compuestos de Fórmula I y R⁶ es alquiloC₁-C₆, pueden obtenerse por transformación de un compuesto de Fórmula I,1, donde R¹, R² y R³ son como se definió para los compuestos de Fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo, con un reactivo Grignard R⁶MgHal, donde R⁶ es alquiloC₁-C₆ y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo, en presencia de un catalizador de metal de transición.

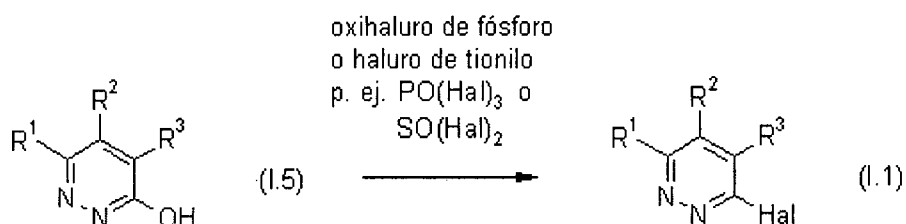


Los compuestos de Fórmula I.4, donde R¹, R² y R³ son como se definió para los compuestos de Fórmula I, pueden obtenerse por transformación de un compuesto de Fórmula I,1, donde R¹, R² y R³ son como se definió para los compuestos de Fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo, con un fluoruro inorgánico, p. ej. fluoruro de potasio.

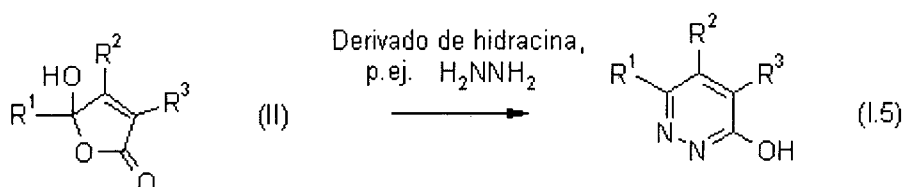


Los compuestos de Fórmula I.1, donde R¹, R² y R³ son como se definió para los compuestos de Fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo, pueden obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de Fórmula I,5, donde R¹, R² y R³ son como se definió para los compuestos de Fórmula I, con un

oxihaluro de fósforo, p. ej. oxiclورو de fósforo u oxibromuro de fósforo, o haluro de tionilo, p. ej. clورو de tionilo o bromuro de tionilo.

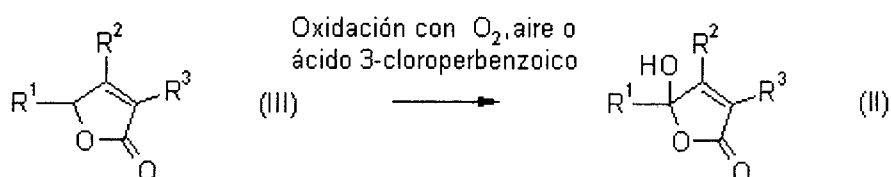


- 5 Los compuestos de Fórmula I.5, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, pueden obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de Fórmula II, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, con un derivado de hidracina, p. ej. hidrato de hidracina.



10

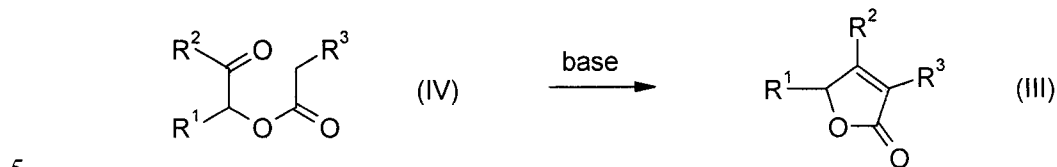
Los compuestos de Fórmula II, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, pueden obtenerse por oxidación de un compuesto de Fórmula III, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, con oxígeno, aire o ácido 3-cloroperbenzoico.



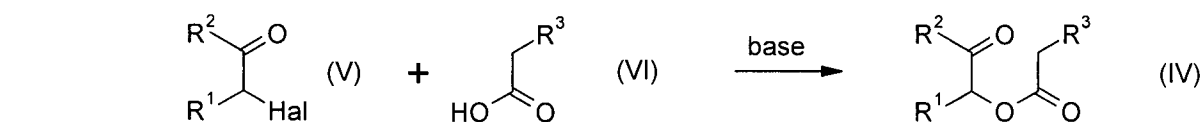
15

Los compuestos de Fórmula III, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, pueden obtenerse haciendo reaccionar un

compuesto de Fórmula IV, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, con una base, p. ej. piridina, trietilamina, diisopropiletilamina, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno.



Los compuestos de Fórmula IV, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se definió para los compuestos de Fórmula I, pueden obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de Fórmula V, donde R^1 y R^2 son como se definió para los compuestos de Fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo, con un compuesto de Fórmula VI, donde R^3 es como se definió para los compuestos de Fórmula I, y una base, p. ej. piridina, trietilamina, diisopropiletilamina, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno.



15 Ahora se ha descubierto que los nuevos compuestos de Fórmula I tienen, en la práctica, un espectro muy prometedor de actividades para proteger plantas contra enfermedades causadas por hongos así como bacterias y virus.

Los compuestos de Fórmula I pueden emplearse en el sector agrícola y otros campos relacionados con el mismo como ingredientes activos para controlar plagas vegetales o en materiales inertes para el control de microorganismos u organismos destructivos potencialmente dañinos para el hombre. Estos nuevos compuestos se diferencian por su excelente actividad en bajas proporciones de aplicación, porque las plantas los toleran bien y por ser seguros para el ambiente.

20

Poseen propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles y se usan para proteger numerosos cultivos. Los compuestos de Fórmula I pueden emplearse para inhibir o destruir las plagas que actúan sobre plantas o partes de plantas (frutos, pimpollos, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de distintos cultivos de plantas
5 útiles, al mismo tiempo que se protegen también aquellas partes de las plantas que se desarrollan más tarde, p. ej. de los microorganismos fitopatogénicos.

También es posible emplear los compuestos de Fórmula I como agentes abonadores para el tratamiento del material de propagación vegetal, p. ej., semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o estacas para plantas (por
10 ejemplo arroz), para la protección contra infecciones fúngicas así como contra hongos fitopatogénicos que pululan en el suelo. El material de propagación puede tratarse con una composición que comprende un compuesto de Fórmula I antes de plantarlo: por ejemplo las semillas pueden embeberse en el compuesto antes de sembrarlas. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención también
15 pueden aplicarse a granos (blanqueo), ya sea impregnando las semillas en una formulación líquida o recubriéndolas con una formulación sólida. La composición también puede aplicarse en el terreno en que se plantará el material de propagación, por ejemplo, en los surcos para las semillas mientras se siembra. La invención se refiere también a dichos métodos para tratar el material de
20 propagación vegetal y para el material de propagación vegetal así tratado.

Por otra parte, los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden usarse para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo para la protección de materiales técnicos, incluyendo madera y productos técnicos relacionados con la misma, en el almacenamiento de alimentos y en el control
25 higiénico.

Además, la invención podría usarse para proteger materiales inertes del ataque de hongos, p. ej. madera procesada, placas y pintura de paredes.

Los compuestos de Fórmula I son, por ejemplo, efectivos contra los hongos fitopatogénicos de las siguientes clases: Fungi imperfecti (p. ej. *Botrytis* spp., *Alternaria* spp.) y Basidiomycetes (p. ej. *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.). Adicionalmente, resultan

5 también efectivos contra Ascomycetes (p. ej. *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Podosphaera leucotricha*, *Monilinia* spp., *Fusarium* spp., *Uncinula* spp., *Mycosphaerella* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium secalis*, *Magnaporthe* spp., *Colletotrichum* spp., *Gaeumannomyces graminis*, *Tapesia* spp., *Ramularia* spp., *Microdochium nivale*, *Sclerotinia* spp.) y Oomycetes (p. ej. *Phytophthora*

10 spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Pseudoperonospora cubensis*). Se ha observado una actividad relevante contra mildiú polvoroso (p. ej. *Uncinula necator*), royos (p. ej. *Puccinia* spp.) y puntos foliares (p. ej. *Septoria tritici*). Además, los nuevos compuestos de Fórmula I son efectivos contra bacterias y virus fitopatogénicos (p. ej. contra *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia*

15 *amylovora* así como contra el virus mosaico del tabaco).

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos objetivo ideales para proteger comprenden las siguientes especies de plantas: cereales (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha azucarera y remolacha forrajera); frutas de pepita, drupas y fruta

20 blanda (manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, frutillas, frambuesas y moras); plantas leguminosas (porotos, lentejas, arvejas, porotos de soja); plantas oleaginosas (colza, mostaza, amapola, olivas, girasoles, coco, plantas de ricino, granos de cacao, maní); plantas cucurbitáceas (calabazas, pepinos, melones); plantas de fibra (algodón, lino, cáñamo, yute); cítricos

25 (naranjas, limones, toronjas, mandarinas); verduras (espinaca, lechuga, espárragos, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, papas, pimientos); lauráceas (palta, canela, alcanfor) o plantas tales como tabaco, nueces, café, berenjenas,

caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulos, bananas y plantas de goma natural, así como césped y ornamentales.

Entre los cultivos objetivo de acuerdo con la invención se incluyen variedades convencionales así como mejoradas genéticamente o de ingeniería
5 tales como, por ejemplo, resistentes a los insectos (p. ej. Variedades Bt. y VIP) así como resistentes a enfermedades y tolerantes a los herbicidas (p. ej. Variedades de maíz resistentes al glifosato y glufosinato disponibles en el comercio con los nombres de RoundupReady® y LibertyLink®) y variedades tolerantes a los nematodos. Como ejemplo de variedad de cultivo adecuado de ingeniería
10 genética o mejorado genéticamente, se pueden nombrar las variedades de algodón Stoneville 5599BR y Stoneville 4892BR.

Los compuestos de Fórmula I se usan sin modificar o, preferiblemente, junto con los adyuvantes que habitualmente se emplean en el arte de la formulación. Con este fin se formulan de manera conveniente por medios
15 conocidos como concentrados emulsionables, pastas de untar, soluciones o suspensiones pulverizables o diluibles directamente, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos finos, granulados, y también encapsulados p. ej. en sustancias poliméricas. Al igual que el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, por ejemplo para pulverizar, atomizar, espolvorear,
20 esparcir, revestir o verter, se eligen según los objetivos en cuestión y las circunstancias del caso. Las composiciones también pueden contener otros adyuvantes tales como estabilizadores, antiespumas, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o ligantes así como fertilizantes, dadores de micronutrientes u otras formulaciones para lograr efectos especiales.

25 Los portadores y adyuvantes adecuados pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en la tecnología de la formulación, p. ej. sustancias minerales naturales o regeneradas, solventes, dispersantes, agentes

humectantes, aglutinantes, espesantes, ligantes o fertilizantes. Portadores de este tipo se describen en WO 97/33890.

Los compuestos de Fórmula I normalmente se emplean en forma de composiciones y pueden aplicarse en el área de los cultivos o en las plantas a
5 tratar, simultáneamente o de manera consecutiva con otros compuestos. Estos otros compuestos pueden ser, p. ej. fertilizantes o dadores de micronutrientes u otras preparaciones, que intervienen en el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varias de estas preparaciones, si se
10 quiere junto con otros portadores, surfactantes o adyuvantes facilitadores de la aplicación que se emplean habitualmente en el arte de la formulación.

Los compuestos de Fórmula I normalmente se usan en forma de composiciones fungicidas para controlar o proteger contra microorganismos fitopatogénicos, que comprenden como ingrediente activo por lo menos un
15 compuesto de Fórmula I, en forma libre o en forma sal para uso agroquímico, y por lo menos uno de los recién mencionados adyuvantes.

Los compuestos de Fórmula I pueden mezclarse con otros fungicidas, lo cual produce en ciertos casos actividades sinérgicas inesperadas. Los componentes que se prefieren en particular para mezclar son :

20 Azoles, tales como azaconazol, BAY 14120, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, pefurazoato, penconazol, protioconazol, pirifenox, procloraz, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol,
25 triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol;

Pirimidinil carbinoles, tales como ancimidol, fenarimol, nuarimol;

2-amino-pirimidinas, tales como bupirinato, dimetirimol, etirimol;

Morfolinas, tales como dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, tridemorf;

Anilinopirimidinas, tales como ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil;

5 Pirroles, tales como fenciclonil, fludioxonil;

Fenilamidas, tales como benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, R-metalaxilo, ofurace, oxadixilo;

Bencimidazoles, tales como benomilo, carbendazim, debacarb, fuberidazol, tiabendazol;

10 Dicarboximidas, tales como clozolinato, diclozolina, iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina;

Carboxamidas, tales como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, mepronil, oxicarboxin, pentiopirad, tifulzamida;

Guanidinas, tales como guazatina, dodina, iminoctadina;

15 Estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, trifloxistrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina;

Ditiocarbamatos, tales como ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;

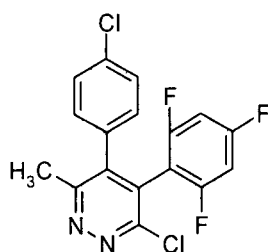
20 N-halometiltiotetrahidroftalimidas, tales como captafol, captan, diclofluanid, fluoromidas, folpet, tolfluanid;

Compuestos de cobre, tales como mezcla Bordeaux, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancozeb, oxina-cobre;

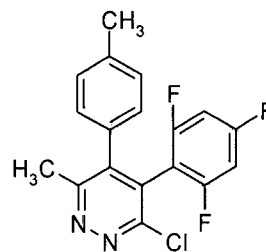
Derivados de nitrofenol, tales como dinocap, nitrofenol-isopropilo;

Derivados organofosfóricos, tales como edifenfos, iprobenfos, isoprotilane, fosdifen, pirazofos, tolclofos-metilo;

Derivados de piridazina que son conocidos y pueden prepararse mediante métodos como se describe en WO 05/121104 y WO 06/001175, tales como 3-cloro-5-(4-cloro-fenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Fórmula P,1) y 3-cloro-6-metil-5-p-tolil-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Fórmula P,2);

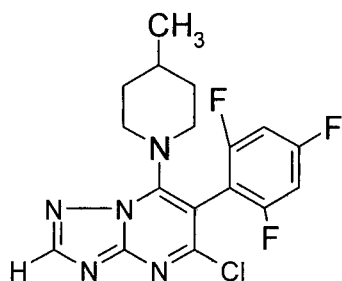


P.1



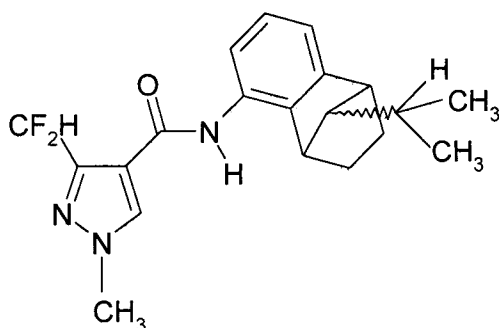
P.2

Derivados de triazolopirimidina que son conocidos y pueden prepararse mediante métodos como se describe en WO 98/46607, tales como 5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (Fórmula T.1);



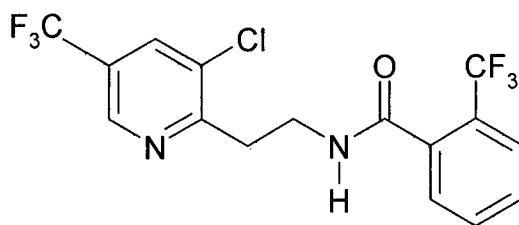
T.1

Derivados de carboxamida que son conocidos y pueden prepararse mediante métodos como se describe en WO 04/035589 y en WO 06/37632, tales como (9-isopropil-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metan-naftalen-5-il)-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (Fórmula U.1);



U.1

Derivados de benzamida que son conocidos y pueden prepararse mediante métodos como se describe en WO 2004/016088, tales como N-{2-[3-cloro-5-
5 (trifluorometil)-2-piridinil]etil}-2-trifluorometilbenzamida, que también se conoce con el nombre de fluopiram (Fórmula V.1);



V.1

y

10 otros varios, tales como acibenzolar-S-metilo, anilazina, bentiavalicarb, blastidina-S, quinometionato, cloroneb, clorotalonil, ciflufenamid, cimoxanil, diclona, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, dimetomorf, flumorf, ditianon, etaboxam, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenoxanil, fentina, ferimzona, fluazinam, fluopicolida, flusulfamida, fenhexamid, fosetil-aluminio,
15 himexazol, iprovalicarb, ciazofamid, kasugamicina, mandipropamid, metasulfocarb, metrafenona, nicobifen, pencicuron, ftalida, polioxinas, probenazol, propamocarb, proquinazid, piroquilón, quinoxifeno, quintoceno, azufre, tiadinil, triazoxida, triciclazol, triforina, validamicina, zoxamida y glifosato.

Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de Fórmula I, de una composición que comprende por lo menos un compuesto de Fórmula I o de una mezcla fungicida que comprende por lo menos un compuesto de Fórmula I mezclado con otros fungicidas, como se describió más arriba, para controlar o
5 prevenir la infestación de plantas, de cultivos para uso alimentario cosechados o de materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenicos, preferiblemente organismos fúngicos.

Otro aspecto de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir la infestación de cultivos o de materiales inertes por parte
10 microorganismos u organismos fitopatógenicos o destructivos potencialmente perjudiciales para el hombre, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de Fórmula I como ingrediente activo en las plantas, en partes de las plantas o en los terrenos que ocupan las mismas, o en cualquier parte de los materiales inertes. Controlar o prevenir significa reducir la
15 infestación de cultivos o de materiales inertes por parte de microorganismos u organismos fitopatógenicos o destructivos potencialmente perjudiciales para el hombre, especialmente organismos fúngicos, a tal grado que se confirma una mejora.

Un método preferido para controlar o prevenir la infestación de cultivos por
20 parte de microorganismos fitopatógenicos, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de Fórmula I, o una composición agroquímica que contiene por lo menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la proporción de aplicación dependerán del riesgo de infestación que plantee el patógeno correspondiente.
25 Sin embargo, los compuestos de Fórmula I también pueden ingresar en la planta a través de las raíces desde el suelo (acción sistémica) empapando el lugar que ocupa la planta con una formulación líquida, o aplicando los compuestos en forma

sólida en el suelo, p. ej. en gránulos (aplicación en el terreno). En cultivos de arroz en agua se pueden aplicar los gránulos en el arrozal inundado. Los compuestos de Fórmula I también pueden aplicarse a las semillas (recubrimiento) impregnando las semillas o tubérculos con una formulación líquida del fungicida o bien recubriéndolas con una formulación sólida.

Una formulación [es decir, una composición que contiene el compuesto de Fórmula I] y, si se quiere, un adyuvante sólido o líquido o monómeros para encapsular el compuesto de Fórmula I, se prepara de las formas ya conocidas, generalmente mezclando íntimamente y/o moliendo el compuesto con
10 esparcidores, por ejemplo solventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos tensioactivos (surfactantes).

Las formulaciones agroquímicas normalmente contienen desde 0,1 a 99% en peso, preferiblemente desde 0,1 a 95% en peso, del compuesto de Fórmula I, 99,9 a 1% en peso, preferiblemente 99,8 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o
15 líquido, y desde 0 a 25% en peso, preferiblemente desde 0,1 a 25% en peso, de un surfactante.

La proporción de aplicación ideal va normalmente desde 5g a 2kg de ingrediente activo (i.a.) por hectárea (ha), preferiblemente desde 10g a 1kg i.a./ha, más preferiblemente desde 20g a 600g i.a./ha. Cuando se emplea para empapar
20 semillas, las dosis convenientes van desde 10mg a 1g de sustancia activa por kg de semillas.

A pesar de que es preferible formular los productos comerciales como concentrados, el consumidor final usará normalmente formulaciones diluidas.

Los siguientes ejemplos no limitativos ilustran con mayor detalle la
25 invención antes descrita.

Ejemplo 1: Este ejemplo ilustra la preparación de 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.198)

a) Preparación de 2-bromo-1-tiofen-2-il-propan-1-ona

Se agregó bromo (3,7 ml) a la mezcla de 1-(2-tienil)-1-propano (10 g), 0,1
5 ml de ácido bromhídrico (solución 48 %) y 80 ml de ácido acético a 0°C bajo
atmósfera de nitrógeno. A continuación, la mezcla se agitó durante 2,5 h a
temperatura ambiente. La mezcla de reacción se evaporó bajo presión reducida.
Se obtuvo 2-bromo-1-tiofen-2-il-propan-1-ona en forma de un aceite marrón, que
se usó en el próximo paso sin purificación adicional.

10 b) Preparación de 5-hidroxi-5-metil-4-tiofen-2-il-3-(2,4,6-trifluorfenil)-5H-furan-2-ona (Compuesto No. II.h.040)

Se agitó una mezcla de 2-bromo-1-tiofen-2-il-propan-1-ona (2,1 g), ácido
2,4,6-trifluorfenilacético (2,0 g), 1,5 ml de trietilamina y 30 ml de acetonitrilo
durante 16 h a temperatura ambiente. A continuación se agregaron 30 ml de
15 acetonitrilo y 3,4 ml de 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU) con enfriamiento
y se continuó agitando durante otras 2,5 h. Entonces se insufló aire a través de la
mezcla de reacción durante 3 h. Se agregó solución acuosa de cloruro de amonio
y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó
con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y con salmuera, se
20 secó sobre sulfato de sodio y se evaporó bajo presión reducida. El resto se
purificó por cromatografía sobre gel de sílice, usando una mezcla de
heptano/acetato de etilo 2:1 como eluyente para obtener 5-hidroxi-5-metil-4-tiofen-
2-il-3-(2,4,6-trifluorfenil)-5H-furan-2-ona (Compuesto No. II.h.040) en forma de
cristales incoloros, p.f. 134–136 °C.

25 c) Preparación de 6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-2H-piridazin-3-ona (Compuesto No. I.h.196)

Se calentó una mezcla de 5-hidroxi-5-metil-4-tiofen-2-il-3-(2,4,6-trifluorfenil)-5H-furan-2-ona (1,9 g), 0,3 ml de hidrato de hidracina y 30 ml de 1-butanol durante 16 h hasta 120 °C. A continuación, la mezcla se enfrió hasta 0 °C. El sólido así obtenido se filtró y se lavó con hexano para obtener 6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-2H-piridazin-3-ona (Compuesto No. I.h.196) en forma de cristales incoloros, p.f. 249-251 °C.

d) Se mezclaron 6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-2H-piridazin-3-ona (Compuesto No. I.h.196, 1,2 g) y 6,5 ml de oxiclورو de fósforo y se calentó a 110 °C durante 1 h. Después de enfriar la mezcla de reacción se evaporó bajo presión reducida. El resto se tomó con acetato de etilo y agua y se separaron las fases. La capa orgánica se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó bajo presión reducida. El residuo se recrystalizó a partir de hexano para obtener 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.198) en forma de cristales beige, p.f. 90-92 °C.

Ejemplo 2: Este ejemplo ilustra la preparación de 3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.199) y 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-piridazina (Compuesto No. I.h.254)

Se calentó una mezcla de 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.198, 0,7 g), metóxido de sodio (solución 30% en metanol, 0,4 g) y 10 ml de metanol durante 16 h a 60 °C. A continuación la mezcla de reacción se enfrió, se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó bajo presión reducida. El resto se purificó por cromatografía sobre gel de sílice, usando una mezcla de heptano/acetato de etilo 9:1 como eluyente para obtener 3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto I.h.199), p.f. 124-125 °C y 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-piridazina (Compuesto I.h.254), p.f. 130-133 °C.

Ejemplo 3: Este ejemplo ilustra la preparación de 3-fluoro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.197)

Se mezclaron 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.198, 0,25 g), fluoruro de potasio (0,1 g) y 5 ml de dimetil sulfóxido y se calentó a 140°C durante 48 h. A continuación la mezcla de reacción se enfrió, se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó bajo presión reducida. El resto se purificó por cromatografía sobre gel de sílice, usando una mezcla de hexano/acetato de etilo 9:1 como eluyente para
10 obtener 3-fluoro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Compuesto No. I.h. 197) en forma de cristales beige (a partir de dietil éter/hexano), p.f. 71-74°C.

Ejemplo 4: Este ejemplo ilustra la preparación de 3,6-dimetil-4-tiofen-2-il-5-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto No. I.h. 200)

Se mezclaron 1,2 ml de una solución 3 M de bromuro de metilmagnesio en dietil éter con 5 ml de tetrahidrofurano y se agregó lentamente a -70°C a una solución de 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina (Compuesto No.I.h. 198, 0,26 g) y acetilacetato de hierro(III) (0,03 g) en 20 ml de tetrahidrofurano y 1,5 ml de 1-metil-2-pirrolidinona (NMP). Después de 0,5 h a -
15 70°C, la mezcla se agitó durante otras 2,5 h a temperatura ambiente. La reacción se apagó con HCl diluido y la fase acuosa se extrajo con terc-butil metil éter. La capa orgánica combinada se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó bajo presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice, usando una mezcla de hexano/acetato de etilo 3:1 como eluyente para obtener
20 3,6-diimetil-4-tiofen-2-il-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (Compuesto No. I.h.200) en forma de cristales beige, p.f. 100-102°C.

Las siguientes Tablas 1 y 2 ilustran ejemplos de compuestos particulares de Fórmula I y Fórmula II de acuerdo con la invención.

Tabla 1: Compuestos particulares de Fórmula I de acuerdo con la invención

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
001	CH ₃	2-fluorfenilo	OH
002	CH ₃	2-fluorfenilo	F
003	CH ₃	2-fluorfenilo	Cl
004	CH ₃	2-fluorfenilo	OCH ₃
005	CH ₃	2-fluorfenilo	CH ₃
006	CH ₃	2-clorofenilo	OH
007	CH ₃	2-clorofenilo	F
008	CH ₃	2-clorofenilo	Cl
009	CH ₃	2-clorofenilo	OCH ₃
010	CH ₃	2-clorofenilo	CH ₃
011	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	OH
012	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	F
013	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	Cl
014	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	OCH ₃
015	CH ₃	2-trifluorometilfenilo	CH ₃
016	CH ₃	2-metilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
017	CH ₃	2-metilfenilo	F
018	CH ₃	2-metilfenilo	Cl
019	CH ₃	2-metilfenilo	OCH ₃
020	CH ₃	2-metilfenilo	CH ₃
021	CH ₃	2,3-difluorfenilo	OH
022	CH ₃	2,3-difluorfenilo	F
023	CH ₃	2,3-difluorfenilo	Cl
024	CH ₃	2,3-difluorfenilo	OCH ₃
025	CH ₃	2,3-difluorfenilo	CH ₃
026	CH ₃	2,4-difluorfenilo	OH
027	CH ₃	2,4-difluorfenilo	F
028	CH ₃	2,4-difluorfenilo	Cl
029	CH ₃	2,4-difluorfenilo	OCH ₃
030	CH ₃	2,4-difluorfenilo	CH ₃
031	CH ₃	2,5-difluorfenilo	OH
032	CH ₃	2,5-difluorfenilo	F
033	CH ₃	2,5-difluorfenilo	Cl
034	CH ₃	2,5-difluorfenilo	OCH ₃
035	CH ₃	2,5-difluorfenilo	CH ₃
036	CH ₃	2,6-difluorfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
037	CH ₃	2,6-difluorfenilo	F
038	CH ₃	2,6-difluorfenilo	Cl
039	CH ₃	2,6-difluorfenilo	OCH ₃
040	CH ₃	2,6-difluorfenilo	CH ₃
041	CH ₃	2,3-diclorofenilo	OH
042	CH ₃	2,3-diclorofenilo	F
043	CH ₃	2,3-diclorofenilo	Cl
044	CH ₃	2,3-diclorofenilo	OCH ₃
045	CH ₃	2,3-diclorofenilo	CH ₃
046	CH ₃	2,4-diclorofenilo	OH
047	CH ₃	2,4-diclorofenilo	F
048	CH ₃	2,4-diclorofenilo	Cl
049	CH ₃	2,4-diclorofenilo	OCH ₃
050	CH ₃	2,4-diclorofenilo	CH ₃
051	CH ₃	2,5-diclorofenilo	OH
052	CH ₃	2,5-diclorofenilo	F
053	CH ₃	2,5-diclorofenilo	Cl
054	CH ₃	2,5-diclorofenilo	OCH ₃
055	CH ₃	2,5-diclorofenilo	CH ₃
056	CH ₃	2,6-diclorofenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
057	CH ₃	2,6-diclorofenilo	F
058	CH ₃	2,6-diclorofenilo	Cl
059	CH ₃	2,6-diclorofenilo	OCH ₃
060	CH ₃	2,6-diclorofenilo	CH ₃
061	CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	OH
062	CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	F
063	CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	Cl
064	CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	OCH ₃
065	CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	CH ₃
066	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	OH
067	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	F
068	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	Cl
069	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	OCH ₃
070	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	CH ₃
071	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	OH
072	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	F
073	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	Cl
074	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	OCH ₃
075	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	CH ₃
076	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
077	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	F
078	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	Cl
079	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	OCH ₃
080	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	CH ₃
081	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	OH
082	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	F
083	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	Cl
084	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	OCH ₃
085	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	CH ₃
086	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	OH
087	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	F
088	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	Cl
089	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	OCH ₃
090	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	CH ₃
091	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	OH
092	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	F
093	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	Cl
094	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	OCH ₃
095	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	CH ₃
096	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
097	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	F
098	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	Cl
099	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	OCH ₃
100	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	CH ₃
101	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	OH
102	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	F
103	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	Cl
104	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	OCH ₃
105	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	CH ₃
106	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	OH
107	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	F
108	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	Cl
109	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	OCH ₃
110	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	CH ₃
111	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	OH
112	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	F
113	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	Cl
114	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	OCH ₃
115	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	CH ₃
116	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
117	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	F
118	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	Cl
119	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	OCH ₃
120	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	CH ₃
121	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	OH
122	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	F
123	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	Cl
124	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	OCH ₃
125	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	CH ₃
126	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	OH
127	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	F
128	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	Cl
129	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	OCH ₃
130	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	CH ₃
131	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	OH
132	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	F
133	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	Cl
134	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	OCH ₃
135	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	CH ₃
136	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
137	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	F
138	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	Cl
139	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	OCH ₃
140	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	CH ₃
141	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	OH
142	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	F
143	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	Cl
144	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	OCH ₃
145	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	CH ₃
146	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	OH
147	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	F
148	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	Cl
149	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	OCH ₃
150	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	CH ₃
151	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	OH
152	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	F
153	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	Cl
154	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	OCH ₃
155	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	CH ₃
156	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
157	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	F
158	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	Cl
159	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	OCH ₃
160	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	CH ₃
161	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	OH
162	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	F
163	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	Cl
164	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	OCH ₃
165	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	CH ₃
166	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	OH
167	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	F
168	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	Cl
169	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	OCH ₃
170	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	CH ₃
171	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	OH
172	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	F
173	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	Cl
174	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	OCH ₃
175	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	CH ₃
176	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	OH

///

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
177	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	F
178	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	Cl
179	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	OCH ₃
180	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	CH ₃
181	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	OH
182	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	F
183	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	Cl
184	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	OCH ₃
185	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	CH ₃
186	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	OH
187	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	F
188	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	Cl
189	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	OCH ₃
190	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	CH ₃
191	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	OH
192	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	F
193	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	Cl
194	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	OCH ₃
195	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	CH ₃
196	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
197	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	F
198	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	Cl
199	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	OCH ₃
200	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	CH ₃
201	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	OH
202	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	F
203	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	Cl
204	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	OCH ₃
205	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	CH ₃
206	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	OH
207	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	F
208	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	Cl
209	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	OCH ₃
210	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	CH ₃
211	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	OH
212	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	F
213	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	Cl
214	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	OCH ₃
215	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	CH ₃
216	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
217	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	F
218	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	Cl
219	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	OCH ₃
220	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	CH ₃
221	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	OH
222	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	F
223	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	Cl
224	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	OCH ₃
225	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	CH ₃
226	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	OH
227	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	F
228	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	Cl
229	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	OCH ₃
230	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	CH ₃
231	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	OH
232	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	F
233	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	Cl
234	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	OCH ₃
235	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
236	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
237	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	F
238	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	Cl
239	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	OCH ₃
240	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	CH ₃
241	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	OH
242	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	F
243	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	Cl
244	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	OCH ₃
245	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	CH ₃
246	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	OH
247	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	F
248	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	Cl
249	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	OCH ₃
250	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	CH ₃
251	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	OH
252	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	F
253	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	Cl
254	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	OCH ₃
255	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	CH ₃
256	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
257	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	F
258	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	Cl
259	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	OCH ₃
260	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	CH ₃
261	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	OH
262	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	F
263	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	Cl
264	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	OCH ₃
265	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	CH ₃
266	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	OH
267	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	F
268	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	Cl
269	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	OCH ₃
270	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	CH ₃
271	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	OH
272	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	F
273	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	Cl
274	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	OCH ₃
275	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	CH ₃
276	CH ₃	pentafluorfenilo	OH

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
277	CH ₃	pentafluorfenilo	F
278	CH ₃	pentafluorfenilo	Cl
279	CH ₃	pentafluorfenilo	OCH ₃
280	CH ₃	pentafluorfenilo	CH ₃
281	CH ₂ CH ₃	2-fluorfenilo	OH
282	CH ₂ CH ₃	2-fluorfenilo	Cl
283	CH ₂ CH ₃	2-clorofenilo	OH
284	CH ₂ CH ₃	2-clorofenilo	Cl
285	CH ₂ CH ₃	2-trifluorometilfenilo	OH
286	CH ₂ CH ₃	2-trifluorometilfenilo	Cl
287	CH ₂ CH ₃	2-metilfenilo	OH
288	CH ₂ CH ₃	2-metilfenilo	Cl
289	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorfenilo	OH
290	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorfenilo	Cl
291	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorfenilo	OH
292	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorfenilo	Cl
293	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorfenilo	OH
294	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorfenilo	Cl
295	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorfenilo	OH
296	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorfenilo	Cl

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
297	CH ₂ CH ₃	2,3-diclorofenilo	OH
298	CH ₂ CH ₃	2,3-diclorofenilo	Cl
299	CH ₂ CH ₃	2,4-diclorofenilo	OH
300	CH ₂ CH ₃	2,4-diclorofenilo	Cl
301	CH ₂ CH ₃	2,5-diclorofenilo	OH
302	CH ₂ CH ₃	2,5-diclorofenilo	Cl
303	CH ₂ CH ₃	2,6-diclorofenilo	OH
304	CH ₂ CH ₃	2,6-diclorofenilo	Cl
305	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	OH
306	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo	Cl
307	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	OH
308	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo	Cl
309	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	OH
310	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo	Cl
311	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	OH
312	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo	Cl
313	CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	OH
314	CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo	Cl
315	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	OH
316	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo	Cl

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
317	CH ₂ CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	OH
318	CH ₂ CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo	Cl
319	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	OH
320	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo	Cl
321	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	OH
322	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo	Cl
323	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	OH
324	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo	Cl
325	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	OH
326	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo	Cl
327	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	OH
328	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo	Cl
329	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	OH
330	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo	Cl
331	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	OH
332	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo	Cl
333	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	OH
334	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo	Cl
335	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	OH
336	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo	Cl

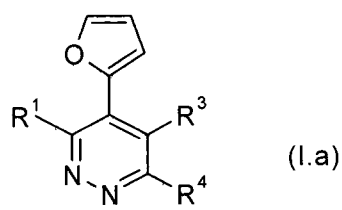
Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
337	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	OH
338	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo	Cl
339	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	OH
340	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo	Cl
341	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	OH
342	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	Cl
343	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	OH
344	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo	Cl
345	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	OH
346	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo	Cl
347	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	OH
348	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo	Cl
349	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	OH
350	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo	Cl
351	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	OH
352	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo	Cl
353	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	OH
354	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo	Cl
355	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	OH
356	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	Cl

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
357	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	OH
358	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo	Cl
359	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	OH
360	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo	Cl
361	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	OH
362	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo	Cl
363	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	OH
364	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo	Cl
365	CH ₂ CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	OH
366	CH ₂ CH ₃	2,4,6-triclorofenilo	Cl
367	CH ₂ CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	OH
368	CH ₂ CH ₃	2,3,6-triclorofenilo	Cl
369	CH ₂ CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	OH
370	CH ₂ CH ₃	2,3,4-triclorofenilo	Cl
371	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	OH
372	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	Cl
373	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	OH
374	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo	Cl
375	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	OH
376	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo	Cl

Comp. No.	R ¹	R ³	R ⁴
377	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	OH
378	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo	Cl
379	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	OH
380	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo	Cl
381	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	OH
382	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo	Cl
383	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	OH
384	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo	Cl
385	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	OH
386	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo	Cl
387	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	OH
388	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo	Cl
389	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	OH
390	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo	Cl
391	CH ₂ CH ₃	pentafluorfenilo	OH
392	CH ₂ CH ₃	pentafluorfenilo	Cl

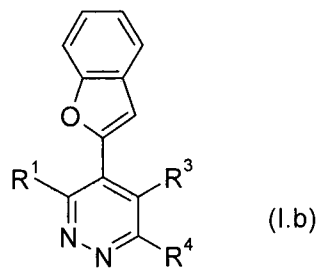
donde

a) 392 compuestos de Fórmula (I.a):



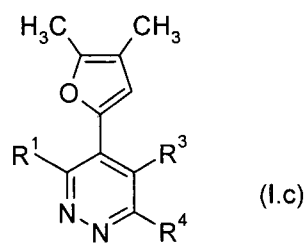
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

b) 392 compuestos de Fórmula (I.b):



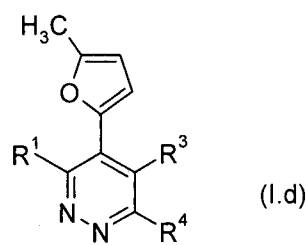
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

c) 392 compuestos de Fórmula (I.c):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

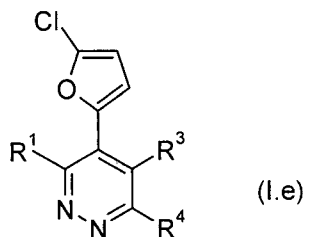
d) 392 compuestos de Fórmula (I.d):



10

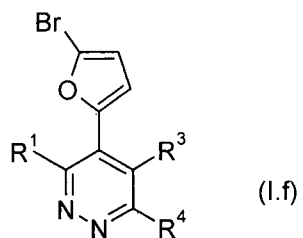
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

e) 392 compuestos de Fórmula (I.e):



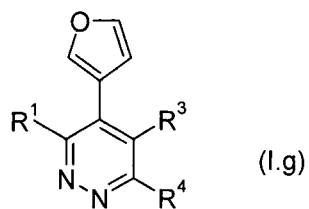
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

f) 392 compuestos de Fórmula (I.f):



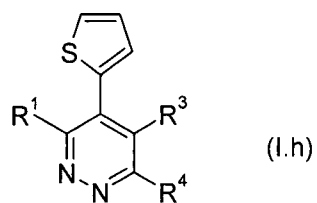
5 donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

g) 392 compuestos de Fórmula (I.g):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

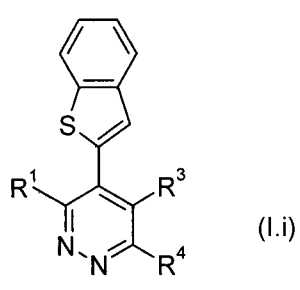
h) 392 compuestos de Fórmula (I.h):



10

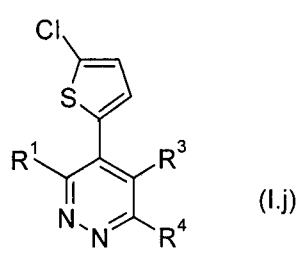
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

i) 392 compuestos de Fórmula (I.i):



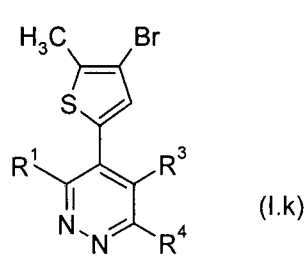
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

j) 392 compuestos de Fórmula (I.j):



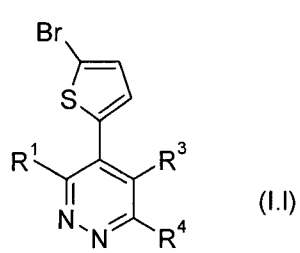
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

k) 392 compuestos de Fórmula (I.k):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

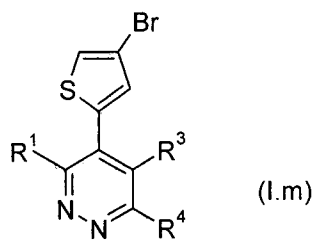
l) 392 compuestos de Fórmula (I.l):



10

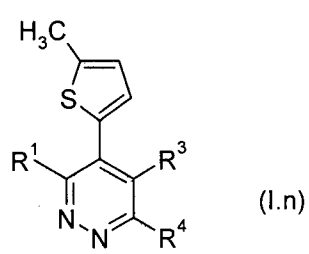
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

m) 392 compuestos de Fórmula (I.m):



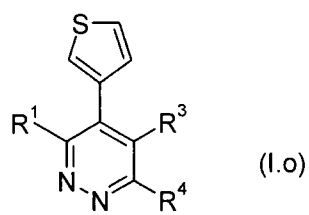
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

n) 392 compuestos de Fórmula (I.n):



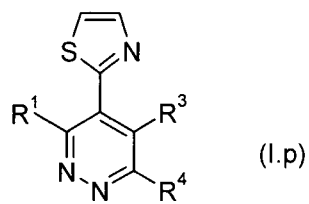
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

o) 392 compuestos de Fórmula (I.o):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

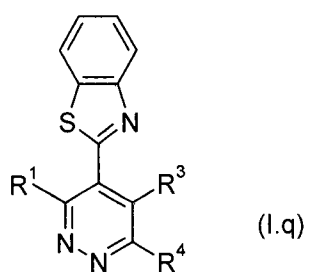
p) 392 compuestos de Fórmula (I.p):



10

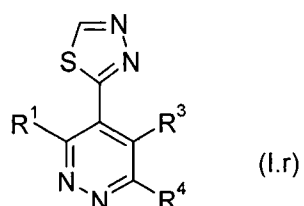
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

q) 392 compuestos de Fórmula (I.q):



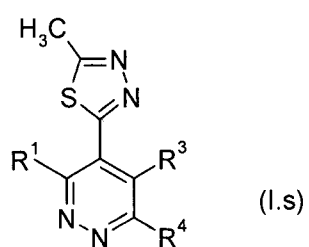
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

r) 392 compuestos de Fórmula (I.r):



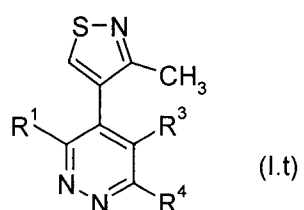
5 donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

s) 392 compuestos de Fórmula (I.s):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

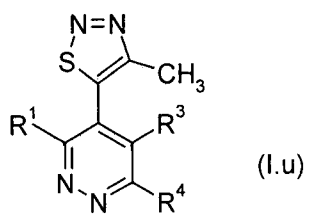
t) 392 compuestos de Fórmula (I.t):



10

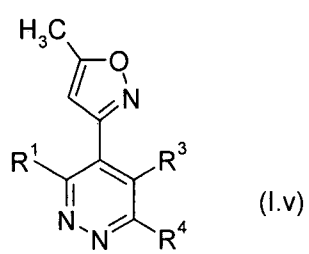
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

u) 392 compuestos de Fórmula (I.u):



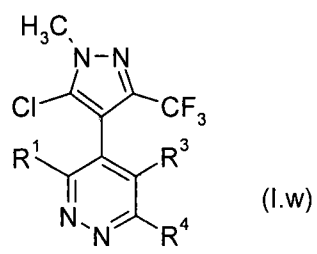
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

v) 392 compuestos de Fórmula (I.v):



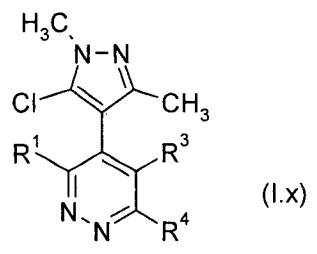
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

w) 392 compuestos de Fórmula (I.w):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

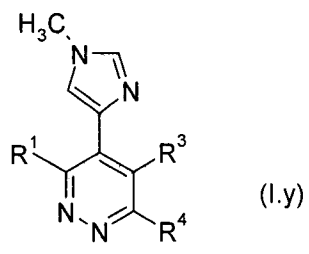
x) 392 compuestos de Fórmula (I.x):



10

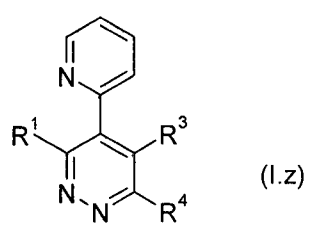
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

y) 392 compuestos de Fórmula (I.y):



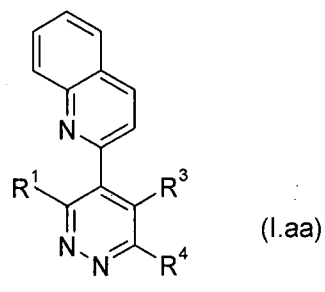
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

z) 392 compuestos de Fórmula (I.z):



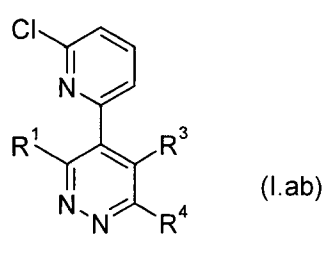
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

aa) 392 compuestos de Fórmula (I.aa):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

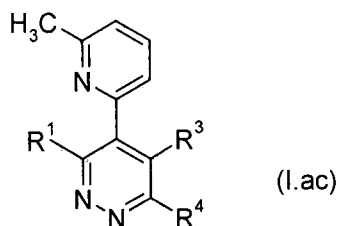
ab) 392 compuestos de Fórmula (I.ab):



10

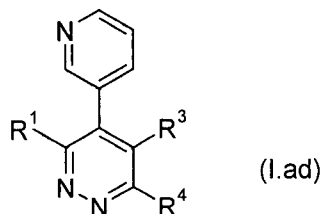
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ac) 392 compuestos de Fórmula (I.ac):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

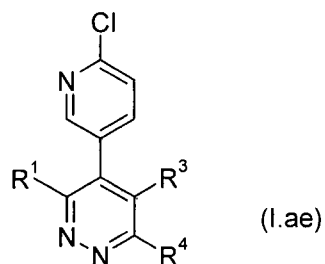
ad) 392 compuestos de Fórmula (I.ad):



5

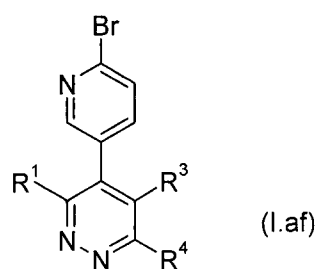
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

ae) 392 compuestos de Fórmula (I.ae):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

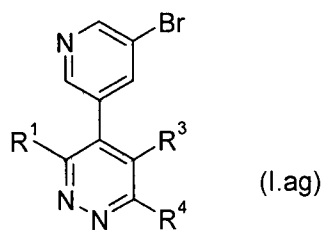
af) 392 compuestos de Fórmula (I.af):



10

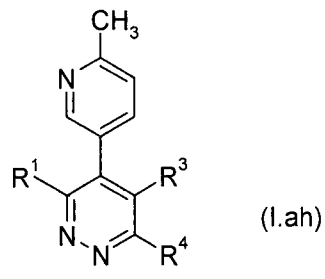
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

ag) 392 compuestos de Fórmula (I.ag):



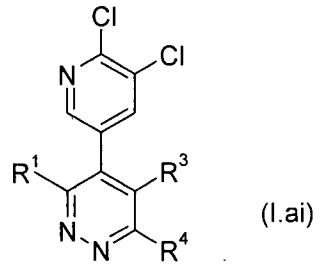
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ah) 392 compuestos de Fórmula (I.ah):



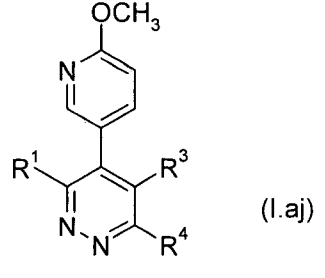
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ai) 392 compuestos de Fórmula (I.ai):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

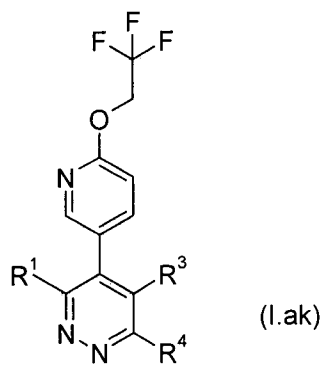
aj) 392 compuestos de Fórmula (I.aj):



10

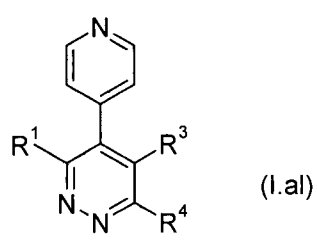
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ak) 392 compuestos de Fórmula (I.ak):



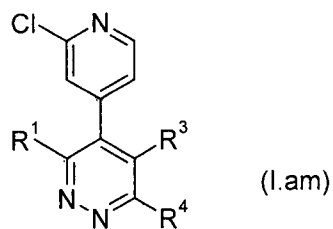
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

al) 392 compuestos de Fórmula (I.al):



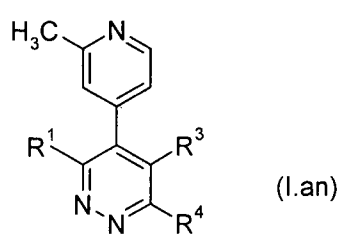
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

am) 392 compuestos de Fórmula (I.am):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

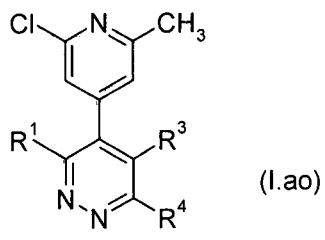
an) 392 compuestos de Fórmula (I.an):



10

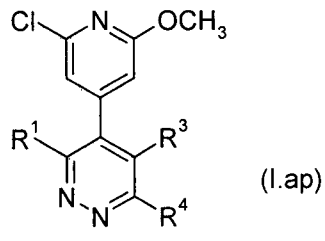
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ao) 392 compuestos de Fórmula (I.ao):



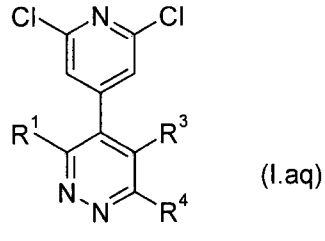
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

ap) 392 compuestos de Fórmula (I.ap):



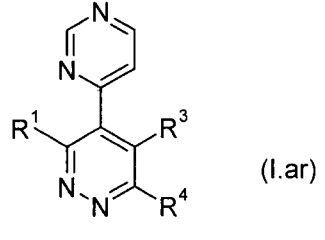
5 donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

aq) 392 compuestos de Fórmula (I.aq):



donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

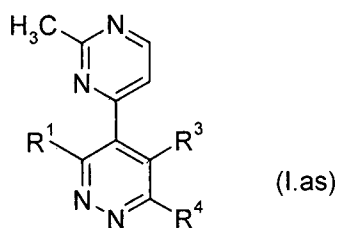
ar) 392 compuestos de Fórmula (I.ar):



10

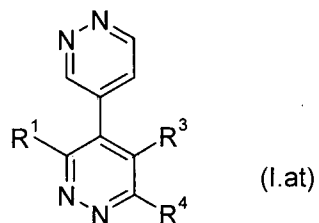
donde R¹, R³ y R⁴ son como se define en la Tabla 1.

as) 392 compuestos de Fórmula (I.as):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

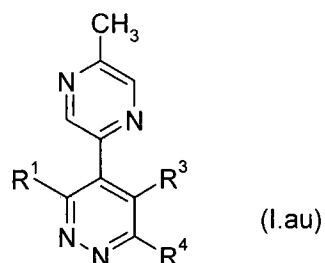
at) 392 compuestos de Fórmula (I.at):



5

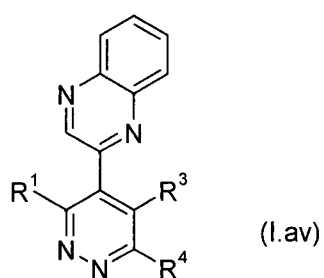
donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

au) 392 compuestos de Fórmula (I.au):



donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

av) 392 compuestos de Fórmula (I.av):



10

donde R^1 , R^3 y R^4 son como se define en la Tabla 1.

aw) 392 compuestos de Fórmula (I.aw):

Comp. No.	R ¹	R ³
014	CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo
015	CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo
016	CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo
017	CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo
018	CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo
019	CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo
020	CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo
021	CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo
022	CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo
023	CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo
024	CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo
025	CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo
026	CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo
027	CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo
028	CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo
029	CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo
030	CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo
031	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo
032	CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo
033	CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo
034	CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo

Comp. No.	R ¹	R ³
035	CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo
036	CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo
037	CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo
038	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo
039	CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo
040	CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo
041	CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo
042	CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo
043	CH ₃	2,4,6-triclorofenilo
044	CH ₃	2,3,6-triclorofenilo
045	CH ₃	2,3,4-triclorofenilo
046	CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
047	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo
048	CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo
049	CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo
050	CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo
051	CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo
052	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo
053	CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo
054	CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo
055	CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo

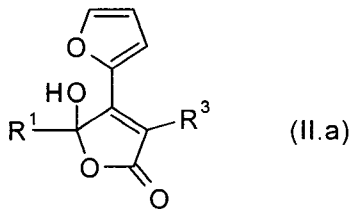
Comp. No.	R ¹	R ³
056	CH ₃	pentafluorfenilo
057	CH ₂ CH ₃	2-fluorfenilo
058	CH ₂ CH ₃	2-clorofenilo
059	CH ₂ CH ₃	2-trifluorometilfenilo
060	CH ₂ CH ₃	2-metilfenilo
061	CH ₂ CH ₃	2,3-difluorfenilo
062	CH ₂ CH ₃	2,4-difluorfenilo
063	CH ₂ CH ₃	2,5-difluorfenilo
064	CH ₂ CH ₃	2,6-difluorfenilo
065	CH ₂ CH ₃	2,3-diclorofenilo
066	CH ₂ CH ₃	2,4-diclorofenilo
067	CH ₂ CH ₃	2,5-diclorofenilo
068	CH ₂ CH ₃	2,6-diclorofenilo
069	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-fluorfenilo
070	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-fluorfenilo
071	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-fluorfenilo
072	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-fluorfenilo
073	CH ₂ CH ₃	3-cloro-2-fluorfenilo
074	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-fluorfenilo
075	CH ₂ CH ₃	5-cloro-2-fluorfenilo
076	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-trifluorometilfenilo

Comp. No.	R ¹	R ³
077	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-trifluorometilfenilo
078	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo
079	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-trifluorometilfenilo
080	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-trifluorometilfenilo
081	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-trifluorometilfenilo
082	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-trifluorometilfenilo
083	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-trifluorometilfenilo
084	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-trifluorometilfenilo
085	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-trifluorometilfenilo
086	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-3-metilfenilo
087	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo
088	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-5-metilfenilo
089	CH ₂ CH ₃	2-fluoro-6-metilfenilo
090	CH ₂ CH ₃	2-cloro-3-metilfenilo
091	CH ₂ CH ₃	2-cloro-4-metilfenilo
092	CH ₂ CH ₃	2-cloro-5-metilfenilo
093	CH ₂ CH ₃	2-cloro-6-metilfenilo
094	CH ₂ CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo
095	CH ₂ CH ₃	4-cloro-2-metilfenilo
096	CH ₂ CH ₃	2,4,6-trifluorfenilo
097	CH ₂ CH ₃	2,3,6-trifluorfenilo

Comp. No.	R ¹	R ³
098	CH ₂ CH ₃	2,3,4-trifluorfenilo
099	CH ₂ CH ₃	2,4,6-triclorofenilo
100	CH ₂ CH ₃	2,3,6-triclorofenilo
101	CH ₂ CH ₃	2,3,4-triclorofenilo
102	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metoxifenilo
103	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo
104	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo
105	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-cianofenilo
106	CH ₂ CH ₃	2,6-difluoro-4-metilfenilo
107	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metoxifenilo
108	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometoxifenilo
109	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo
110	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-cianofenilo
111	CH ₂ CH ₃	2,6-dicloro-4-metilfenilo
112	CH ₂ CH ₃	pentafluorfenilo

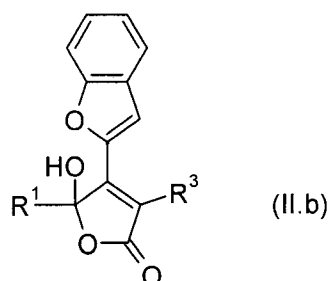
donde

a) 112 compuestos de Fórmula (II.a):



donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

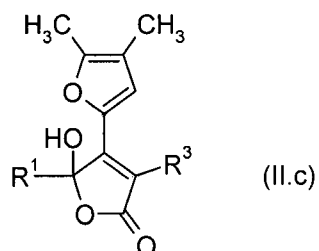
b) 112 compuestos de Fórmula (II.b):



donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

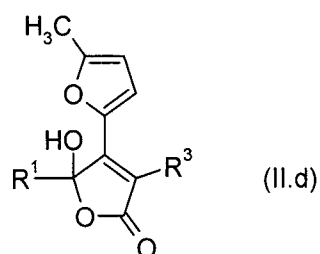
5

c) 112 compuestos de Fórmula (II.c):



donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

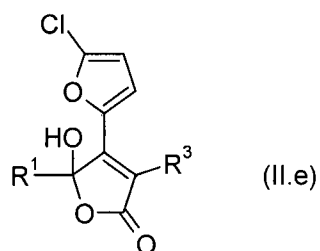
d) 112 compuestos de Fórmula (II.d):



10

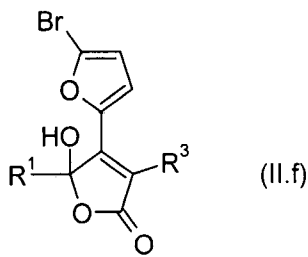
donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

e) 112 compuestos de Fórmula (II.e):



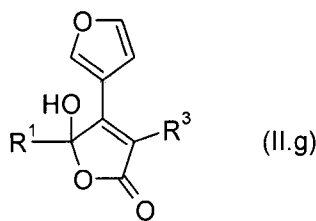
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

f) 112 compuestos de Fórmula (II.f):



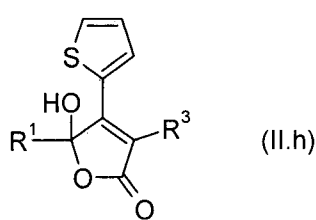
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

5 g) 112 compuestos de Fórmula (II.g):



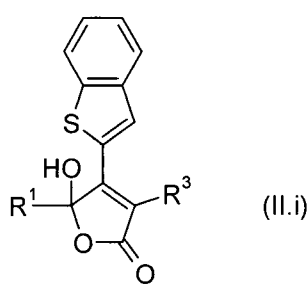
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

h) 112 compuestos de Fórmula (II.h):



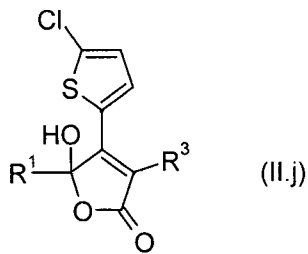
10 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

i) 112 compuestos de Fórmula (II.i):



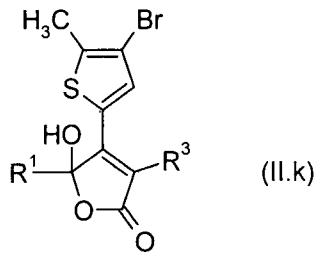
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

j) 112 compuestos de Fórmula (II.j):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

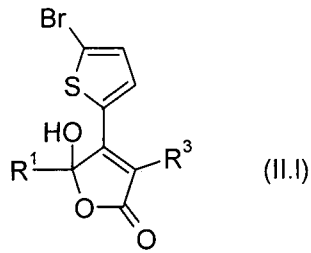
k) 112 compuestos de Fórmula (II.k):



5

donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

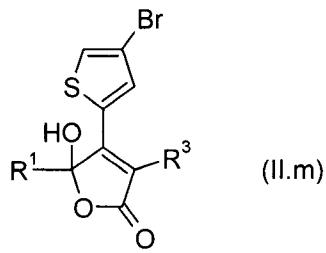
l) 112 compuestos de Fórmula (II.l):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

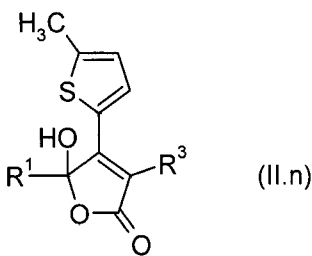
10

m) 112 compuestos de Fórmula (II.m):



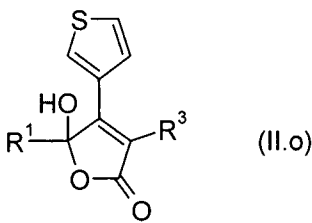
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

n) 112 compuestos de Fórmula (II.n):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

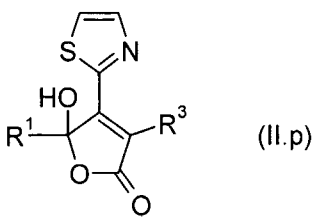
o) 112 compuestos de Fórmula (II.o):



5

donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

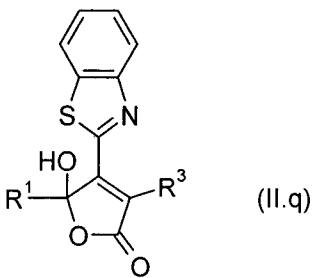
p) 112 compuestos de Fórmula (II.p):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

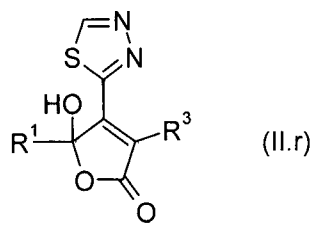
10

q) 112 compuestos de Fórmula (II.q):



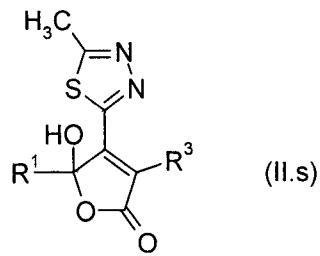
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

r) 112 compuestos de Fórmula (II.r):



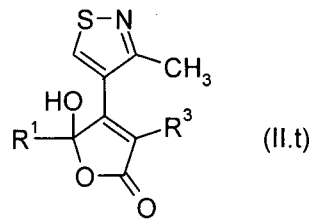
donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

s) 112 compuestos de Fórmula (II.s):



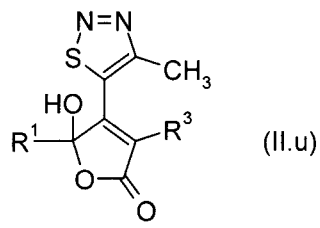
5 donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

t) 112 compuestos de Fórmula (II.t):



donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

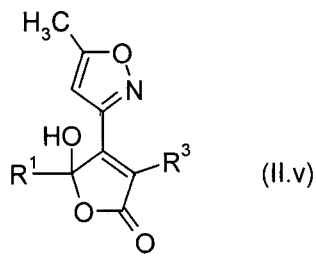
u) 112 compuestos de Fórmula (II.u):



10

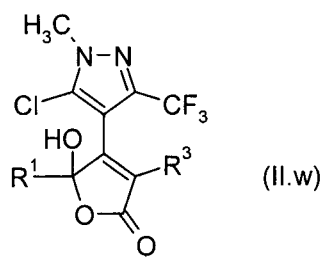
donde R^1 y R^3 son como se define en la Tabla 2.

v) 112 compuestos de Fórmula (II.v):



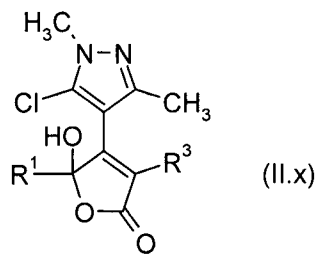
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

w) 112 compuestos de Fórmula (II.w):



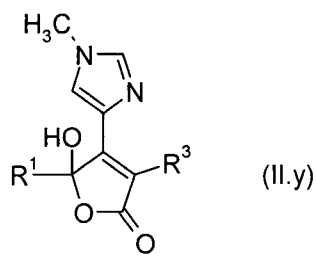
5 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

x) 112 compuestos de Fórmula (II.x):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

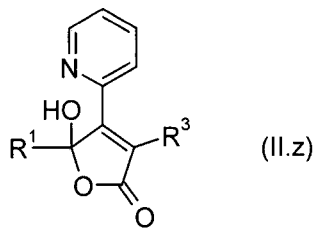
y) 112 compuestos de Fórmula (II.y):



10

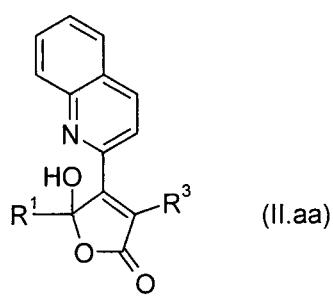
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

z) 112 compuestos de Fórmula (II.z):



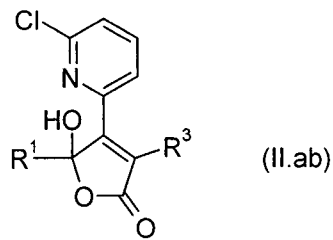
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

aa) 112 compuestos de Fórmula (II.aa):



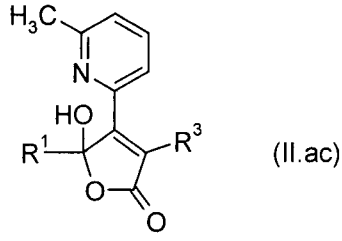
5 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ab) 112 compuestos de Fórmula (II.ab):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

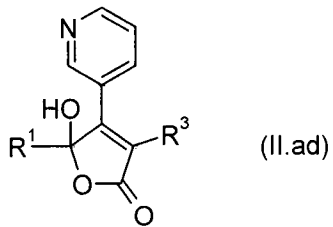
ac) 112 compuestos de Fórmula (II.ac):



10

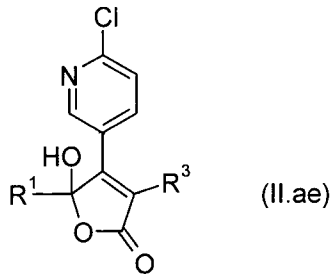
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ad) 112 compuestos de Fórmula (II.ad):



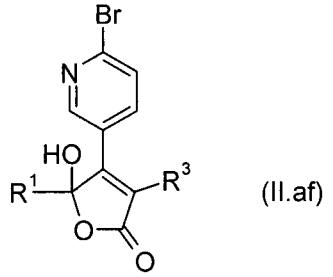
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ae) 112 compuestos de Fórmula (II.ae):



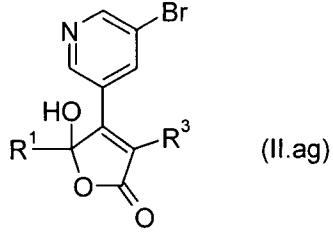
5 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

af) 112 compuestos de Fórmula (II.af):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

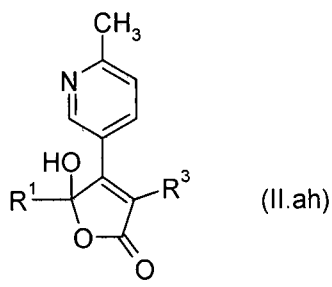
ag) 112 compuestos de Fórmula (II.ag):



10

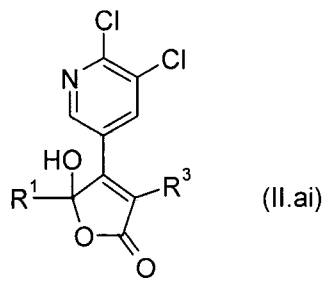
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ah) 112 compuestos de Fórmula (II.ah):



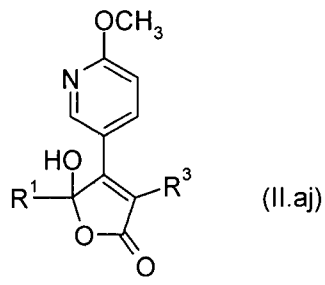
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ai) 112 compuestos de Fórmula (II.ai):



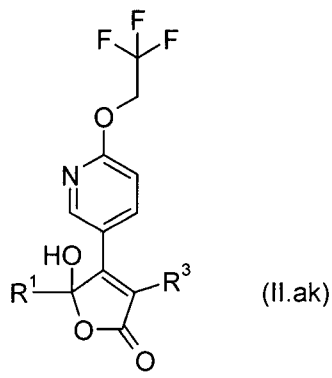
5 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

aj) 112 compuestos de Fórmula (II.aj):



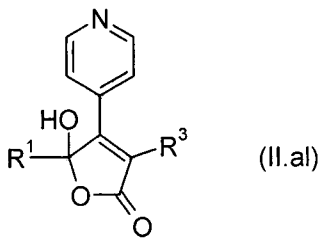
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ak) 112 compuestos de Fórmula (II.ak):



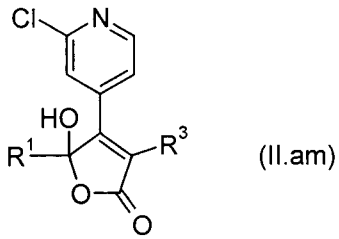
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

al) 112 compuestos de Fórmula (II.al):



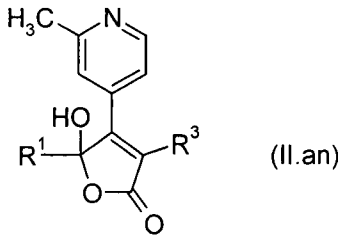
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

5 am) 112 compuestos de Fórmula (II.am):



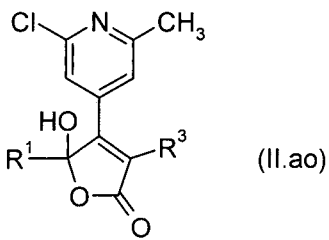
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

an) 112 compuestos de Fórmula (II.an):



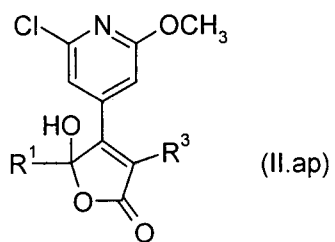
10 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ao) 112 compuestos de Fórmula (II.ao):



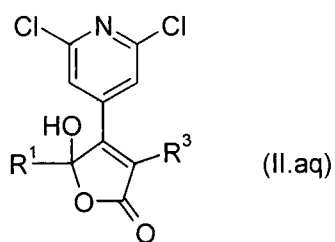
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ap) 112 compuestos de Fórmula (II.ap):



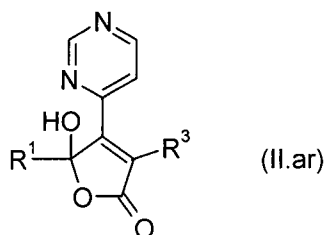
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

aq) 112 compuestos de Fórmula (II.aq):



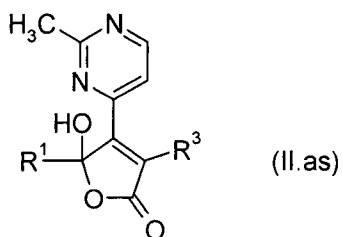
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

ar) 112 compuestos de Fórmula (II.ar):



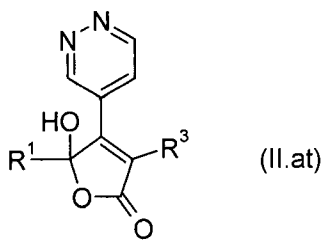
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

as) 112 compuestos de Fórmula (II.as):



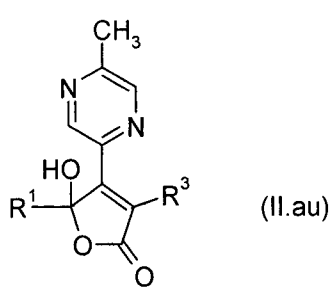
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

at) 112 compuestos de Fórmula (II.at):



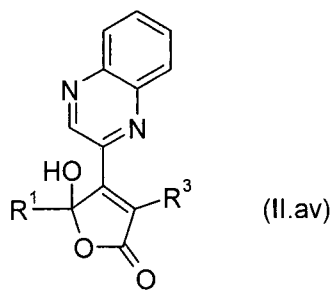
donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

au) 112 compuestos de Fórmula (II.au):



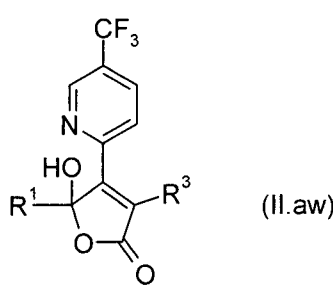
5 donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

av) 112 compuestos de Fórmula (II.av):



donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

aw) 112 compuestos de Fórmula (II.aw):



10

donde R¹ y R³ son como se define en la Tabla 2.

En toda esta exposición, las temperaturas se expresan en grados Celsius y "%" es porcentaje en peso, a menos que las correspondientes concentraciones se indiquen en otras unidades.

La Tabla 3 muestra el punto de fusión seleccionado (a menos que se indique lo contrario, no se intenta enumerar todos los datos característicos de todos los casos) para los compuestos de las Tablas 1 y 2.

Tabla 3: Punto de fusión para los compuestos de las Tablas 1 y 2

Compuesto No.	P.f. (°C)
I.a.196	230 - 232
I.a.197	84 - 86
I.a.198	106 - 107
I.a.199	109 - 111
I.a.200	103 - 105
I.a.254	116 - 118
I.b.199	147 - 148
I.f.196	194 - 195
I.f.198	59 - 60
I.h.196	249 - 251
I.h.197	71 - 74
I.h.198	90 - 92
I.h.199	124 - 125

Compuesto No.	P.f. (°C)
I.h.200	100 - 102
I.h.254	130 - 133
I.j.197	91 - 92
I.j.198	102 - 103
I.j.199	111 - 112
I.j.200	111- 113
I.j.359	222 - 223
I.k.197	65 - 67
I.k.198	77 - 78
I.k.199	165 - 171
I.k.254	169 - 171
I.l,196	239 - 241
I.l.198	131 - 132
I.l.199	134 - 136
I.ad.196	246 - 247
I.ad.198	154 - 155
I.ae.078	166 - 167
I.ae.080	177 - 178
I.ae.198	182 - 183
I.ae.199	123 - 124

Compuesto No.	P.f. (°C)
I.ae.200	126 - 127
I.ai.198	185 - 188
I.aj.078	121 - 122
I.aj.079	107 - 110
I.ak.196	257 - 259
I.ak.198	160 - 161
I.ak.199	129 - 130
I.ak.200	138 - 139
I.am.198	138 - 139
I.aw.198	131 - 132
II.a.040	160 - 162
II.f.040	158 - 159
II.h.040	134 - 136
II.j.040	155 - 156
II.j.096	173 - 175
II.l.040	156 - 158
II.v.040	152 - 155
II.ad.040	129 - 130

Los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden prepararse de acuerdo con los esquemas de reacción mencionados precedentemente, en los

que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es como se definió más arriba para un compuesto de Fórmula (I).

Ejemplos biológicos

Alternaria solani / tomate / prevención (Acción contra Alternaria en el
 5 tomate)

Se trataron plantas de tomate de 4 semanas de edad cv. Roter Gnom con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, las plantas de tomate se inocularon pulverizándolas con una suspensión de esporas. Luego de un periodo de incubación de 4 días a
 10 22°C/18°C y 95% h. r. en un invernadero, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.198, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198,
 15 I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

Botrytis cinerea / tomate / prevención (Acción contra Botrytis en el tomate)

Se trataron plantas de tomate de 4 semanas de edad cv. Roter Gnom con
 20 el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, las plantas de tomate se inocularon pulverizándolas con una suspensión de esporas. Luego de un periodo de incubación de 3 días a 20°C y 95% h. r. en un invernadero, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los
 25 compuestos I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200,

I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

Puccinia recondita / trigo / prevención (Acción contra el royo marrón en el trigo)

Se trataron plantas de trigo de 1 semana de edad cv. Arina con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Un día después de la aplicación, las plantas de trigo se inocularon pulverizándolas con una suspensión de esporas (1×10^5 uredoesporas/ml). Luego de un periodo de incubación de 1 día a 20°C y 95% h. r., las plantas permanecieron 10 días a 20°C/18°C (día/noche) y 60% h. r. en un invernadero. Once días después de la inoculación se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.197, I.a.198, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

Magnaporthe grisea (Pyricularia oryzae) / arroz / prevención (Acción contra añublo del arroz)

Se trataron plantas de arroz de 3 semanas de edad cv. Koshihikari con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, las plantas de arroz se inocularon pulverizándolas con

una suspensión de esporas (1×10^5 conidia/ml). Luego de un periodo de incubación de 6 días a 25°C y 95% h. r., se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.198, I.a.199, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.198, I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

10 Pyrenophora teres (Helminthosporium teres) / cebada / prevención (Acción contra la pústula reticular de la cebada)

Se trataron plantas de cebada de 1 semana de edad cv. Regina con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, las plantas de cebada se inocularon pulverizándolas con una suspensión de esporas ($2,6 \times 10^4$ conidia/ml). Luego de un periodo de incubación de 4 días a 20°C y 95% h. r., se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

20 Septoria tritici / trigo / prevención (Acción contra los puntos Septoria de la hoja del trigo)

25 Se trataron plantas de trigo de 2 semanas de edad cv. Riband con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Un día

después de la aplicación, las plantas de trigo se inocularon pulverizándolas con una suspensión de esporas (10^6 conidia/ml). Luego de un periodo de incubación de 1 día a 22°C/21°C y 95% h.r. las plantas permanecieron a 22°C/21°C y 70% h. r. en un invernadero. Dieciséis a dieciocho días después de la inoculación se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.197, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.j.200, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.197, I.ae.198, I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

Uncinula necator / vid / prevención (Acción contra el mildiú polvoroso de la vid)

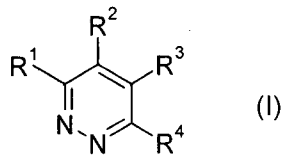
Se trataron retoños de vid de 5 semanas de edad cv. Gutedel con el compuesto de prueba formulado, en una cámara de pulverización. Un día después de la aplicación, las plantas de vid se inocularon agitando por encima de ellas plantas infectadas con el mildiú polvoroso de la vid. Luego de un periodo de incubación de 7 días a 24°C/22°C y 70% h.r. con un régimen de luz de 14/10 h (luz/oscuridad) se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de Fórmula I de acuerdo con la invención, en particular los compuestos I.a.197, I.a.198, I.a.199, I.a.200, I.h.198, I.h.199, I.h.200, I.j.197, I.j.198, I.j.199, I.k.197, I.k.198, I.k.199, I.k.200, I.l.197, I.l.198, I.l.199, I.l.200, I.ae.198, I.ae.199 y I.ae.200 a 200 ppm inhibieron la infestación fúngica en este ensayo hasta por lo menos un 80 %, mientras que en las mismas condiciones, las

plantas control no tratadas se infectaron con los hongos fitopatogénicos más de un 80 %.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula I:



donde

5 R¹ es hidrógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆;

R² es un heteroarilo opcionalmente sustituido;

R³ es un arilo opcionalmente sustituido; y

R⁴ es hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, hidroxí o ciano;

10 o una forma sal del mismo utilizable como agroquímico.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R¹ es alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆.

3. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 donde R² es un furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 15 oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinolinilo o naftiridinilo opcionalmente sustituidos.

20 4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 donde R³ es un fenilo, naftilo, antracenilo, fenantrenilo o bifenilo opcionalmente sustituidos.

5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , hidroxí o ciano.

5 6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 donde

R^1 es alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ;

R^2 es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, benzotiazolilo, quinolilo o quinoxalinilo opcionalmente sustituidos;

10 R^3 es un fenilo, naftilo o bifenilo opcionalmente sustituidos; y

R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o hidroxí.

7. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde

15 R^1 es alquilo C_1-C_6 ;

R^2 es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo o benzofuranilo opcionalmente sustituidos;

R^3 es un fenilo o naftilo opcionalmente sustituidos; y

20 R^4 es halógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_6 o hidroxí.

8. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 donde

R^1 es alquilo C_1-C_3 ;

R^2 es un furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo o pirimidinilo opcionalmente sustituidos;

R^3 es un fenilo opcionalmente sustituido; y

R^4 es flúor, cloro, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 o hidroxí.

5 9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde

R^1 es metilo o etilo;

R^2 es un furilo, tienilo, piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituidos;

R^3 es 2,4,6-trifluorfenilo, 2-cloro-6-fluorfenilo o 2,6-dicloro-4-metoxifenilo; y

10 R^4 es flúor, cloro, metilo, metoxi o hidroxí.

10. Un compuesto seleccionado entre:

3-cloro-5-furan-2-il-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-(5-bromofuran-2-il)-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

15 3-cloro-5-(5-clorotiofen-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-piridin-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-5-(6-cloropiridin-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-piridin-3-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

20 3-cloro-6-metil-5-piridin-4-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-5-(2,6-dicloropiridin-4-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-pirimidin-4-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-cloro-6-metil-5-(2-metilpirimidin-4-il)-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

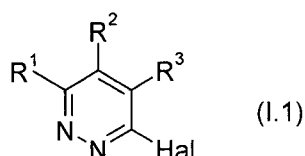
3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,

3-metoxi-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-piridazina,

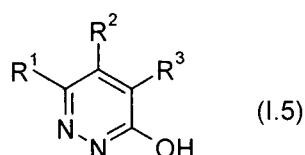
3-fluoro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina, y

5 3,6-dimetil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina.

11. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula I.1,



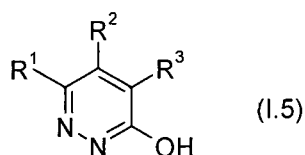
donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I y
Hal es halógeno, que comprende hacer reaccionar un compuesto de Fórmula I.5,



10

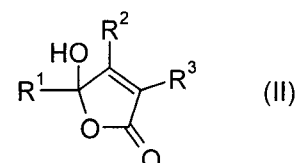
donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I,
con un oxihaluro de fósforo o un haluro de tionilo.

12. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula I.5,



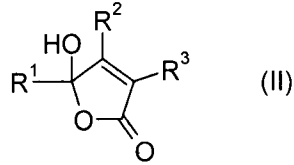
15

donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I,
que comprende hacer reaccionar un compuesto de Fórmula II,

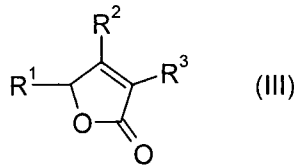


donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I, con un derivado de hidracina.

13. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula II,

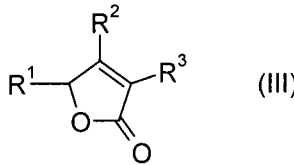


5 donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I, que comprende oxidar un compuesto de Fórmula III,

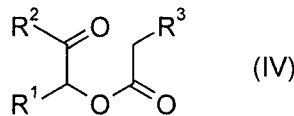


donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I, con oxígeno, aire o ácido 3-cloroperbenzoico.

10 14. Un proceso para la preparación de un compuesto de Fórmula III,



donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I, que comprende hacer reaccionar un compuesto de Fórmula IV,



15 donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define para los compuestos de Fórmula I, con una base.

15. Una composición fungicida para controlar o proteger contra microorganismos fitopatógenicos, que comprende como ingrediente activo por lo

menos un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en forma libre o en forma sal para uso agroquímico, y por lo menos un adyuvante.

16. La composición de acuerdo con la reivindicación 15, que comprende por lo menos un compuesto adicional activo como fungicida, preferiblemente seleccionado del grupo formado por azoles, pirimidinil carbinoles, 2-amino-
5 pirimidinas, morfolinas, anilino pirimidinas, pirroles, fenilamidas, bencimidazoles, dicarboximidas, carboxamidas, estrobilurinas, ditiocarbamatos, N-halometiltiotetrahidroftalimidas, compuestos de cobre, nitrofenoles, derivados organofosfóricos, piridazinas, triazolopirimidinas, carboxamidas o benzamidas.

10 17. El uso de un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 para controlar o prevenir la infestación de plantas, de cultivos para uso alimentario cosechados o de materiales inertes por parte de microorganismos fitopatogénicos.

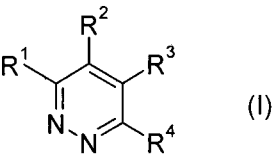
18. Un método para controlar o prevenir la infestación de cultivos, cultivos
15 para uso alimentario cosechados o de materiales inertes por parte de microorganismos u organismos fitopatogénicos o destructivos potencialmente perjudiciales para el hombre, que comprende la aplicación de un compuesto como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, como ingrediente activo en las plantas, en partes de las plantas o en el terreno que ocupan las mismas o en
20 cualquier parte de los materiales inertes.

19. El método de acuerdo con la reivindicación 18, donde los microorganismos fitopatogénicos son organismos fúngicos.

RESUMEN DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a nuevos derivados de piridazina de Fórmula I como ingredientes activos con actividad microbicida, en particular actividad fungicida:

5



donde

R¹ es hidrógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆;

R² es un heteroarilo opcionalmente sustituido;

R³ es un arilo opcionalmente sustituido; y

10 R⁴ es hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, hidroxí o ciano;

o una forma sal del mismo utilizable como agroquímico.

15

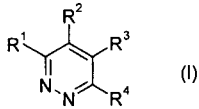

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS
SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION ☐ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ☐ DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(21) N° de solicitud:		(22) Fecha de solicitud:	
(51) Clasificación Internacional :			
(71) Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG			
(72) Inventor(es) STEPHAN TRAH, CLEMENS LAMBERTH, SEBASTIAN VOLKER WENDEBORN			
(74) Apoderado: DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO			
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	0614153.5	17/07/2006	GB
(85) Fecha inicio fase nacional:		(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 24/01/2008	
Fecha de presentación de la solicitud: 16/07/2007		N° publicación: WO 2008/009406 A1	
No. de solicitud PCT/EP2007/006304			
(54) Titulo: NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA			

 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	32) Fecha	(33) País
	0614153.5	17/07/2006	GB
		(72) Inventor(es) STEPHAN TRAH CLEMENS LAMBERTH SEBASTIAN VOLKER WENDEBORN	
		(74) Apoderado: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO	
(85) Fecha limite inicio fase nacional:		(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 24/01/2008	
Fecha de presentación de la solicitud: 16/07/2007		N° publicación: WO 2008/009406 A1	
N° de solicitud PCT/EP2007/006304			
(54) Titulo: NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA			

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de Fórmula I:



donde

- R¹ es hidrógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆;
- R² es un heteroarilo opcionalmente sustituido;
- R³ es un arilo opcionalmente sustituido; y
- R⁴ es hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, hidroxi o ciano; o una forma sal del mismo utilizable como agroquímico.
2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R¹ es alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆ o cicloalquiloC₃-C₆.
3. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 donde R² es un furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, benzotriazinilo, indolilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinolinilo o naftiridinilo opcionalmente sustituidos.
4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 donde R³ es un fenilo, naftilo, antracenilo, fenantrenilo o bifenilo opcionalmente sustituidos.
5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde R⁴ es halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, hidroxi o ciano.
6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 donde
- R¹ es alquiloC₁-C₆ o haloalquiloC₁-C₆;
- R² es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, benzotiazolilo, quinolilo o quinoxalinilo opcionalmente sustituidos;
- R³ es un fenilo, naftilo o bifenilo opcionalmente sustituidos; y
- R⁴ es halógeno, alquiloC₁-C₆, haloalquiloC₁-C₆, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆ o hidroxi.
7. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde

- R¹ es alquiloC₁-C₆;
- R² es un furilo, tienilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo o benzofuranilo opcionalmente sustituidos;
- R³ es un fenilo o naftilo opcionalmente sustituidos; y
- R⁴ es halógeno, alquiloC₁-C₃, alcoxiC₁-C₆ o hidroxi.
8. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 donde
- R¹ es alquiloC₁-C₃;
- R² es un furilo, tienilo, piridilo, piridazinilo o pirimidinilo opcionalmente sustituidos;
- R³ es un fenilo opcionalmente sustituido; y
- R⁴ es flúor, cloro, alquiloC₁-C₃, alcoxiC₁-C₃ o hidroxi.
9. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde
- R¹ es metilo o etilo;
- R² es un furilo, tienilo, piridilo o pirimidinilo opcionalmente sustituidos;
- R³ es 2,4,6-trifluorfenilo, 2-cloro-6-fluorfenilo o 2,6-dicloro-4-metoxifenilo; y
- R⁴ es flúor, cloro, metilo, metoxi o hidroxi.
10. Un compuesto seleccionado entre:
- 3-cloro-5-furan-2-il-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-6-metil-5-(5-bromofuran-2-il)-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-6-metil-5-tiofen-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-5-(5-clorotiofen-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-6-metil-5-piridin-2-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-5-(6-cloropiridin-2-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-6-metil-5-piridin-3-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-6-metil-5-piridin-4-il-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- 3-cloro-5-(2,6-dicloropiridin-4-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)-piridazina,
- ...

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
A B O G A D O S
Carrera 9 No. 93-09
Apartado 6349
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: **“NUEVOS DERIVADOS DE PIRIDAZINA”**.

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/P1701

PRESENTACION PERSONAL Y RECONOCIMIENTO
NOTARIA QUINCE (15) DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.

EL ANTERIOR ESCRITO FUE PRESENTADO
PERSONALMENTE POR SU SIGNATARIO

Ximena Castellanos Abondano

QUIEN SE IDENTIFICO CON LA C.C. No.

39.773 330 DE Usaquen Y

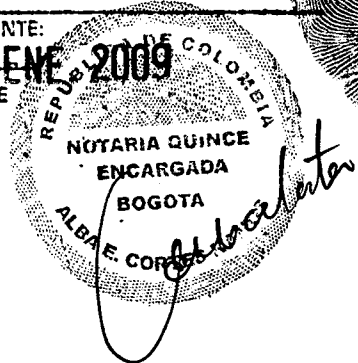
T.P. DE ABOGADO No. 58.236 DEL C.S. de la J.

Y RECONOCE SU CONTENIDO COMO CIERTO.

FIRMACOMPARECIENTE:

FECHA: 16 ENE 2009

EL NOTARIO QUINCE



PRESENTACION PERSONAL Y RECONOCIMIENTO
NOTARIA QUINCE (15) DEL CIRCULO DE BOGOTA, D.C.

EL ANTERIOR ESCRITO FUE PRESENTADO
PERSONALMENTE POR SU SIGNATARIO

Margarita Castellanos Abondano

QUIEN SE IDENTIFICO CON LA C.C. No.

39.779 654 DE Usaquen Y

T.P. DE ABOGADO No. 70.819 DEL C.S. de la J.

Y RECONOCE SU CONTENIDO COMO CIERTO.

FIRMACOMPARECIENTE:

FECHA: 16 ENE 2009

EL NOTARIO QUINCE



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 for 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

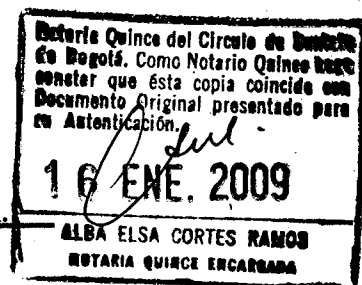
(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization required)

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



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*

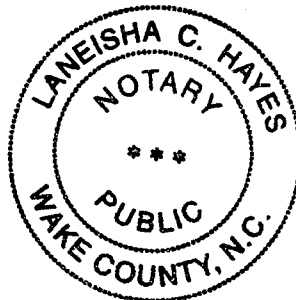
(Ciudad) REsearch Triangle Park

(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

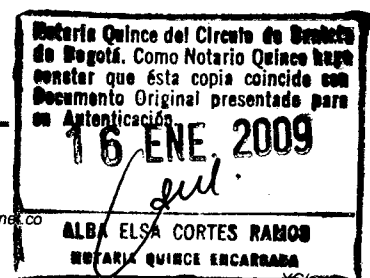
this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public)

Laneisha C. Hayes

*Documents must be identified with date and origin

*3/24/04 - Research Triangle
Park, North Carolina
27709 -
Syngenta Biotech, Inc.*





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.

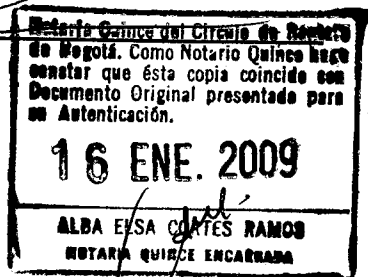
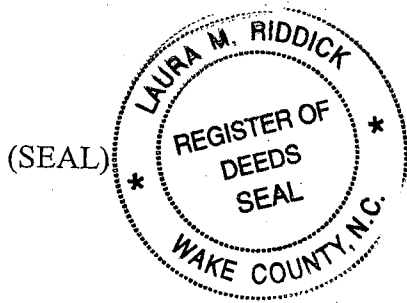
IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.

Laura M. Riddick

REGISTER OF DEEDS

Alba Elsa Cortes Ramos

DEPUTY / ASSISTANT



APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

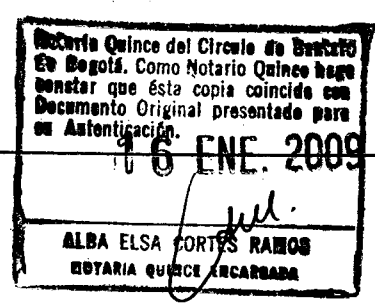
- 1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
- 2. This Public Document has been signed by CARLA N. BROWN
- 3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS
- 4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

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. Medlock



-----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) ilegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

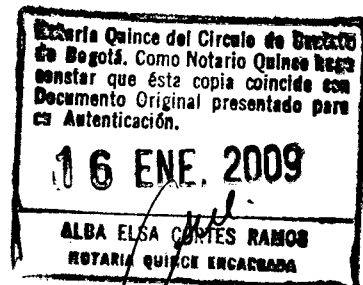
CONDADO DE WAKE

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 dares 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 sello de oficio,
hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible



DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 2755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

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

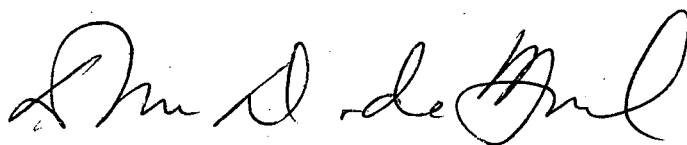
5. En Raleigh. Carolina del Norte
6. el día 1 de Abril de 2004
7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
8. No. 8117
9. Sello: (sello en oblea ocre)

10. Firma

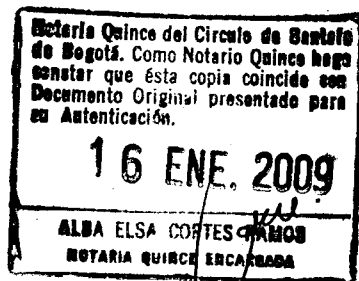
(fdo) Rodney S. Maddox

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



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 4,005
FECHA : ENERO 16 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-003380- -00000-0000

Fecha: 2009-01-16 15:19:42 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 177

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
WARD CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	91404014	16/01/2009	640,000.00

***** CONCEPTO *****

CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 00000-01-01 SOLICITUDES	540,000.00
1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	540,000.00
TOTAL :	\$ 540,000.00

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 4,006
FECHA : ENERO 16 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-003380- -00000-0000

Fecha: 2009-01-16 15:19:42 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 177

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
VARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	91404014	16/01/2009	640,000.00

***** C U N C E R T I D *****

CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
	TOTAL : \$ 100,000.00

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.



Industria y Comercio

S U P I

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-003380- -00000-0000

Delega
Divisi

Fecha: 2009-01-16 15:19:42 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 177

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:

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

REFERENCIA	Radicación No.	9 3380
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/006304
	Fecha inicio fase nacional	17/02/2009
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	3758

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.

2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.

Continúa en la página siguiente...